

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11) 特許出願公開番号

特開2014-5263

(P2014-5263A)

(43) 公開日 平成26年1月16日(2014.1.16)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 401/04 (2006.01)	C07D 401/04 C S P	4 C 0 6 3
A01N 43/90 (2006.01)	A01N 43/90 1 O 4	4 C 0 6 5
A01P 7/02 (2006.01)	A01N 43/90 1 O 3	4 C 0 7 2
A01P 7/04 (2006.01)	A01N 43/90 1 O 2	4 C 0 8 6
C07D 471/04 (2006.01)	A01P 7/02	4 H O 1 1
審査請求 未請求 請求項の数 23 O L (全 245 頁) 最終頁に続く		

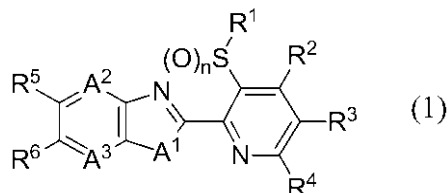
(21) 出願番号	特願2012-171770 (P2012-171770)	(71) 出願人	000002093
(22) 出願日	平成24年8月2日 (2012.8.2)		住友化学株式会社
(31) 優先権主張番号	特願2011-170833 (P2011-170833)		東京都中央区新川二丁目27番1号
(32) 優先日	平成23年8月4日 (2011.8.4)	(74) 代理人	100113000
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		弁理士 中山 亨
(31) 優先権主張番号	特願2012-79323 (P2012-79323)	(74) 代理人	100151909
(32) 優先日	平成24年3月30日 (2012.3.30)		弁理士 坂元 徹
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)	(72) 発明者	▲高▼橋 政樹
(31) 優先権主張番号	特願2012-122837 (P2012-122837)		兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
(32) 優先日	平成24年5月30日 (2012.5.30)	(72) 発明者	田邊 貴将
(33) 優先権主張国	日本国 (JP)		兵庫県宝塚市高司四丁目2番1号 住友化学株式会社内
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途

(57) 【要約】

【課題】 有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物を提供する。

【解決手段】 式 (1)



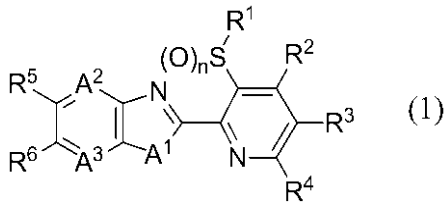
〔式中、 A^1 は $-NR^7-$ 等を表し、 A^2 は窒素原子等を表し、 A^3 は窒素原子等を表し、 R^1 は群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基等を表し、 R^2 、 R^3 及び R^4 は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基等を表し、 R^5 及び R^6 は同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基等を表し、 R^7 は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基等を表し、 n は0、1又は2を表す。〕で示される縮合複素環化合物、又はそのN-オキンドを提供する。該化合物は優れた有害生物防除効果を有する。

【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1)



〔式中、

A¹は-NR⁷、酸素原子又は硫黄原子を表し、A²は窒素原子又は=C R⁸を表し、A³は窒素原子又は=C R⁹を表し、R¹は群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基又は群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基を表し、R²、R³及びR⁴は群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-S(O)₂NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰CO₂R¹¹、-NR¹⁰C(O)R¹¹、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、-C(O)NR¹⁰R¹¹、-SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、R⁵及びR⁶は同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-S(O)₂NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰R¹¹、-NR¹⁰CO₂R¹¹、-NR¹⁰C(O)R¹¹、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、-C(O)NR¹⁰R¹¹、-SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し（ここで、R⁵及びR⁶が同時に水素原子を表すことはない）、R⁷は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個のフェニル基を有するC1-C6鎖式炭化水素基（ここで、該フェニル基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、1個の5もしくは6員複素環基を有するC1-C6鎖式炭化水素基（ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基又は水素原子を表し、R⁸及びR⁹は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-NR¹⁰R¹¹、-CO₂R¹⁰、-C(O)R¹⁰、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、R¹⁰及びR¹¹は同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基又は水素原子を表し、

mは、それぞれ独立して、0、1又は2を表し、nは0、1又は2を表す。

ここで、-S(O)_mR¹⁰において、mが1又は2の場合には、R¹⁰が水素原子を表すことはない。

群X：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC

1-C6アルキルスルホニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシカルボニル基、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群Y：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニルオキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群Z：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルホニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシカルボニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルアミノ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C8ジアルキルアミノ基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群。

群W：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルファニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキルカルボニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシカルボニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルフィニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルホニル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【請求項2】

A¹が-NR⁷-、酸素原子又は硫黄原子であり

A²が窒素原子又は=C R⁸-であり、

A³が窒素原子又は=C R⁹-であり、

R¹が群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、

R²、R³及びR⁴が同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R⁵及びR⁶が同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、-SF₅、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R⁷が群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個のフェニル基を有するC1-C6鎖式炭化水素基（ここで、該フェニル基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、1個の5もしくは6員複素環基を有するC1-C6鎖式炭化水素基（ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、又は水素原子であり、

R⁸が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、-OR¹⁰、-S(O)_mR¹⁰、ハロゲン原子又は水素原子であり、

10

20

30

40

50

R^9 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である請求項1記載の化合物。

【請求項3】

A^1 が $-NR^7-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり

A^2 が窒素原子又は $=CR^8-$ であり、

A^3 が窒素原子又は $=CR^9-$ であり、

R^1 が、ハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい）、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基であり、

R^2 及び R^4 が、同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^3 が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）

、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^5 が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子であり、

R^6 が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{10} が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、

R^7 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）

、水素原子又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシアルキル基であり、

R^8 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^9 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である請求項1記載の化合物。

【請求項4】

A^1 が $-NR^7-$ である請求項1～3いずれか一項記載の化合物。

【請求項5】

A^1 が酸素原子である請求項1～3いずれか一項記載の化合物。

【請求項6】

A^1 が硫黄原子である請求項1～3いずれか一項記載の化合物。

【請求項7】

A^2 が $=CR^8-$ である請求項1～6いずれか一項記載の化合物。

【請求項8】

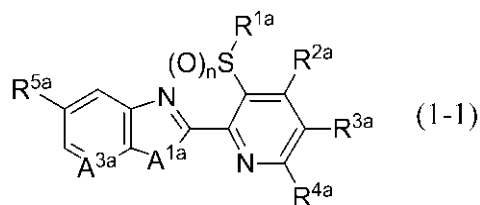
A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である請求項1～6いずれか一項記載の化合物。

【請求項9】

A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である請求項1～6いずれか一項記載の化合物。

【請求項10】

式 (1-1)



〔式中、

A^{1a}は-NR^{7a}、酸素原子又は硫黄原子を表し、A^{3a}は窒素原子又は=C R^{9a}を表し、

R^{1a}はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい）、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基を表し、

R^{2a}及びR^{4a}は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、-OR^{20a}（ここで、R^{20a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、-S(O)_mR^{21a}（ここで、R^{21a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、-OR^{22a}（ここで、R^{22a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、-S(O)_mR^{23a}（ここで、R^{23a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。）、-SF₅又はハロゲン原子を表し、

R^{7a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、

R^{9a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、-OR^{24a}（ここで、R^{24a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、-S(O)_mR^{25a}（ここで、R^{25a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

nは0、1又は2を表す。〕で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【請求項11】

A^{1a}が-NR^{7a}、酸素原子又は硫黄原子であり、A^{3a}が窒素原子又は=C R^{9a}であり、

R^{1a}が、C2-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基又はC4-C9シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい。）であり、

R^{2a} 及び R^{4a} が、ともに水素原子であり、

R^{3a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニル基、ピリジル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、ピリミジニル基（ここで該ピリミジニル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である。）、 $-S(O)_m R^{21a}$ （ここで、 R^{21a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基であり、 m は 0、1 又は 2 である。）、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{5a} が C 1－C 6 ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} が C 1－C 6 ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_m R^{23a}$ （ここで、 R^{23a} が C 1－C 6 ハロアルキル基であり、 m が 0、1 又は 2 である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子であり、

R^{7a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルキニル基、1 個のチアゾリル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで該チアゾリル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）又は 1 個のピリジル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）である請求項 10 記載の化合物。

【請求項 12】

A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である請求項 10 又は 11 記載の化合物。

【請求項 13】

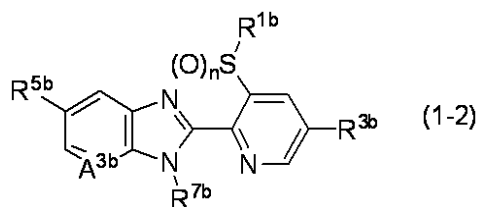
A^{1a} が酸素原子である請求項 10 又は 11 記載の化合物。

【請求項 14】

A^{1a} が硫黄原子である請求項 10 又は 11 記載の化合物。

【請求項 15】

式 (1-2)



[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{7b} はメチル基又はプロパルギル基を表し、

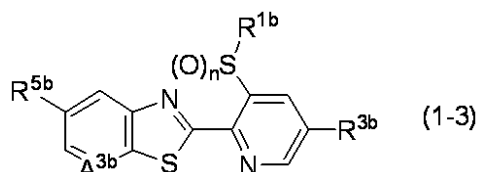
R^{3b} は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、ハロゲン原子又は水素

原子を表し、

R^{5b} は、C 1－C 6 ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC 1－C 6 ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC 1－C 6 ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。] で示される化合物、又はそのN－オキシド。

【請求項 1 6】

式（1－3）



10

[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

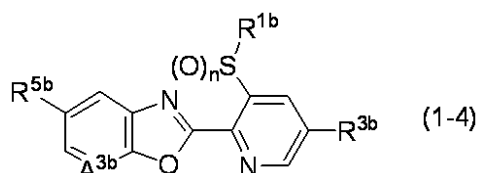
R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

20

R^{5b} は、C 1－C 6 ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC 1－C 6 ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC 1－C 6 ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。] で示される化合物、又はそのN－オキシド。

【請求項 1 7】

式（1－4）



30

[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

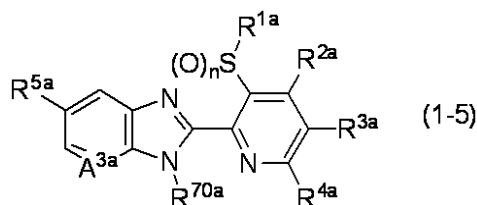
R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

40

R^{5b} は、C 1－C 6 ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC 1－C 6 ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC 1－C 6 ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。] で示される化合物、又はそのN－オキシド。

【請求項 1 8】

式（1－5）



[式中、

R^{70a} は水素原子又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシアルキル基を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{1a} はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい）、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

n は0、1又は2を表す。]で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【請求項19】

請求項1～請求項18いずれか一項記載の化合物と、不活性担体とを含有する有害生物防除組成物。

【請求項20】

請求項1～請求項18いずれか一項記載の化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する有害生物の防除方法。

【請求項21】

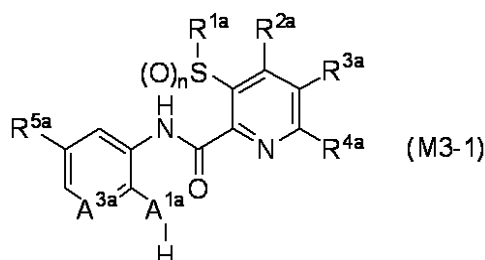
式(M3-1)

10

20

30

40



[式中、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{1a} はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい）、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基、5 もしくは 6 員芳香族複素環基（ここで該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

R^{7a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、又は 1 個の 5 もしくは 6 員芳香族複素環基を有する C 1 - C 6 アルキル基（ここで、該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、

R^{9a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

n は 0、1 又は 2 を表す。]

で示される化合物、又はその N - オキシド；

【請求項 22】

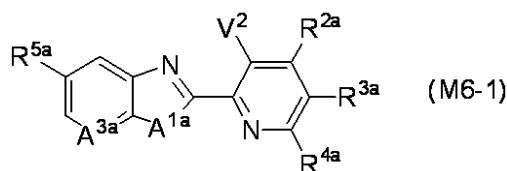
式 (M6-1)

10

20

30

40



[式中、

V^2 はハロゲン原子を表し、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

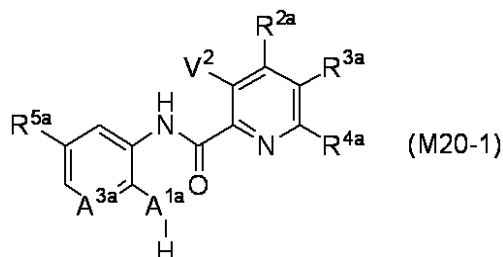
R^{7a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、

R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド；

【請求項23】

式(M20-1)



[式中、

V^2 はハロゲン原子を表し、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=C R^{9a}-$ を表し、
 R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、
 R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、
 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、
 $-S(O)_m R^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、
 R^{5a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、
 $-S(O)_m R^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、
 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、
 R^{7a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、
 R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、
 $-S(O)_m R^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表す。]

10

20

30

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、ある種の縮合複素環化合物及びその有害生物防除用途に関する。

【背景技術】

【0002】

これまでに有害生物の防除を目的として、様々な化合物が検討されており、実用に供されている。

また、ある種の縮合複素環化合物（例えば特許文献1参照）が知られている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】特開2004-34438号公報

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、有害生物に対して優れた防除効力を有する化合物及びその化合物を用いた有害生物の防除方法を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0005】

40

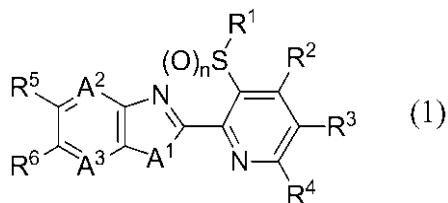
50

本発明者等は上記の課題を解決すべく鋭意検討した結果、下記式(1)で示される縮合複素環化合物が有害生物に対して優れた防除効力を有することを見出し、本発明に至った。

【0006】

本発明は、以下のものである。

[1] 式(1)



10

[式中、

A^1 は $-NR^7-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^2 は窒素原子又は $=CR^8-$ を表し、

A^3 は窒素原子又は $=CR^9-$ を表し、

R^1 は群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基又は群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基を表し、

R^2 、 R^3 及び R^4 は群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}CO_2R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

20

R^5 及び R^6 は同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5もしくは6員複素環基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}CO_2R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し(ここで、 R^5 及び R^6 が同時に水素原子を表すことはない)、

30

R^7 は群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個のフェニル基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該フェニル基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい)、1個の5もしくは6員複素環基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい)、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基又は水素原子を表し、

R^8 及び R^9 は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

40

R^{10} 及び R^{11} は同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基又は水素原子を表し、

m は、それぞれ独立して、0、1又は2を表し、 n は0、1又は2を表す。

ここで、 $-S(O)_mR^{10}$ において、 m が1又は2の場合には、 R^{10} が水素原子を表すことはない。

群X：1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原

50

子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニルオキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルファニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルホニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキルカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1－C 3 アルキル基を有していてもよい C 3－C 6 シクロアルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群 Y：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニルオキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニルオキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群 Z：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルファニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルホニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキルカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルアミノ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 8 ジアルキルアミノ基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群。

群 W：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニルオキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニルオキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルファニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキルカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 シクロアルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルホニル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。]

で示される縮合複素環化合物、又はその N－オキシド（以下、式（1）で示される縮合複素環化合物およびその N－オキシドを本発明化合物と記す）。

[2]

A¹が－NR⁷－、酸素原子又は硫黄原子であり

A²が窒素原子又は＝CR⁸－であり、

A³が窒素原子又は＝CR⁹－であり、

R¹が群 X より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基であり、

R²、R³及び R⁴が同一又は相異なり、群 X より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい 5 もしくは 6 員複素環基、－OR¹⁰、－S(O)_mR¹⁰、－SF₅、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R⁵及び R⁶が同一又は相異なり、群 X より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、－OR¹⁰、－S(O)_mR¹⁰、－SF₅、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R⁷が群 W より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個のフェニル基を有する C 1－C 6 鎖式炭化水素基（ここで、該フェニル基は、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、1 個の 5 もしくは 6 員複素環基を有する C 1－C 6 鎖式炭化水素基（ここで、該 5 もしくは 6 員複素環基

10

20

30

40

50

は、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい)、又は水素原子であり、

R^8 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^9 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である [1] 記載の化合物。

[3]

A^1 が $-NR^7-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり

A^2 が窒素原子又は $=CR^8-$ であり、

A^3 が窒素原子又は $=CR^9-$ であり、

R^1 が、ハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基 (ここで、該シクロプロピル基は 1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい)、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基であり、

R^2 及び R^4 が、同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^3 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基、5 もしくは 6 員芳香族複素環基 (ここで該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。)、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^5 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子であり、

R^6 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{10} が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、

R^7 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、1 個の 5 もしくは 6 員芳香族複素環基を有する C 1 - C 6 アルキル基 (ここで、該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。)、水素原子又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルコシアルキル基であり、

R^8 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^9 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である [1] 記載の化合物。

[4]

A^1 が $-NR^7-$ である [1] ~ [3] 記載の化合物。

[5]

A^1 が酸素原子である [1] ~ [3] 記載の化合物。

[6]

A^1 が硫黄原子である [1] ~ [3] 記載の化合物。

[7]

A^2 が $=CR^8-$ である [1] ~ [6] 記載の化合物。

[8]

10

20

30

40

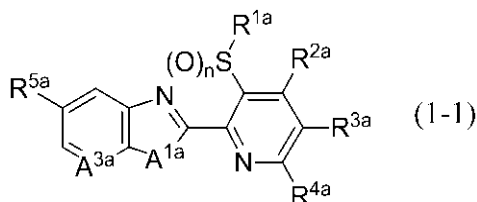
50

A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である〔1〕～〔6〕記載の化合物。

〔9〕

A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である〔1〕～〔6〕記載の化合物。

〔10〕 式(1-1)



10

〔式中、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{1a} はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい）、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基を表し、

20

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

30

R^{5a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

R^{7a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、

40

R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

n は0、1又は2を表す。〕で示される化合物、又はそのN-オキシド。

〔11〕

A^{1a} が $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり、

50

A^{3a} が窒素原子又は $=C R^{9a}-$ であり、
 R^{1a} が、C 2-C 6アルキル基、C 1-C 6ハロアルキル基又はC 4-C 9シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC 1-C 3アルキル基を有していてもよい。）であり、
 R^{2a} 及び R^{4a} が、ともに水素原子であり、
 R^{3a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2-C 6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2-C 6アルキニル基、ピリジル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、ピリミジニル基（ここで該ピリミジニル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 6アルキル基である。）、
 $-S(O)_m R^{21a}$ （ここで、 R^{21a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 6アルキル基であり、 m は0、1又は2である。）、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{5a} がC 1-C 6ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がC 1-C 6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_m R^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がC 1-C 6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子であり、

R^{7a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3-C 6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3-C 6アルキニル基、1個のチアゾリル基を有するC 1-C 6アルキル基（ここで該チアゾリル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）又は1個のピリジル基を有するC 1-C 6アルキル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1-C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）である〔10〕記載の化合物。

〔12〕

A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である〔10〕又は〔11〕記載の化合物。

〔13〕

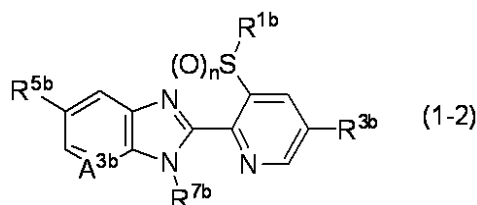
A^{1a} が酸素原子である〔10〕又は〔11〕記載の化合物。

〔14〕

A^{1a} が硫黄原子である〔10〕又は〔11〕記載の化合物。

〔15〕

式（1-2）



〔式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=C R^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{7b} はメチル基又はプロパルギル基を表し、

R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

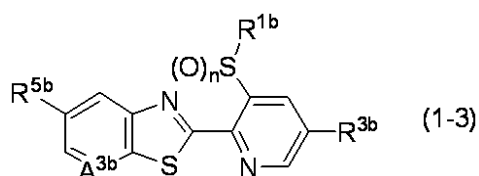
R^{5b} は、C1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC1-C6ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC1-C6ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

10

[16]

式(1-3)



[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

20

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

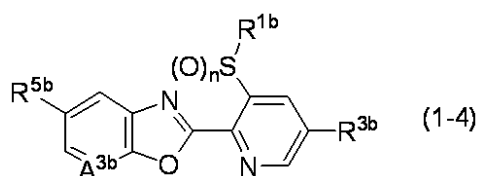
R^{5b} は、C1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC1-C6ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC1-C6ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。]

30

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

[17]

式(1-4)



[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

40

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5b} は、C1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC1-C6ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC1-C6ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

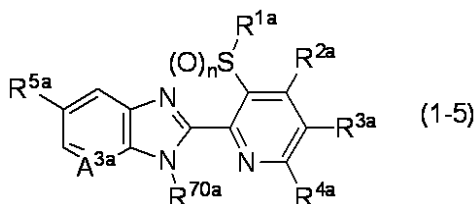
50

n は 0、1 又は 2 を表す。]

で示される化合物、又はその N-オキシド。

[1 8]

式 (1 - 5)



10

[式中、

R^{70a} は水素原子又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルコキシアルキル基を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=C R^{9a}-$ を表し、

R^{1a} はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい）、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

20

R^{3a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2 - C 6 アルキニル基、5 もしくは 6 員芳香族複素環基（ここで該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、m は 0、1 又は 2 を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

30

R^{5a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、m は 0、1 又は 2 を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

R^{9a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基を表し、m は 0、1 又は 2 を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

40

n は 0、1 又は 2 を表す。]

で示される化合物、又はその N-オキシド。

[1 9]

[1] ~ [1 8] いずれかに記載の化合物と、不活性担体とを含有する有害生物防除組成物。

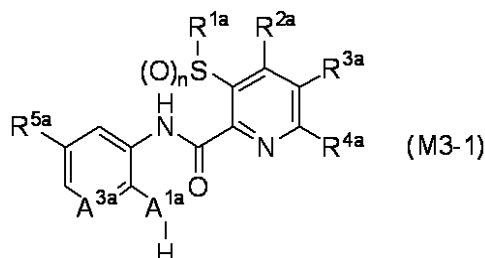
[2 0]

[1] ~ [1 8] いずれかに記載の化合物の有効量を有害生物又は有害生物の生息場所に施用する有害生物の防除方法。

[2 1]

式 (M 3 - 1)

50



[式中、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{1a} はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C1-C6 アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C1-C3 アルキル基を有していてもよい）、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C2-C6 アルケニル基又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C2-C6 アルキニル基を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C2-C6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C2-C6 アルキニル基、5 もしくは 6 員芳香族複素環基（ここで該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

R^{7a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C3-C6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C3-C6 アルキニル基、又は 1 個の 5 もしくは 6 員芳香族複素環基を有する C1-C6 アルキル基（ここで、該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、

R^{9a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C1-C6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

n は 0、1 又は 2 を表す。]

で示される化合物、又はその N-オキシド。

[22]

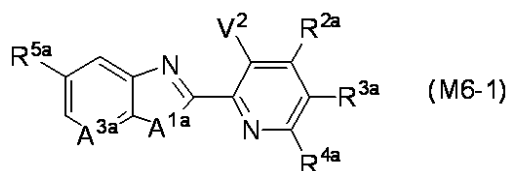
式 (M6-1)

10

20

30

40



[式中、

V^2 はハロゲン原子を表し、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

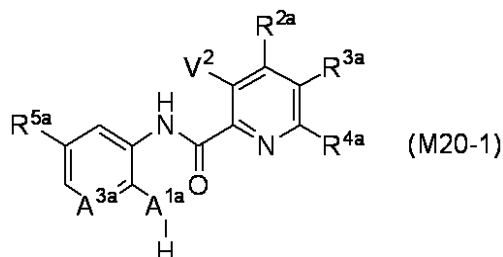
R^{7a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、

R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

[2 3]

式 (M20-1)



[式中、

V^2 はハロゲン原子を表し、

A^{1a} は $-NR^{7a}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=C R^{9a}-$ を表し、
 R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、
 R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）、
 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、
 R^{5a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{23a}$ （ここで、 R^{23a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、
 R^{7a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6アルキニル基、又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC1-C6アルキル基（ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。）を表し、
 R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{24a}$ （ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_m R^{25a}$ （ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【発明の効果】

【0007】

本発明化合物は、有害生物に対して優れた防除活性を有することから、有害生物防除剤の有効成分として有用である。

【発明を実施するための形態】

【0008】

本発明化合物において、N-オキシドとは、複素環基上の環を構成する窒素原子が酸化された化合物である。N-オキシドを形成しうる複素環基としては、例えばピリジン環が挙げられる。

【0009】

本明細書の記載において用いられる基について、例を挙げて以下に説明する。

【0010】

本明細書におけるC_a~C_b鎖式炭化水素基の表記は、炭素原子数がa~bである直鎖状又は分岐鎖状の飽和又は不飽和炭化水素基を表し、

C_a~C_bアルキル基の表記は、炭素原子数がa~bである直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、

C_a~C_bアルケニル基の表記は、炭素原子数がa~bである直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、

C_a~C_bアルキニル基の表記は、炭素原子数がa~bである直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有する不飽和炭化水素基を表し、

C a ~ C b ハロアルキル基の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって1個以上置換された、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、

C a ~ C b アルコキシ基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-O-基を表し、

C a ~ C b アルケニルオキシ基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の二重結合を有するアルケニル-O-基を表し、

C a ~ C b アルキニルオキシ基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状で、且つ分子内に1個又は2個以上の三重結合を有するアルキニル-O-基を表し、

C a ~ C b アルキルスルファニル基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S-基を表し、

C a ~ C b アルキルスルフィニル基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(O)-基を表し、

C a ~ C b アルキルスルホニル基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-S(O)₂-基を表し、

C a ~ C b アルキルカルボニル基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-C(O)-基を表し、

C a ~ C b アルコキシカルボニル基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-O-C(O)-基を表し、

C a ~ C b 脂環式炭化水素基の表記は、炭素原子数がa ~ bである環状の非芳香族炭化水素基を表し、

C a ~ C b シクロアルキル基の表記は、炭素原子数がa ~ bである環状のアルキル基を表し、

C a ~ C b アルキルアミノ基の表記は、炭素原子数がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-NH-基を表し、

C a ~ C b ジアルキルアミノ基の表記は、それぞれアルキル基の炭素原子数が同一又は異なっている場合、それぞれの炭素原子数の総和がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のジアルキルアミノ基を表し、

C a ~ C b アルコキシアルキル基の表記は、それぞれアルキル基の炭素原子数が同一又は異なっている場合、それぞれの炭素原子数の総和がa ~ bである直鎖状又は分岐鎖状のアルキル-O-アルキル基を表す。

【0011】

本明細書における「群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有している場合」の表記は、群Xより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Xより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、

本明細書における「群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有している場合」の表記は、群Yより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Yより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、

本明細書における「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有している場合」の表記は、群Zより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Zより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、

本明細書における「群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有している場合」の表記は、群Wより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、

本明細書における「1個以上のハロゲン原子を有している場合」の表記は、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、

【0012】

本発明化合物において、「ハロゲン原子」とはフッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ

10

20

30

40

50

素原子を意味する。

【0013】

本発明化合物において「群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Xより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が1~6個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、群Xより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Xより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、ブチルオキシメチル基、sec-ブチルオキシメチル基、tert-ブチルオキシメチル基、2-メトキシエチル基、2-エトキシエチル基、2-プロピルオキシエチル基、2-イソプロピルオキシエチル基、2-ブチルオキシエチル基、2-sec-ブチルオキシエチル基、2-tert-ブチルオキシエチル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2-トリフルオロエチル基及びペンタフルオロエチル基、メチルスルファニルエチル基、エチルスルファニルエチル基、メチルスルフィニルエチル基、メチルスルホニルエチル基、2-ヒドロキシエチル基、シクロプロピルメチル基、1-メチルシクロプロピルメチル基、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル基等の群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1,1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルケニル基；

エチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基等の群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルキニル基が挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0014】

本発明化合物において「群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Yより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換された、炭素原子数が3~6個よりなる環状の非芳香族炭化水素基を表し、このとき、群Yより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Yより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基」としては、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基シクロヘキシル基、1-シクロヘキセニル基、2-シクロヘキセニル基、3-シクロヘキセニル基、1-メチルシクロヘキシル基、2-メチルシクロヘキシル基、3-メチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシル基、2-メトキシシクロヘキシル基、3-メトキシシクロヘキシル基、4-メトキシシクロヘキシル基、1-フルオロシクロヘキシル基、2-フルオロシクロヘキシル基、3-フルオロシクロヘキシル基、4-フルオロシクロヘキシル基が挙げられる。

【0015】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって任意に置換された、炭素原子数が1~6個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又

10

20

30

40

50

は互いに相異なっているもよい。

「1個以上のハロゲン原子を有しているもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基及びペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基等の1個以上のハロゲン原子を有しているもよいC1-C6アルキル基；ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1,1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の1個以上のハロゲン原子を有しているもよいC2-C6アルケニル基；エチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4,4,4-トリフルオロ-2-ブチニル基等の1個以上のハロゲン原子を有しているもよいC2-C6アルキニル基が挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

20

30

40

50

【0016】

本発明化合物において「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有しているもよいフェニル基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が群Zより選ばれる原子もしくは基によって任意に置換されたフェニル基を表し、このとき、群Zより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Zより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっているもよい。

「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有しているもよいフェニル基」としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,5-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、3-トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、4-トリフルオロメチルスルファニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、4-ニトロフェニル基、4-シアノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルスルフィニルフェニル基、4-メチルスルホニルフェニル基、4-アセチルフェニル基及び4-メトキシカルボニルフェニル基が挙げられる。

【0017】

本発明化合物において「複素環基」とは、環構造において、炭素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子を1個以上含む複素環化合物残基を表す。

また、本発明化合物において、5員複素環基とは、5員芳香族複素環基又は5員非芳香族複素環基を意味し、6員複素環基とは、6員芳香族複素環基又は6員非芳香族複素環基を意味する。

【0018】

本発明化合物において「群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有しているもよい5もしくは6員複素環基」における「複素環基」とは、環構造において炭素原子以外に、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子を1個以上含む複素環化合物残基を表し、このとき、群Zより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Zより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっているもよい。

また、本発明化合物において、5もしくは6員複素環基とは、5もしくは6員芳香族複素

「群乙より選ばれる１個以上の原子もしくは基を有していてもよい５もしくは６員複素環基」としては、例えばピロリジン－１－イル基、３，３，４，４－テトラフルオロピロリジン－１－イル基、テトラヒドロフラン－２－イル基、ピペリジル基、モルフォリル基及びチオモルフォリル基等の群乙より選ばれる１個以上の原子もしくは基を有していてもよい５もしくは６員非芳香族複素環基；

20

30

40

50

有していてもよい。)」としては、例えばチアゾール-5-イルメチル基、2-クロロチアゾール-5-イルメチル基、ピリジン-3-イルメチル基、6-クロロピリジン-3-イルメチル基及び6-トリフルオロメチルピリジン-3-イルメチル基が挙げられる。

【0022】

本発明化合物において「5もしくは6員芳香族複素環基(ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい。)」としては、例えば2-ピロリル基、2-フリル基、3-フリル基、5-ピラゾリル基、4-ピラゾリル基、1-ピロリル基、1-メチル-2-ピロリル基、5-プロモ-2-フリル基、5-メトキシ-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、2, 5-ジメチル-3-フリル基、2, 4-ジメチル-3-フリル基、5-メチル-2-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル基、5-クロロ-1, 3-ジメチル-4-ピラゾリル基、ピラゾール-1-イル基、3-クロロ-ピラゾール-1-イル基、3-プロモピラゾール-1-イル基、4-クロロピラゾール-1-イル基、4-プロモピラゾール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、3-クロロ-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1, 2, 3, 4-テトラゾール-1-イル基、1, 2, 3, 5-テトラゾール-1-イル基、2-チエニル基、3-チエニル基、3-トリフルオロメチル-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、4-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル基、ピラジニル基、4-ピリミジニル基、5-ピリミジニル基、2-ピリジニル基、3-ピリジニル基、4-ピリジニル基、3-フルオロ-2-ピリジニル基、4-フルオロ-2-ピリジニル基、5-フルオロ-2-ピリジニル基、6-フルオロ-2-ピリジニル基、2-ピリミジニル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基等々が挙げられる。

10

20

【0023】

本発明化合物において「ハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい)」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、1-シクロプロピルエチル基及び1-メチルシクロプロピルメチル基等々が挙げられる。

30

【0024】

本発明化合物において「群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロピルオキシメチル基、イソプロピルオキシメチル基、ブチルオキシメチル基、sec-ブチルオキシメチル基、イソブチルオキシメチル基、tert-ブチルオキシメチル基、メトキシエチル基、エトキシエチル基、プロピルオキシエチル基、イソプロピルオキシエチル基、ブチルオキシエチル基、sec-ブチルオキシエチル基、イソブチルオキシエチル基、tert-ブチルオキシエチル基、メチルスルファニルエチル基、エチルスルファニルエチル基、メチルスルフィニルエチル基、メチルスルホニルエチル基、メトキシカルボニルメチル基、メトキシカルボニルエチル基、2-シアノエチル基、2-オキソプロピル基、シクロプロピル

40

50

メチル基及びシクロヘキシルメチル基等の群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基；

ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1, 1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等の群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルケニル基；

エチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基等の群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC2-C6アルキニル基が挙げられる。このとき、群Wより選ばれる2個以上の原子もしくは基を有している場合、それらの群Wより選ばれる原子もしくは基は互いに同一でも、又は互いに相異なっている場合、それらの群Wより

10

【0025】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基」としては、例えばメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、エトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、sec-ブチルオキシ基、tert-ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基及びヘキシルオキシ基が挙げられる。

【0026】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニルオキシ基」としては、例えば2-プロペニルオキシ基、2-メチル-2-プロペニルオキシ基、2-ブテニルオキシ基、3-ブテニルオキシ基、2-ペンテニルオキシ基、2-ヘキセニルオキシ基、3, 3-ジフルオロアリルオキシ基及び3, 3-ジクロロアリルオキシ基が挙げられる。

20

【0027】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニルオキシ基」としては、例えばプロパルギルオキシ基、2-ブチニルオキシ基、3-ブチニルオキシ基、2-ペンチニルオキシ基、2-ヘキシニルオキシ基及び4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニルオキシ基が挙げられる。

【0028】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルファニル基」としては、例えばメチルスルファニル基、エチルスルファニル基、プロピルスルファニル基、イソプロピルスルファニル基、ブチルスルファニル基、ペンチルスルファニル基、ヘキシルスルファニル基、トリフルオロメチルスルファニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルファニル基及びペンタフルオロエチルスルファニル基が挙げられる。

30

【0029】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルフィニル基」としては、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、ペンチルスルフィニル基、ヘキシルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィニル基及びペンタフルオロエチルスルフィニル基が挙げられる。

40

【0030】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルスルホニル基」としては、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニル基及びペンタフルオロエチルスルホニル基が挙げられる。

【0031】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキル

50

カルボニル基」としては、例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基及びトリフルオロアセチル基が挙げられる。

【0032】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシカルボニル基」としては、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、ブチルオキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、tert-ブチルオキシカルボニル基及び2,2,2-トリフルオロエチルオキシカルボニル基が挙げられる。

【0033】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキルアミノ基」としては、例えばメチルアミノ基、エチルアミノ基、2,2,2-トリフルオロエチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基及びブチルアミノ基が挙げられる。

10

【0034】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C8ジアルキルアミノ基」としては、例えばジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ビス(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ基及びジプロピルアミノ基が挙げられる。

【0035】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、2,2-ジフルオロシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

20

【0036】

本発明化合物において「1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよいC3-C6シクロアルキル基」としては、例えばシクロプロピル基、1-メチルシクロプロピル基、2-メチルシクロプロピル基、1-フルオロシクロプロピル基、2,2-ジフルオロシクロプロピル基、2,2-ジクロロシクロプロピル基、2,2-ジブromoシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基及びシクロヘキシル基が挙げられる。

【0037】

本発明化合物において「C2-C6アルキル基」としては、例えばエチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基及びヘキシル基等が挙げられる。

30

【0038】

本発明化合物において「C1-C6ハロアルキル基」の表記は、炭素原子に結合した水素原子がハロゲン原子によって1個以上置換された、炭素原子数が1~6個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子を有している場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、又は互いに相異なってもよい。

「C1-C6ハロアルキル基」としては、例えばフルオロメチル基、クロロメチル基、ブromoメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブromoジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブromoエチル基、2,2-ジフルオロエチル基、2,2,2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

40

【0039】

本発明化合物において「C4-C9シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい。）」として、例えばシクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、1-シクロプロピルエチル基及び1-メチルシクロプロピル基等が挙げられる。

【0040】

50

本発明化合物において「C 1－C 6 パーフルオロアルキル基」としては、例えばトリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

【0041】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6 アルキル基」としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、ブロモジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、2-フルオロエチル基、2-クロロエチル基、2-ブロモエチル基、2, 2-ジフルオロエチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロプロピル基及びヘプタフルオロイソプロピル基等が挙げられる。

10

【0042】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6 アルケニル基」としては、例えばビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1, 1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等が挙げられる。

20

【0043】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6 アルキニル基」としては、例えばエチニル基、プロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基等が挙げられる。

30

【0044】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6 アルケニル基」としては、例えば1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-メチルビニル基、2-メチル-1-プロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブテニル基、1-ペンテニル基、1-ヘキセニル基、1, 1-ジフルオロアリル基、ペンタフルオロアリル基等が挙げられる。

40

【0045】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6 アルキニル基」としては、例えばプロパルギル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、1-ペンチニル基、1-ヘキシニル基及び4, 4, 4-トリフルオロ-2-ブチニル基等が挙げられる。

【0046】

本発明化合物において「1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6 アルコキシアルキル基」としては、例えばメトキシメチル基、エトキシメチル基、1-(メトキシ)エチル基、2-(メトキシ)エチル基、1-(エトキシ)エチル基、2-(エトキシ)エチル基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシメチル基等が挙げられる。

50

【0047】

本発明化合物において「ピリジル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）」として、例えば2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基等が挙げられる。

【0048】

本発明化合物において「ピリミジニル基（ここで該ピリミジニル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロ

50

ゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)」としては、例えば2－ピリミジニル基、4－ピリミジニル基、5－ピリミジニル基、2－クロロ－4－ピリミジニル基等が挙げられる。

【0049】

本発明化合物において「1個のチアゾリル基を有するC 1－C 6アルキル基（ここで該チアゾリル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)」としては、例えば（チアゾール－5－イル）メチル基、（2－クロロチアゾール－5－イル）メチル基、1－（2－クロロチアゾール－5－イル）エチル基等が挙げられる。

10

【0050】

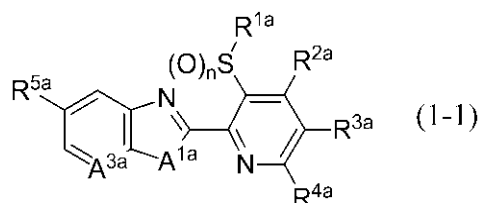
本発明化合物において「1個のピリジル基を有するC 1－C 6アルキル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)」としては、例えば（ピリジン－5－イル）メチル基、（2－クロロピリジン－5－イル）メチル基、1－（2－クロロピリジン－5－イル）エチル基、（2－トリフルオロメチルピリジン－5－イル）メチル基等が挙げられる。

20

【0051】

本発明化合物としては、例えば、以下の化合物が挙げられる。

式（1－1）



[式中、

A^{1a}は－NR^{7a}－、酸素原子又は硫黄原子を表し、

30

A^{3a}は窒素原子又は＝CR^{9a}－を表し、

R^{1a}はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC 1－C 6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC 1－C 3アルキル基を有していてもよい）、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルキニル基を表し、

R^{2a}及びR^{4a}は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 2－C 6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基（ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）

40

）、－OR^{20a}（ここで、R^{20a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表す。）、－S（O）_mR^{21a}（ここで、R^{21a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、－OR^{22a}（ここで、R^{22a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表す。）、－S（O）_mR^{23a}（ここで、R^{23a}は1個以上のハロゲン原子を有していてもよ

50

いC 1－C 6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。)、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

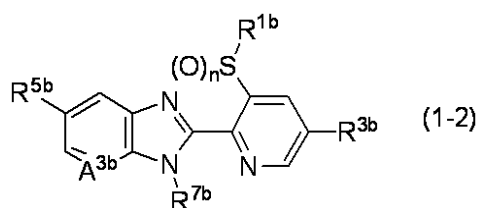
R^{7a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6アルキニル基又は1個の5もしくは6員芳香族複素環基を有するC 1－C 6アルキル基(ここで、該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)を表し、

R^{9a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、 $-OR^{24a}$ (ここで、 R^{24a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表す。)、 $-S(O)_mR^{25a}$ (ここで、 R^{25a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。)、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

nは0、1又は2を表す。]で示される化合物、又はそのN－オキシド。

【0052】

式(1-2)



[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ (ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。)を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{7b} はメチル基又はプロパルギル基を表し、

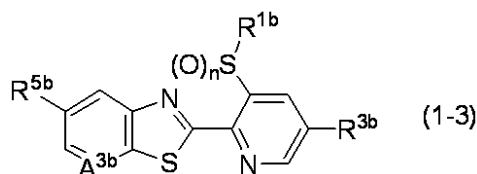
R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、 $-OR^{20b}$ (ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表す。)、 $-S(O)_mR^{21b}$ (ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。)、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5b} は、C 1－C 6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} はC 1－C 6ハロアルキル基を表す。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} はC 1－C 6ハロアルキル基を表し、mは0、1又は2を表す。)、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

nは0、1又は2を表す。]で示される化合物、又はそのN－オキシド。

【0053】

式(1-3)



[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ (ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。)を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

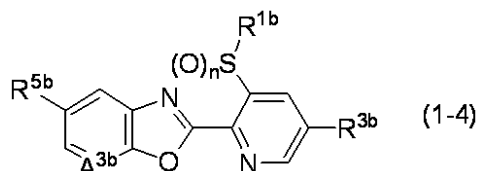
R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、 $-OR^{20b}$ (ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基を

表す。) 、 $-S(O)_m R^{21b}$ (ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。) 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5b} は、C1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} はC1-C6ハロアルキル基を表す。) 、 $-S(O)_m R^{23b}$ (ここで、 R^{23b} はC1-C6ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。) 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。] で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【0054】

式(1-4)



[式中、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ (ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。) を表し、

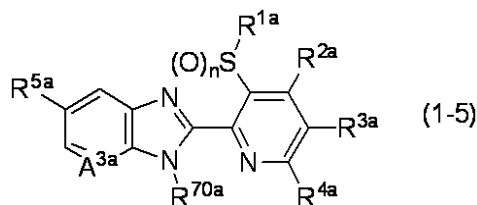
R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{20b}$ (ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。) 、 $-S(O)_m R^{21b}$ (ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。) 、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5b} は、C1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} はC1-C6ハロアルキル基を表す。) 、 $-S(O)_m R^{23b}$ (ここで、 R^{23b} はC1-C6ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。) 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、 n は0、1又は2を表す。] で示される式(1-1)に記載の化合物、又はそのN-オキシド。

【0055】

式(1-5)



[式中、

R^{70a} は水素原子又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシアルキル基を表し、

A^{3a} は窒素原子又は $=CR^{9a}-$ を表し、

R^{1a} はハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基 (ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい) 、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基を表し、

R^{2a} 及び R^{4a} は同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5もしくは6員芳香族複素環基 (ここで該5もしくは6員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよい

10

20

30

40

50

C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)、 $-\text{OR}^{20a}$ (ここで、 R^{20a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{21a}$ (ここで、 R^{21a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-\text{OR}^{22a}$ (ここで、 R^{22a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{23a}$ (ここで、 R^{23a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、 $-\text{SF}_5$ 又はハロゲン原子を表し、

R^{9a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-\text{OR}^{24a}$ (ここで、 R^{24a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{25a}$ (ここで、 R^{25a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

n は 0、1 又は 2 を表す。] で示される化合物、又はその N－オキシド。

【0056】

式 (1－5) において、

R^{70a} が水素原子又は C 2－C 6 アルコシアルキル基であり、

A^{3a} が窒素原子又は $=\text{CR}^{9a}-$ であり、

R^{1a} がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基 (ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1－C 3 アルキル基を有していてもよい)、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニル基又は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニル基であり、

R^{2a} 及び R^{4a} が同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{3a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニル基、5 もしくは 6 員芳香族複素環基 (ここで該 5 もしくは 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい。)、 $-\text{OR}^{20a}$ (ここで、 R^{20a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{21a}$ (ここで、 R^{21a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

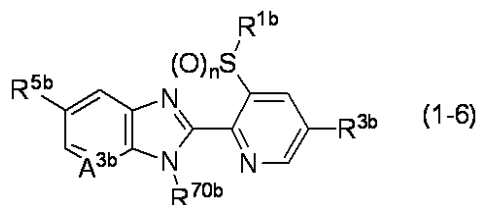
R^{5a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-\text{OR}^{22a}$ (ここで、 R^{22a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{23a}$ (ここで、 R^{23a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、 $-\text{SF}_5$ 又はハロゲン原子であり、

R^{9a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-\text{OR}^{24a}$ (ここで、 R^{24a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{25a}$ (ここで、 R^{25a} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、ハロゲン原子又は水素原子であり、

n が 0、1 又は 2 である化合物、又はその N－オキシド。

【0057】

式 (1-6)



[式中、

R^{70b} は水素原子又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルコキシアルキル基を表し、

A^{3b} は窒素原子又は $=CR^{9b}-$ （ここで、 R^{9b} は水素原子又はハロゲン原子を表す。）を表し、

R^{1b} はエチル基又はシクロプロピルメチル基を表し、

R^{3b} は、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{20b}$ （ここで、 R^{20b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21b}$ （ここで、 R^{21b} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

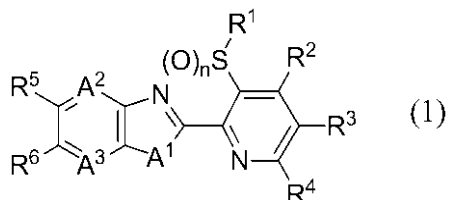
R^{5b} は、C1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} はC1-C6ハロアルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} はC1-C6ハロアルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子を表し、

n は0、1又は2を表す。]

で示される化合物、又はそのN-オキシド。

【0058】

式 (1)



式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式 (1) において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (1) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (1) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(1)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

【0059】

式(1)において、 R^1 が、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基である化合物；

式(1)において、 R^1 が、ハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい）、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基である化合物；

10

【0060】

式(1)において、 R^3 が、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5員複素環基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^3 が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5員芳香族複素環基（ここで該芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、6員芳香族複素環基（ここで該芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、 $-OR^{10}$ （ここで、 R^{10} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{10}$ （ここで、 R^{10} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である。）、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

20

30

式(1)において、 R^2 及び R^4 が、同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5員複素環基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^2 及び R^4 が、同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

40

式(1)において、 R^5 が、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 R^5 が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{10}$ （ここで、 R^{10} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{10}$ （ここで、 R^{10} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

式(1)において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、群Wより選ばれる1個以上の

50

原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個のフェニル基を有する C 1－C 6 鎖式炭化水素基（ここで、該フェニル基は、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、1 個の 5 員複素環基を有する C 1－C 6 鎖式炭化水素基（ここで、該 5 員複素環基は、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、1 個の 6 員複素環基を有する C 1－C 6 鎖式炭化水素基（ここで、該 6 員複素環基は、群 Z より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい）又は水素原子である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルキニル基、1 個の 5 員芳香族複素環基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該 5 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、1 個の 6 員芳香族複素環基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、水素原子又は C 2－C 6 アルコキシアルキル基である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルキニル基；1 個の 5 員芳香族複素環基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該 5 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）又は 1 個の 6 員芳香族複素環基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）である化合物；

式 (1) において A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 アルキニル基、1 個のチアゾリル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで該チアゾリル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、1 個のピリジル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、水素原子又は C 2－C 6 アルコキシアルキル基である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、メチル基、エチル基、プロピル基、アリル基、プロパルギル基、（2－クロロチアゾール－5－イル）メチル基、（2－クロロピリジン－5－イル）メチル基、水素原子、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1－（メトキシ）エチル基又は、1－（エトキシ）エチル基である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 R^7 が、水素原子又は C 2－C 6 アルコキシアルキル基である化合物；

式 (1) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 R^7 が、水素原子、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1－（メトキシ）エチル基又は 1－（エトキシ）エチル基である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ である場合に、 R^8 が 1 個以上のハロゲン原子を有し

10

20

30

40

50

ていてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ である場合に、 R^8 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ (ここで、 R^{10} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{10}$ (ここで、 R^{10} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である。)、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ である場合に、 R^8 がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式 (1) において、 A^2 が $=CR^8-$ である場合に、 R^8 が水素原子である化合物；

式 (1) において、 A^3 が $=CR^9-$ である場合に、 R^9 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式 (1) において、 A^3 が $=CR^9-$ である場合に、 R^9 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ (ここで、 R^{10} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{10}$ (ここで、 R^{10} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である。)、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

【0061】

式 (1) において、 R^1 がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基 (ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1－C 3 アルキル基を有していてもよい) である化合物；

式 (1) において、 R^1 が C 1－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基、又は、C 4－C 9 シクロプロピルアルキル基 (ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1－C 3 アルキル基を有していてもよい。) である化合物；

式 (1) において、 R^1 が C 2－C 6 アルキル基、C 1－C 6 ハロアルキル基又は C 4－C 9 シクロプロピルアルキル基 (ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1－C 3 アルキル基を有していてもよい。) である化合物；

式 (1) において、 R^1 がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基又はシクロプロピルメチル基である化合物；

式 (1) において、 R^1 がエチル基又はシクロプロピルメチル基である化合物；

式 (1) において、 R^1 がエチル基である化合物；

式 (1) において、 R^3 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニル基、ピリジル基 (ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)、ピリミジニル基 (ここで該ピリミジニル基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)、 $-OR^{20a}$ (ここで、 R^{20a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{21a}$ (ここで、 R^{21a} が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基であり、 m は 0、1 又は 2 である。)、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式 (1) において、 R^3 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{20b}$ (ここで、 R^{20b} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表す。)、 $-S(O)_mR^{21b}$ (ここで、 R^{21b} は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を表し、 m は 0、1 又は 2 を表す。)、ハロゲ

10

20

30

40

50

ン原子又は水素原子である化合物；

式（１）において、 R^3 がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、２－ピリジル基、５－トリフルオロメチル－２－ピリジル基、２－ピリミジニル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式（１）において、 R^3 がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

10

【００６２】

式（１）において R^2 及び R^4 がともに水素原子である化合物；

【００６３】

式（１）において、 R^5 がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

20

式（１）において、 R^5 がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）又は $-SF_5$ である化合物；

式（１）において、 R^5 がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）又はハロゲン原子である化合物；

式（１）において、 R^5 がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）である化合物；

30

式（１）において、 R^5 がＣ１－Ｃ６パーフルオロアルキル基、 $-OR^{10}$ （ここで、 R^{10} がＣ１－Ｃ６パーフルオロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{10}$ （ここで、 R^{10} がＣ１－Ｃ６パーフルオロアルキル基である。）である化合物；

式（１）において、 R^5 がトリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

【００６４】

式（１）において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合、 R^7 が１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ３－Ｃ６アルケニル基、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ３－Ｃ６アルキニル基、１個のチアゾリル基を有するＣ１－Ｃ６アルキル基（ここで該チアゾリル基は、ハロゲン原子、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基、及び、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルコキシ基からなる群より選ばれる１個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）又は１個のピリジル基を有するＣ１－Ｃ６アルキル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基、及び、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルコキシ基からなる群より選ばれる１個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）である化合物；

40

式（１）において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合、 R^7 がメチル基、エチル基、プロピル基

50

、アリル基、プロパルギル基、(2-クロロチアゾール-5-イル)メチル基、又は、(2-クロロピリジン-5-イル)メチル基である化合物；

式(1)において、 A^1 が $-NR^7-$ である場合、 R^7 がメチル基又はプロパルギル基である化合物；

【0065】

式(1)において、 A^3 が $=CR^9-$ である場合、 R^9 がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 A^3 が $=CR^9-$ である場合、 R^9 がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1)において、 A^3 が $=CR^9-$ である場合、 R^9 がフッ素原子又は水素原子である化合物；

10

【0066】

式(1)において、 R^1 が群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、

R^2 、 R^3 及び R^4 が、同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5員複素環基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

20

R^5 及び R^6 が、同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個のフェニル基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該フェニル基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい)、1個の5員複素環基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該5員複素環基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい)、1個の6員複素環基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該6員複素環基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい)又は水素原子であり、

30

A^2 が $=CR^8-$ である場合に、 R^8 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 A^3 が $=CR^9-$ である場合に、 R^9 が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である化合物。

【0067】

式(1)において、 R^1 が、ハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基(ここで、該シクロプロピル基は1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい)、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基又は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基であり、

40

R^2 及び R^4 が、同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^3 が、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、5員芳香族複素環基(ここで該芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)、6員芳香族複素環基(ここで該芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3

50

アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^5 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子であり、

R^6 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{10} が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基であり、

A^1 が $-NR^7-$ である場合に、 R^7 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3 - C 6 アルキニル基、1 個の 5 員芳香族複素環基を有する C 1 - C 6 アルキル基（ここで、該 5 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、1 個の 6 員芳香族複素環基を有する C 1 - C 6 アルキル基（ここで、該 6 員芳香族複素環基は、ハロゲン原子、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルキル基、及び、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 3 アルコキシ基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、水素原子又は C 2 - C 6 アルコシアルキル基であり、

A^2 が $=CR^8-$ である場合に、 R^8 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

A^3 が $=CR^9-$ である場合に、 R^9 が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である化合物。

【0068】

式 (1-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が酸素原子である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が硫黄原子である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (1-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

【0069】

式 (1-1) において、 R^{1a} がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1 - C 6 アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい）である化合物；

式 (1-1) において、 R^{1a} が C 1 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基、又は、C 4 - C 9 シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい。）である化合物；

式 (1-1) において、 R^{1a} が C 2 - C 6 アルキル基、C 1 - C 6 ハロアルキル基又は C 4 - C 9 シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1 個以上のハロゲン原子又は 1 個以上の C 1 - C 3 アルキル基を有していてもよい。）である化合物；

式 (1-1) において、 R^{1a} がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基又はシクロプロピルメチル基である化合物；

式 (1-1) において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基である化合物；

式(1-1)において、 R^{1a} がエチル基である化合物；

式(1-1)において、 R^{3a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニル基、ピリジル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、ピリミジニル基（ここで該ピリミジニル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基であり、 m は0、1又は2である。）、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

10

式(1-1)において、 R^{3a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基を表し、 m は0、1又は2を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1-1)において、 R^{3a} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、2-ピリジル基、5-トリフルオロメチル-2-ピリジル基、2-ピリミジニル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

20

式(1-1)において、 R^{3a} が、メチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

30

【0070】

式(1-1)において、 R^{2a} 及び R^{4a} がともに水素原子である化合物；

【0071】

式(1-1)において、 R^{5a} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がC1-C6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

式(1-1)において、 R^{5a} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がC1-C6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）又は $-SF_5$ である化合物；

40

式(1-1)において、 R^{5a} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がC1-C6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）又はハロゲン原子である化合物；

式(1-1)において、 R^{5a} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がC1-C6ハロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）である化合物；

式(1-1)において、 R^{5a} がC1-C6パーフルオロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで

50

、 R^{23a} がC 1－C 6パーフルオロアルキル基である。)である化合物；

式(1-1)において、 R^{5a} が、トリフルオロメチル基、 $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}(\text{CF}_3)_2$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SCF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

【0072】

式(1-1)において、 A^{1a} が $-\text{NR}^{7a}-$ である場合に、 R^{7a} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 6アルキル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6アルケニル基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 3－C 6アルキニル基、1個のチアゾリル基を有するC 1－C 6アルキル基(ここで該チアゾリル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)又は1個のピリジル基を有するC 1－C 6アルキル基(ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルキル基、及び、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC 1－C 3アルコキシ基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。)である化合物；

式(1-1)において、 A^{1a} が $-\text{NR}^{7a}-$ である場合に、 R^{7a} がメチル基、エチル基、プロピル基、アリル基、プロパルギル基、(2-クロロチアゾール-5-イル)メチル基、又は、(2-クロロピリジン-5-イル)メチル基である化合物；

式(1-1)において、 A^{1a} が $-\text{NR}^{7a}-$ である場合、 R^{7a} がメチル基又はプロパルギル基である化合物；

【0073】

式(1-1)において、 A^{3a} が $=\text{CR}^{9a}-$ である場合に、 R^{9a} がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1-1)において、 A^{3a} が $=\text{CR}^{9a}-$ である場合に、 R^{9a} がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-1)において、 A^{3a} が $=\text{CR}^{9a}-$ である場合に、 R^{9a} がフッ素原子又は水素原子である化合物；

【0074】

式(1-2)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(1-2)において、 A^{3b} が $=\text{CR}^{9b}-$ である化合物；

【0075】

式(1-2)において、 R^{1b} がエチル基である化合物；

式(1-2)において、 R^{3b} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CF}(\text{CF}_3)_2$ 、 $-\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、 $-\text{OCF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SCF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{SCF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-2)において、 R^{5b} がC 1－C 6ハロアルキル基、 $-\text{OR}^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC 1－C 6ハロアルキル基である。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC 1－C 6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)、 $-\text{SF}_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

式(1-2)において、 R^{5b} がC 1－C 6ハロアルキル基、 $-\text{OR}^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC 1－C 6ハロアルキル基である。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC 1－C 6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)又は $-\text{SF}_5$ である化合物；

式(1-2)において、 R^{5b} がC 1－C 6ハロアルキル基、 $-\text{OR}^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC 1－C 6ハロアルキル基である。)、 $-\text{S}(\text{O})_m\text{R}^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC 1－C 6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)又はハロゲン原子である化合物；

式(1-2)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)である化合物；

式(1-2)において、 R^{5b} がC1-C6パーフルオロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)である化合物；

式(1-2)において、 R^{5b} がトリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

式(1-2)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-2)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子又は水素原子である化合物；

【0076】

式(1-3)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(1-3)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0077】

式(1-3)において、 R^{1b} がエチル基である化合物；

式(1-3)において、 R^{3b} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-3)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

式(1-3)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)又は $-SF_5$ である化合物；

式(1-3)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)又はハロゲン原子である化合物；

式(1-3)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)である化合物；

式(1-3)において、 R^{5b} がC1-C6パーフルオロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)である化合物；

式(1-3)において、 R^{5b} がトリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

式(1-3)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-3)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子又は水素原子である化合物；

【0078】

10

20

30

40

50

式(1-4)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(1-4)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0079】

式(1-4)において、 R^{1b} がエチル基である化合物；

式(1-4)において、 R^{3b} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-4)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

式(1-4)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）又は $-SF_5$ である化合物；

式(1-4)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）又はハロゲン原子である化合物；

式(1-4)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。）である化合物；

式(1-4)において、 R^{5b} がC1-C6パーフルオロアルキル基、 $-OR^{22b}$ （ここで、 R^{22b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{23b}$ （ここで、 R^{23b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。）である化合物；

式(1-4)において、 R^{5b} がトリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

式(1-4)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-4)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子又は水素原子である化合物；

【0080】

式(1-5)において、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式(1-5)において、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

【0081】

式(1-5)において、 R^{1a} がハロゲン原子及びシクロプロピル基からなる群より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6アルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい）である化合物；

式(1-5)において、 R^{1a} がC1-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基、又は、C4-C9シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい。）である化合物；

式(1-5)において、 R^{1a} がC2-C6アルキル基、C1-C6ハロアルキル基又はC4-C9シクロプロピルアルキル基（ここで、該シクロプロピル基は、1個以上のハロゲン原子又は1個以上のC1-C3アルキル基を有していてもよい。）である化合物；

式(1-5)において、 R^{1a} がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基又はシクロプロピルメチル基であ

る化合物；

式（１－５）において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基である化合物；

式（１－５）において、 R^{1a} がエチル基である化合物；

式（１－５）において、 R^{3a} が１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルケニル基、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ２－Ｃ６アルキニル基、ピリジル基（ここで該ピリジル基は、ハロゲン原子、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基、及び、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルコキシ基からなる群より選ばれる１個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、ピリミジニル基（ここで該ピリミジニル基は、ハロゲン原子、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルキル基、及び、１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ３アルコキシ基からなる群より選ばれる１個以上の原子もしくは置換基を有していてもよい。）、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} が１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} が１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基であり、 m は０、１又は２である。）、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

10

式（１－５）において、 R^{3a} が１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基、 $-OR^{20a}$ （ここで、 R^{20a} は１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基を表す。）、 $-S(O)_mR^{21a}$ （ここで、 R^{21a} は１個以上のハロゲン原子を有していてもよいＣ１－Ｃ６アルキル基を表し、 m は０、１又は２を表す。）、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

20

式（１－５）において、 R^{3a} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、２－ピリジル基、５－トリフルオロメチル－２－ピリジル基、２－ピリミジニル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式（１－５）において、 R^{3a} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

30

【００８２】

式（１－５）において、 R^{2a} 及び R^{4a} がともに水素原子である化合物；

【００８３】

式（１－５）において、 R^{5a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

40

式（１－５）において、 R^{5a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）又は $-SF_5$ である化合物；

式（１－５）において、 R^{5a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）、 $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）又はハロゲン原子である化合物；

式（１－５）において、 R^{5a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基、 $-OR^{22a}$ （ここで、 R^{22a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基である。）又は $-S(O)_mR^{23a}$ （ここで、 R^{23a} がＣ１－Ｃ６ハロアルキル基であり、 m が０、１又は２である。）である化合物；

50

式(1-5)において、 R^{5a} がC1-C6パーフルオロアルキル基、 $-OR^{22a}$ (ここで、 R^{22a} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23a}$ (ここで、 R^{23a} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)である化合物；

式(1-5)において、 R^{5a} がトリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

【0084】

式(1-5)において、 R^{70a} が水素原子、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1-(メトキシ)エチル基又は1-(エトキシ)エチル基である化合物；

10

【0085】

式(1-5)において、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である場合に、 R^{9a} がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1-5)において、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である場合に、 R^{9a} がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-5)において、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である場合に、 R^{9a} がフッ素原子又は水素原子である化合物；

【0086】

式(1-6)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(1-6)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

20

式(1-6)において、 R^{1b} がエチル基である化合物；

式(1-6)において、 R^{3b} がメチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、エチル基、エテニル基、エチニル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-CF_2CF_2CF_2CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

【0087】

式(1-6)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)、 $-SF_5$ 又はハロゲン原子である化合物；

30

式(1-6)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)又は $-SF_5$ である化合物；

式(1-6)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)、 $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)又はハロゲン原子である化合物；

式(1-6)において、 R^{5b} がC1-C6ハロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6ハロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6ハロアルキル基であり、 m が0、1又は2である。)である化合物；

40

式(1-6)において、 R^{5b} がC1-C6パーフルオロアルキル基、 $-OR^{22b}$ (ここで、 R^{22b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)又は $-S(O)_mR^{23b}$ (ここで、 R^{23b} がC1-C6パーフルオロアルキル基である。)である化合物；

式(1-6)において、 R^{5b} がトリフルオロメチル基、 $-CF_2CF_3$ 、 $-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-CF(CF_3)_2$ 、 $-OCF_3$ 、 $-OCF_2CF_3$ 、 $-SCF_3$ 、 $-S(O)CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_3$ 、 $-SCF_2CF_3$ 、 $-S(O)CF_2CF_3$ 、 $-S(O)_2CF_2CF_3$ 、 SF_5 、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子である化合物；

【0088】

式(1-6)において、 R^{70b} が水素原子、メトキシメチル基、エトキシメチル基、1-

50

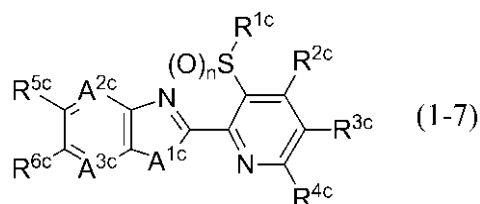
(メトキシ)エチル基又は1-(エトキシ)エチル基である化合物；

式(1-6)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子である化合物；

式(1-6)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である場合に、 R^{9b} がフッ素原子又は水素原子である化合物；

【0089】

式(1-7)



10

[式中、

A^{1c} は $-NR^{7c}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を表し、

A^{2c} は窒素原子又は $=CR^{8c}-$ を表し、

A^{3c} は窒素原子又は $=CR^{9c}-$ を表し、

R^{1c} は群 X^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基又は群 Y^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基を表し、

20

R^{2c} 及び R^{4c} は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、 $-NR^{10c}R^{11c}$ 、 $-CO_2R^{10c}$ 、 $-C(O)R^{10c}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3c} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群 Z^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群 Z^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5員複素環基、群 Z^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、 $-NR^{10c}R^{11c}$ 、 $-CO_2R^{10c}$ 、 $-C(O)R^{10c}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

30

R^{5c} 及び R^{6c} は同一又は相異なり、群 X^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群 Z^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、群 Z^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい5員複素環基、群 Z^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい6員複素環基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、 $-S(O)_2NR^{10c}R^{11c}$ 、 $-NR^{10c}R^{11c}$ 、 $-CO_2R^{10c}$ 、 $-C(O)R^{10c}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{7c} は群 W^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-CO_2R^{10c}$ 、 $-C(O)R^{10c}$ 、又は群 Y^c より選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基を表し、

40

R^{8c} 及び R^{9c} は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、 $-NR^{10c}R^{11c}$ 、 $-CO_2R^{10c}$ 、 $-C(O)R^{10c}$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{10c} 及び R^{11c} は同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基又は水素原子を表し、

m は0、1又は2を表し、 n は0、1又は2を表す。

ここで、 R^{5c} 及び R^{6c} が同時に水素原子を表すことはなく、また、 $-S(O)_mR^{10c}$ において、 m が1又は2の場合には、 R^{10c} が水素原子を表すことはない。

群 X^c : 1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルケニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC2-C6アルキニルオキシ基、1個以上のハロゲン原子を有し

50

ていてもよい C 1－C 6 アルキルスルファニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルホニル基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群 Y^c：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基及びハロゲン原子からなる群。

群 Z^c：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルファニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルホニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキルカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルアミノ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 8 ジアルキルアミノ基、ハロゲン原子、シアノ基及びニトロ基からなる群。

群 W^c：1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニルオキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキニルオキシ基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルファニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルキルカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 3－C 6 シクロアルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルフィニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキルスルホニル基、ヒドロキシ基、ハロゲン原子及びシアノ基からなる群。]

で示される縮合複素環化合物。

【0090】

式 (1-7) において、A^{1c}が－NR^{7c}－である化合物；

式 (1-7) において、A^{1c}が酸素原子である化合物；

式 (1-7) において、A^{1c}が硫黄原子である化合物；

式 (1-7) において、A^{1c}が－NR^{7c}－であり、R^{7c}が 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルコキシ基を 1 個有している C 1－C 6 鎖式炭化水素基、又はシクロプロピル基である化合物；

式 (1-7) において、A^{1c}が－NR^{7c}－であり、R^{7c}がメチル基、エチル基、メトキシメチル基又はエトキシメチル基である化合物；

【0091】

式 (1-7) において、A^{2c}が窒素原子である化合物；

式 (1-7) において、A^{2c}が＝CR^{8c}－である化合物；

式 (1-7) において、A^{2c}が＝CH－である化合物；

式 (1-7) において、A^{3c}が窒素原子である化合物；

式 (1-7) において、A^{3c}が＝CR^{9c}－である化合物；

式 (1-7) において、A^{3c}が窒素原子又は＝CR^{9c}－であり、R^{9c}がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

【0092】

式 (1-7) において、A^{2c}が＝CR^{8c}－であり、A^{3c}が＝CR^{9c}－である化合物；

式 (1-7) において、A^{2c}が窒素原子であり、A^{3c}が＝CR^{9c}－である化合物；

式 (1-7) において、A^{2c}が＝CR^{8c}－であり、A^{3c}が窒素原子である化合物；

式 (1-7) において、A^{2c}が窒素原子であり、A^{3c}が窒素原子である化合物；

式 (1-7) において、A^{2c}が＝CR^{8c}－であり、R^{8c}が水素原子であり、A^{3c}が窒素原子である化合物；

【0093】

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 A^{2c} が窒素原子であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 R^{8c} が水素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 R^{7c} がメチル基であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 R^{8c} が水素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物； 10

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 A^{2c} が窒素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が酸素原子であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が酸素原子であり、 A^{2c} が窒素原子であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が酸素原子であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が酸素原子であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 R^{8c} が水素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物； 20

式(1-7)において、 A^{1c} が酸素原子であり、 A^{2c} が窒素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が硫黄原子であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が硫黄原子であり、 A^{2c} が窒素原子であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が硫黄原子であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が硫黄原子であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 R^{8c} が水素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物； 30

式(1-7)において、 A^{1c} が硫黄原子であり、 A^{2c} が窒素原子であり、 A^{3c} が窒素原子である化合物；

【0094】

式(1-7)において、 R^{1c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基である化合物；

式(1-7)において、 R^{1c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

【0095】

式(1-7)において、 R^{2c} 及び R^{4c} が同一又は相異なり、水素原子又はハロゲン原子であり、 R^{3c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である化合物； 40

式(1-7)において、 R^{2c} 及び R^{4c} が水素原子であり、 R^{3c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1-7)において、 R^{2c} 及び R^{4c} が水素原子であり、 R^{3c} が1個以上のハロゲン原子もしくは1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基を有していてもよいフェニル基、1個以上のハロゲン原子もしくは1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基を有していてもよい5員複素環基又は1個以上のハロゲン原子もしくは1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C3アルキル基を有して 50

いてもよい6員複素環基である化合物；

式(1-7)において、 R^{2c} 、 R^{3c} 及び R^{4c} が水素原子である化合物；

【0096】

式(1-7)において、 R^{5c} 及び R^{6c} が同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、ハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1-7)において、 R^{5c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 又はハロゲン原子であり、 R^{6c} が水素原子である化合物；

式(1-7)において、 R^{5c} が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルホニル基又はハロゲン原子であり、 R^{6c} が水素原子である化合物；

式(1-7)において、 R^{1c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、 R^{2c} 及び R^{4c} が同一又は相異なり、水素原子又はハロゲン原子であり、 R^{3c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{5c} 及び R^{6c} が同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 R^{7c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基を1個有しているC1-C6鎖式炭化水素基、又はシクロプロピル基であり、 A^{2c} が $=CH-$ であり、 A^{3c} が窒素原子又は $=CR^{9c}-$ であり、 R^{9c} がハロゲン原子又は水素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり、 R^{7c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルコキシ基を1個有しているC1-C6鎖式炭化水素基又はC1-C6鎖式炭化水素基であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が窒素原子又は $=CR^{9c}-$ であり、 R^{9c} がハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{1c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基であり、 R^{2c} 及び R^{4c} が同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{3c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{5c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10c}$ 、 $-S(O)_mR^{10c}$ 又はハロゲン原子であり、 R^{6c} が水素原子であり、 R^{10c} が1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6アルキル基である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 R^{7c} がC1-C6アルキル基であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 A^{3c} が $=CR^{9c}-$ であり、 R^{1c} が1個以上のフッ素原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^{2c} 及び R^{4c} が水素原子であり、 R^{3c} が1個以上のフッ素原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{5c} が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルフィニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルホニル基又はハロゲン原子であり、 R^{6c} が水素原子である化合物；

式(1-7)において、 A^{1c} が $-NR^{7c}-$ であり、 R^{7c} がC1-C6アルキル基であり、 A^{2c} が $=CR^{8c}-$ であり、 R^{8c} が水素原子であり、 A^{3c} が窒素原子であり、 R^{1c} が1個以上のフッ素原子を有していてもよいC1-C3アルキル基であり、 R^{2c} 及び R^{4c} が水素原子であり、 R^{3c} が1個以上のフッ素原子を有していてもよいC1-C3アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{5c} が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素

10

20

30

40

50

原子を有している C 1－C 3 アルキルスルファニル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルフィニル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルホニル基又はハロゲン原子であり、R^{6c}が水素原子である化合物；

式 (1－7) において、A^{1c}が硫黄原子であり、A^{2c}が＝C R^{8c}－であり、A^{3c}が＝C R^{9c}－であり、R^{1c}が 1 個以上のフッ素原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基であり、R^{2c}及び R^{4c}が水素原子であり、R^{3c}が 1 個以上のフッ素原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子であり、R^{5c}が 1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルコキシ基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルファニル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルフィニル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルホニル基又はハロゲン原子であり、R^{6c}が水素原子である化合物；

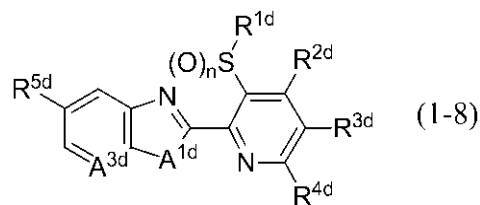
式 (1－7) において、A^{1c}が硫黄原子であり、A^{2c}が＝C R^{8c}－であり、R^{8c}が水素原子であり、A^{3c}が窒素原子であり、R^{1c}が 1 個以上のフッ素原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基であり、R^{2c}及び R^{4c}が水素原子であり、R^{3c}が 1 個以上のフッ素原子を有していてもよい C 1－C 3 アルキル基、ハロゲン原子又は水素原子であり、R^{5c}が 1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルコキシ基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルファニル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルフィニル基、1 個以上のフッ素原子を有している C 1－C 3 アルキルスルホニル基又はハロゲン原子であり、R^{6c}が水素原子である化合物；

【0097】

式 (1－7) において、A^{1c}が－N R^{7c}－であり、R^{7c}がメチル基、エチル基、メトキシメチル基又はエトキシメチル基であり、R^{1c}がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基であり、R^{2c}及び R^{4c}が水素原子であり、R^{3c}がメチル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子又は水素原子であり、R^{5c}がトリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、フルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロメチルスルファニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、臭素原子又はヨウ素原子であり、R^{6c}が水素原子である化合物；

【0098】

式 (1－8)



[式中、

A^{1d}は－N R^{7d}－又は硫黄原子を表し、

A^{3d}は窒素原子又は＝C R^{9d}－を表し、

R^{1d}は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基を表し、

R^{2d}及び R^{4d}は同一又は相異なり、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{3d}は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、－O R^{10d}、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{5d}は 1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 鎖式炭化水素基、－O R^{10d}、－S (O)_m R^{10d}、臭素原子又はヨウ素原子を表し、

R^{7d} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基を表し、
 R^{9d} はハロゲン原子又は水素原子を表し、
 R^{10d} は1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基を表し、
 m は0、1又は2を表し、 n は0、1又は2を表す。]で示される縮合複素環化合物；

【0099】

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ である化合物；

式(1-8)において、 A^{1d} が硫黄原子である化合物；

【0100】

式(1-8)において、 A^{3d} が窒素原子である化合物；

式(1-8)において、 A^{3d} が $=CR^{9d}-$ である化合物；

10

【0101】

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ 又は硫黄原子であり、 R^{7d} がメチル基であり、
 A^{3d} が窒素原子である化合物；

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ であり、 A^{3d} が $=CR^{9d}-$ である化合物；

式(1-8)において、 A^{1d} が硫黄原子であり、 A^{3d} が $=CR^{9d}-$ である化合物；

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ であり、 A^{3d} が窒素原子である化合物；

式(1-8)において、 A^{1d} が硫黄原子であり、 A^{3d} が窒素原子である化合物；

【0102】

式(1-8)において、 R^{1d} がC1-C3アルキル基である化合物；

【0103】

式(1-8)において、 R^{2d} 及び R^{4d} が水素原子であり、 R^{3d} が塩素原子、臭素原子、ト
 リフルオロメチル基又は水素原子である化合物；

式(1-8)において、 R^{2d} 、 R^{3d} 及び R^{4d} が水素原子である化合物；

20

【0104】

式(1-8)において、 R^{5d} が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3鎖式炭化水
 素基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素原
 子を有しているC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のフッ素原子を有している
 C1-C3アルキルスルフィニル基又は1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3ア
 ルキルスルホニル基である化合物；

式(1-8)において、 R^{5d} がトリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタ
 フルオロイソプロピル基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロメチルスルファニル基
 、トリフルオロメチルスルフィニル基又はトリフルオロメチルスルホニル基である化合物
 ；

30

【0105】

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ 又は硫黄原子であり、 R^{7d} がメチル基であり、
 A^{3d} が窒素原子であり、 R^{1d} がエチル基であり、 R^{2d} 及び R^{4d} が同一又は相異なり、ハロ
 ゲン原子又は水素原子であり、 R^{3d} がトリフルオロメチル基、ハロゲン原子又は水素原子
 であり、 R^{5d} が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上
 のフッ素原子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素原子を有している
 C1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アル
 キルスルフィニル基又は1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルホ
 ニル基である化合物；

40

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ であり、 R^{7d} がメチル基であり、 A^{3d} が $=CR^{9d}-$
 であり、 R^{1d} がエチル基であり、 R^{2d} 及び R^{4d} が同一又は相異なり、ハロゲン原子又
 は水素原子であり、 R^{3d} がトリフルオロメチル基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{5d}
 が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のフッ素原
 子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3
 アルキルスルファニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルフ
 ィニル基又は1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルホニル基である
 化合物；

50

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ であり、 R^{7d} がメチル基又は水素原子であり、 A^{3d} が窒素原子であり、 R^{1d} がエチル基であり、 R^{2d} 及び R^{4d} が同一又は相異なり、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{3d} がトリフルオロメチル基、ハロゲン原子又は水素原子であり、 R^{5d} が1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3鎖式炭化水素基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルコキシ基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルファニル基、1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルフィニル基又は1個以上のフッ素原子を有しているC1-C3アルキルスルホニル基である化合物；

式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ 又は硫黄原子であり、 R^{7d} がメチル基であり、 A^{3d} が $=CR^{9d}-$ であり、 R^{1d} がエチル基であり、 R^{2d} 及び R^{4d} が水素原子であり、 R^{3d} が塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基又は水素原子であり、 R^{5d} がトリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロメチルスルファニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基又はトリフルオロメチルスルホニル基である化合物；式(1-8)において、 A^{1d} が $-NR^{7d}-$ 又は硫黄原子であり、 R^{7d} がメチル基であり、 A^{3d} が窒素原子であり、 R^{1d} がエチル基であり、 R^{2d} 及び R^{4d} が水素原子であり、 R^{3d} が塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基又は水素原子であり、 R^{5d} がトリフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロメチルスルファニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基又はトリフルオロメチルスルホニル基である化合物；

【0106】

式(1)において、

A^1 が $-NR^7-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり、

A^2 が $=CR^8-$ であり、

A^3 が窒素原子又は $=CR^9-$ であり、

R^1 が群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基又は群Yより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC3-C6脂環式炭化水素基であり、

R^2 、 R^3 及び R^4 は群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基又は水素原子であり、

R^5 及び R^6 が同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり(ここで、 R^5 及び R^6 が同時に水素原子を表すことはない)、

R^7 が群Wより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、1個の5もしくは6員複素環基を有するC1-C6鎖式炭化水素基(ここで、該5もしくは6員複素環基は、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよい)又は水素原子であり、

R^8 及び R^9 が同一又は相異なり、1個以上のハロゲン原子を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^{10} 及び R^{11} が同一又は相異なり、群Xより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいC1-C6鎖式炭化水素基、群Zより選ばれる1個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基又は水素原子であり、

mが0、1又は2であり、nが0、1又は2である化合物。

【0107】

式(1)において、

A^1 が、 $-NR^7-$ 、酸素原子又は硫黄原子であり、

A^2 が、窒素原子又は $=CR^8-$ であり、

A^3 が、窒素原子又は $=CR^9-$ であり、

10

20

30

40

50

R^1 が、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、C 3－C 6 シクロアルキル基、シアノ基、及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキニル基、又は C 3－C 6 シクロアルキル基であり、

R^2 が、C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^3 が、C 1－C 6 アルコキシ基、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、ピリジル基（ここで、該ピリジル基は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい）、ピリミニジル基、C 1－C 6 アルケニル基、C 1－C 6 アルキニル基、フェニル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^4 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^5 が、ヒドロキシ基及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよいフェニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい 1, 2, 4-トリアゾール-1-イル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基を有していてもよいイミダゾール-1-イル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいピリジル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいピラゾリル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよいチアゾリル基、ハロゲン原子、C 1－C 6 アルケニル基、フリル基、チエニル基、ピロリジン-1-イル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-S(O)_2NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-NR^{10}C(O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-SF_5$ 、シアノ基又は水素原子であり、

R^6 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、フェニル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)NR^{10}R^{11}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子であり、

R^7 が、C 1－C 6 アルコキシ基、C 1－C 6 アルキルスルファニル基、C 2－C 6 アルコキシカルボニル基、シアノ基、及びハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 個以上の原子もしくは基を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 2－C 6 アルケニル基、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキニル基、1 個のフェニル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該フェニル基は、1 個以上の C 1－C 6 アルコキシ基を有していてもよい）、1 個のピリジル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該ピリジル基は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい）、1 個のチアゾリル基を有する C 1－C 6 アルキル基（ここで、該チアゾリル基は、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい）、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、C 3－C 6 シクロアルキル基又は水素原子であり、

R^8 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-NR^{10}R^{11}$ 、 $-C(O)R^{10}$ 、又は水素原子を表し、

R^9 が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル基、 $-OR^{10}$ 、 $-S(O)_mR^{10}$ 、 $-NR^{10}R^{11}$ 、シアノ基、ハロゲン原子又は水素原子を表し、

R^{10} が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル、フェニル基又は水素原子であり、

R^{11} が、1 個以上のハロゲン原子を有していてもよい C 1－C 6 アルキル、又は水素原子である化合物。

【0108】

次に、本発明化合物の製造法について説明する。

10

20

30

40

50

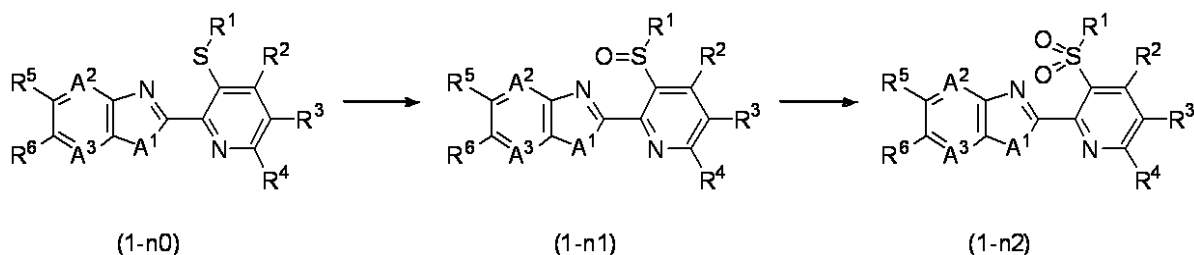
【0109】

本発明化合物及び中間体化合物は、例えば、以下の（製造法1）～（製造法24）により製造することができる。

【0110】

（製造法1）

式（1）においてnが1又は2である本発明化合物は、nが0である本発明化合物を酸化することにより製造することができる。



10

[式中、記号は式（1）と同じ意味を表す。]

式（1）においてnが1である本発明化合物（1-n1）は、nが0である本発明化合物（1-n0）を酸化反応に付すことにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

20

反応に用いられる酸化剤としては、例えば過ヨウ素酸ナトリウム又はm-クロロ過安息香酸が挙げられる。

該反応には、本発明化合物（1-n0）1モルに対して、酸化剤が通常1～3モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物（1-n0）1モルに対して、酸化剤が1～1.2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20～80℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～12時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1-n1）を単離することができる。単離された本発明化合物（1-n1）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

30

【0111】

式（1）においてnが2である本発明化合物（1-n2）は、nが1である本発明化合物（1-n1）を酸化剤の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

40

反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応には、本発明化合物（1-n1）1モルに対して、酸化剤が通常1～4モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物（1-n1）1モルに対して、酸化剤が1～2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～12時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（1

50

−n 2) を単離することができる。本発明化合物 (1 − n 2) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0112】

また、式 (1) において n が 2 である本発明化合物 (1 − n 2) は、n が 0 である本発明化合物 (1 − n 0) を酸化剤の存在下に反応させることにより一段階反応 (ワンポット) で製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば m-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

該反応には、本発明化合物 (1 − n 0) 1 モルに対して、酸化剤が通常 2 ~ 5 モルの割合、触媒が通常 0.01 ~ 0.5 モルの割合で用いられる。好ましくは、本発明化合物 (1 − n 0) 1 モルに対して、酸化剤が 2 ~ 3 モルの割合で用いられる。

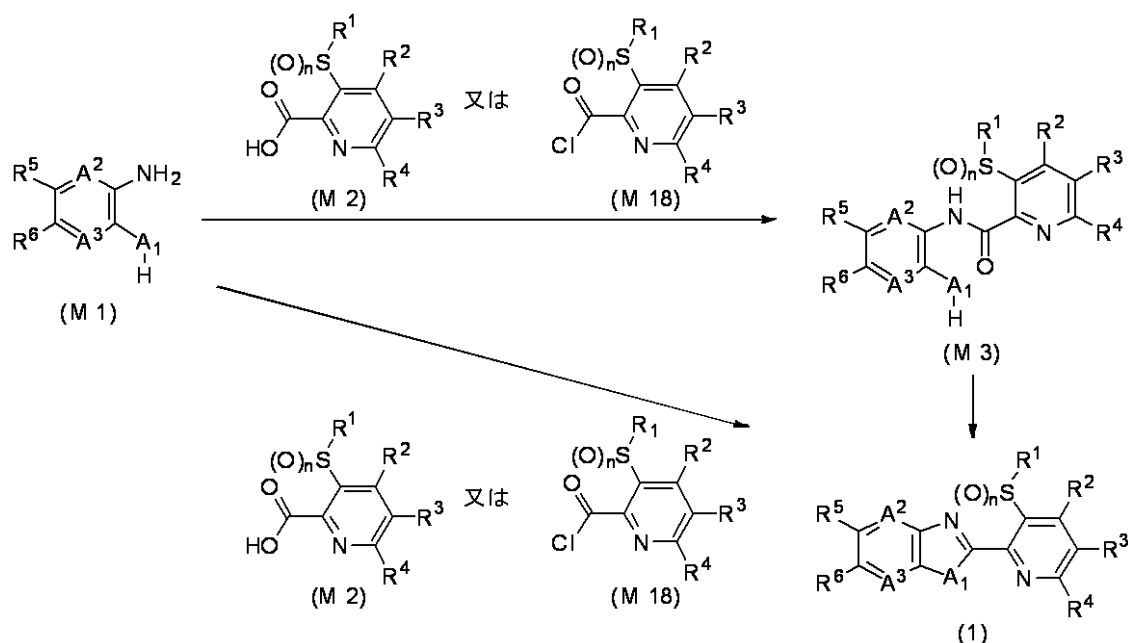
該反応の反応温度は、通常 0 ~ 120 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 12 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤 (例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム) の水溶液、塩基 (例えば炭酸水素ナトリウム) の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物 (1 − n 2) を単離することができる。単離された本発明化合物 (1 − n 2) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0113】

(製造法 2)

本発明化合物は、中間体化合物 (M1) と中間体化合物 (M2) 又は中間体化合物 (M18) とを反応させて中間体化合物 (M3) を製造した後、得られた中間体化合物 (M3) を分子内で縮合させることにより製造することができる。



[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

中間体化合物 (M3) は、中間体化合物 (M1) と中間体化合物 (M2) とを、縮合剤の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1

、4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン（以下、THFと記す。）、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、N,N-ジメチルホルムアミド（以下、DMFと記す。）、N-メチルピロリドン（以下、NMPと記す。）、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、ジメチルスルホキシド（以下、DMSOと記す。）等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる縮合剤としては、例えば1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド塩酸塩（以下、WSCと記す。）、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類が挙げられる。

該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えば1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（以下、HOBtと記す）が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M1)1モルに対して、中間体化合物(M2)が通常0.5~2モルの割合、縮合剤が通常1~5モルの割合、触媒が通常0.01~1モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常、0~120℃の範囲である。該反応の反応時間は、通常、0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより中間体化合物(M3)を単離することができる。単離された中間体化合物(M3)は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

【0114】

また、中間体化合物(M3)は、中間体化合物(M1)と中間体化合物(M18)とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M1)1モルに対して、中間体化合物(M18)が通常1~3モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M3)を単離することができる。単離された中間体化合物(M3)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0115】

本発明化合物(1)は、中間体化合物(M3)を分子内縮合することにより製造することができる。

該反応は、通常、溶媒の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば1

10

20

30

40

50

、4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は必要に応じて、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤を用いることができる。

反応に用いられる縮合剤としては、例えば無水酢酸、トリフルオロ酢酸無水物、WSC、トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素もしくは四臭化炭素の混合物、トリフェニルホスフィンとアゾジカルボン酸ジエチル等のアゾジエステル類の混合物等が挙げられる。

10

反応に用いられる酸としては、例えばパラトルエンスルホン酸等のスルホン酸類、酢酸等のカルボン酸類、ポリリン酸等が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えばピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、1,8-ジアザビシクロ〔5.4.0〕-7-ウンデセン（以下、DBUと記す。）、1,5-ジアザビシクロ〔4.3.0〕-5-ノネン等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類、リン酸三カリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。

反応に用いられる塩素化剤としては、例えばオキシ塩化リン等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M3) 1モルに対して、縮合剤を用いる場合には縮合剤が通常1~5モルの割合、酸を用いる場合には酸が通常0.1モル~5モルの割合、塩基を用いる場合には塩基が通常1モル~5モルの割合、塩素化剤を用いる場合には塩素化剤が通常1モル~5モルの割合で用いられる。

20

該反応の反応温度は、通常、0~200℃の範囲である。該反応の反応時間は、通常、0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより本発明化合物(1)を単離することができる。単離された本発明化合物(1)は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

30

【0116】

本発明化合物(1)は、中間体化合物(M1)と中間体化合物(M2)とを縮合剤の存在下で反応させることにより一段階反応(ワンポット)で製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えば、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

40

反応に用いられる縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類が挙げられる。

該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えば1-ヒドロキシベンゾトリアゾールが挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M1) 1モルに対して、中間体化合物(M2)が通常0.5~2モルの割合、縮合剤が通常1~5モルの割合、触媒が通常0.01~1モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常、0~200℃の範囲である。該反応の反応時間は、通常、0.1~24時間の範囲である。

50

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより本発明化合物（１）を単離することができる。単離された本発明化合物（１）は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

【０１１７】

また、本発明化合物（１）は、中間体化合物（Ｍ１）と中間体化合物（Ｍ１８）とを反応させることにより一段階反応（ワンポット）で製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下あるいは非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばＴＨＦ、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、１，４-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、ＤＭＦ、ＮＭＰ、ＤＭＳＯ等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、*N*，*N*-ジイソプロピルエチルアミン等の第３級アミン類及びピリジン、４-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（Ｍ１）１モルに対して、中間体化合物（Ｍ１８）が通常１～３モルの割合、塩基が通常１～１０モルの割合で用いられる。

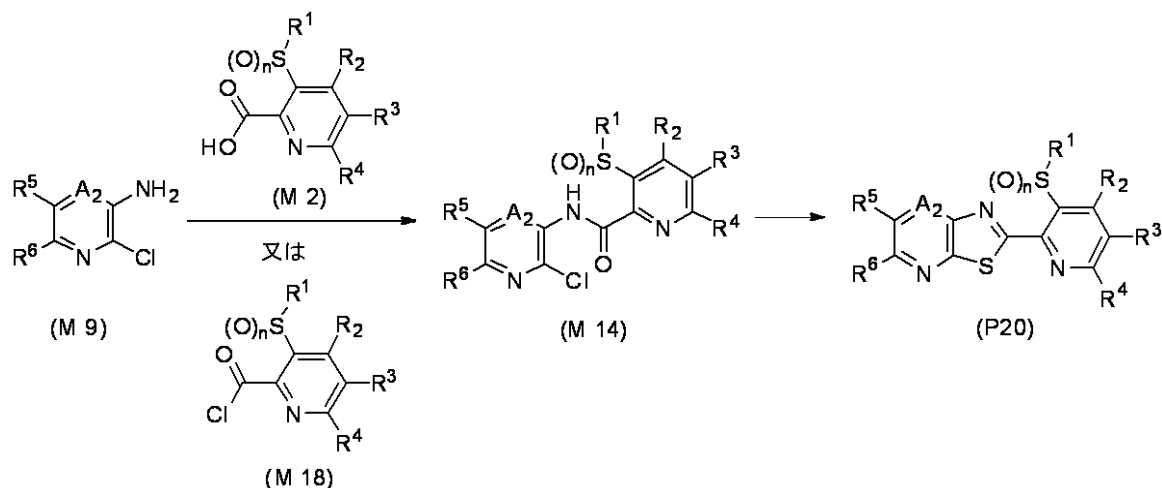
該反応の反応温度は、通常２０～２００℃の範囲である。該反応の反応時間は通常０．１～２４時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（１）を単離することができる。単離された本発明化合物（１）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【０１１８】

（製造法３）

中間体化合物（Ｍ９）と、中間体化合物（Ｍ２）又は中間体化合物（Ｍ１８）とを反応させて中間体化合物（Ｍ１４）を製造した後、得られた中間体化合物（Ｍ１４）と硫化剤とを反応させることにより、式（１）において A^1 が硫黄原子であり、かつ、 A^3 が窒素原子である本発明化合物（Ｐ２０）を製造することができる。



[式中、記号は式（１）と同じ意味を表す。]

中間体化合物（Ｍ１４）は、中間体化合物（Ｍ９）と中間体化合物（Ｍ２）とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下あるいは非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる脱水縮合剤としては、例えばWSC、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド等のカルボジイミド類、BOP試薬が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M9)1モルに対して、中間体化合物(M2)が通常1～3モルの割合、脱水縮合剤が通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M14)を単離することができる。単離された中間体化合物(M14)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0119】

また、中間体化合物(M14)は、中間体化合物(M9)と中間体化合物(M18)とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下あるいは非存在下で行われる。必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、ヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M9)1モルに対して、中間体化合物(M18)が通常1～3モルの割合、塩基が通常1～5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を注加した後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M14)を単離することができる。単離された中間体化合物(M14)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0120】

本発明化合物(P20)は化合物(14)と硫化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、溶媒の存在下又は非存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、tert-ブチルメチルエーテル、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、ピリジン、ピコリン、ルチジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応に用いられる硫化剤としては、五硫化ニリン、ローソン試薬(2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-1,3-ジチア-2,4-ジホスフェタン-2,4-ジスルフ

10

20

30

40

50

イド)等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 (M 1 4) 1 モルに対して、硫化剤が通常 1 モル～3 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常、0℃～200℃の範囲であり、反応時間は、通常、1～24時間の範囲である。

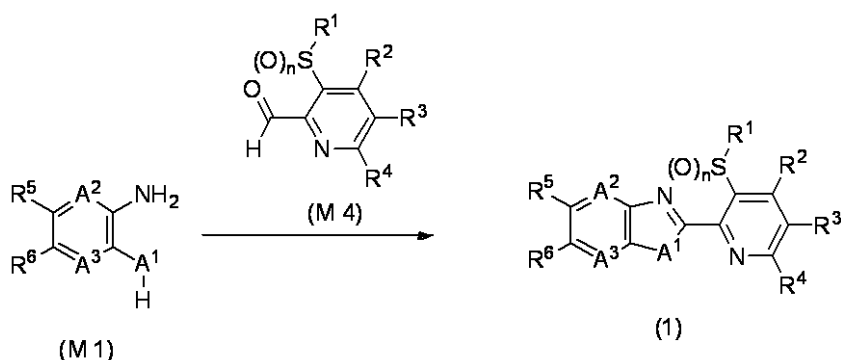
反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより本発明化合物 (P 2 0) を単離することができる。単離された本発明化合物 (P 2 0) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

10

【0121】

(製造法4)

本発明化合物は、中間体化合物 (M 1) と中間体化合物 (M 4) とを酸化剤の存在下反応させることにより製造することができる。



20

[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF、tert-ブチルメチルエーテル等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、トルエン、ベンゼン、キシレン等の芳香族炭化水素類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

30

該反応は必要に応じて酸を加えて行うこともできる。

反応に用いられる酸としては、例えばパラトルエンスルホン酸等のスルホン酸類、酢酸等のカルボン酸類、ポリリン酸等が挙げられる。

該反応は必要に応じて亜硫酸塩を加えて行うこともできる。

反応に用いられる亜硫酸塩としては、例えば亜硫酸水素ナトリウム、二亜硫酸ナトリウム等の亜硫酸塩類が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば酸素、塩化銅 (I I)、DDQ等が挙げられる。

40

該反応には、中間体化合物 (M 1) 1 モルに対して、中間体化合物 (M 4) が通常 1～2 モルの割合、酸が通常 0.1～2 モルの割合、亜硫酸塩が通常 1～5 モルの割合、酸化剤が通常 1 モル～5 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0～200℃の範囲であり、反応時間は通常 0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより本発明化合物 (1) を単離することができる。単離された本発明化合物 (1) は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもで

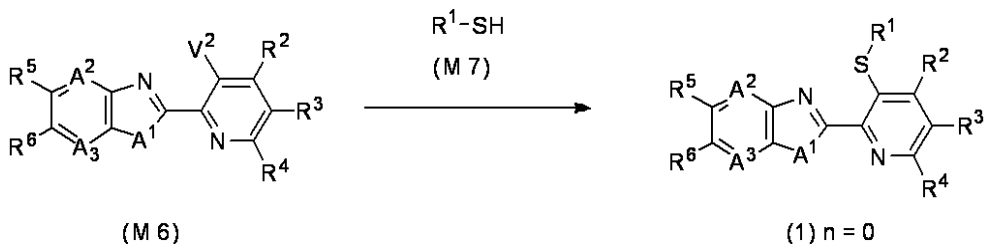
50

きる。

【0122】

(製造法5)

式(1)においてnが0である本発明化合物(1)は、中間体化合物(M6)と化合物(M7)とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



10

[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

20

該反応には、中間体化合物(M6)1モルに対して、化合物(M7)が通常1~10モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

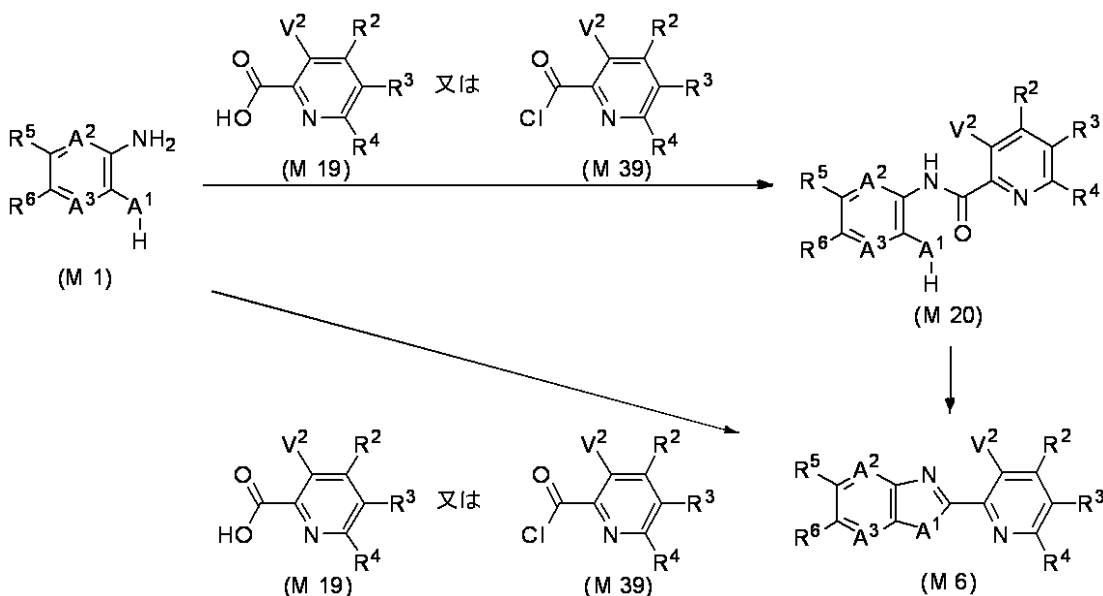
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、nが0である本発明化合物(1)を単離することができる。単離されたnが0である本発明化合物(1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応において V^2 としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

【0123】

(製造法6)

中間体化合物(M1)と、中間体化合物(M19)又は中間体化合物(M39)とを反応させて中間体化合物(M20)を製造した後、得られた中間体化合物(M20)を分子内で縮合させることにより中間体化合物(M6)を製造することができる。



40

50

[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

中間体化合物(M2)に代えて中間体化合物(M19)を用い、製造法2工程の方法に準じて、中間体化合物(M20)を製造することができる。

中間体化合物(M18)に代えて中間体化合物(M39)を用い、製造法2の方法に準じて、中間体化合物(M20)を製造することができる。

中間体化合物(M3)に代えて中間体化合物(M20)を用い、製造法2の方法に準じて、中間体化合物(M6)を製造することができる。

また、中間体化合物(M2)に代えて中間体化合物(M19)を用い、製造法2工程の方法に準じて、中間体化合物(M6)を一段階反応(ワンポット)で製造することもできる。

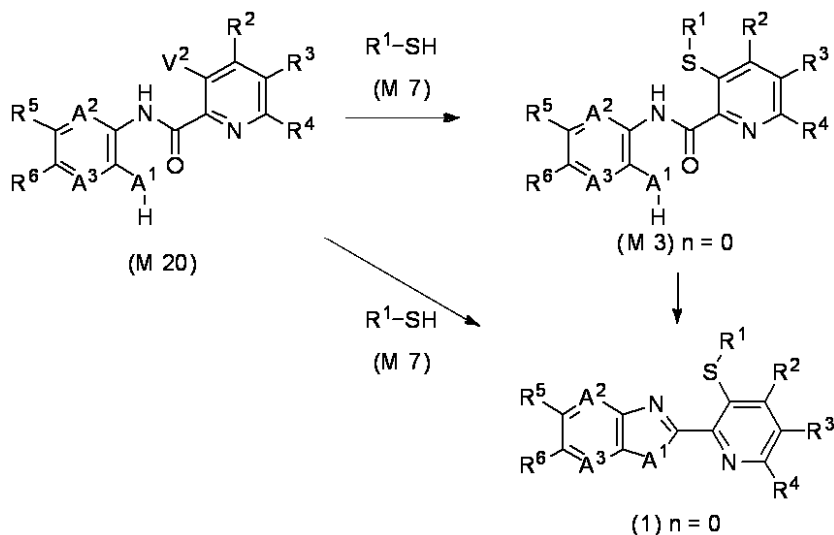
また、中間体化合物(M2)に代えて中間体化合物(M39)を用い、製造法2工程の方法に準じて、中間体化合物(M6)を一段階反応(ワンポット)で製造することもできる。

該反応において V^2 としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

【0124】

(製造法7)

中間体化合物(M20)と化合物(M7)とを反応させることにより、式(M3)においてnが0である中間体化合物(M3)を製造することができる。また、得られた中間体化合物(M3)を分子内で縮合させることにより、式(1)においてnが0である本発明化合物(1)を製造することができる。



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す]

中間体化合物(M6)に代えて中間体化合物(M20)を用い、製造法5の方法に準じて、nが0である中間体化合物(M3)を製造することができる。

中間体化合物(M3)に代えてnが0である中間体化合物(M3)を用い、製造法2の方法に準じて、nが0である本発明化合物(1)を製造することができる。

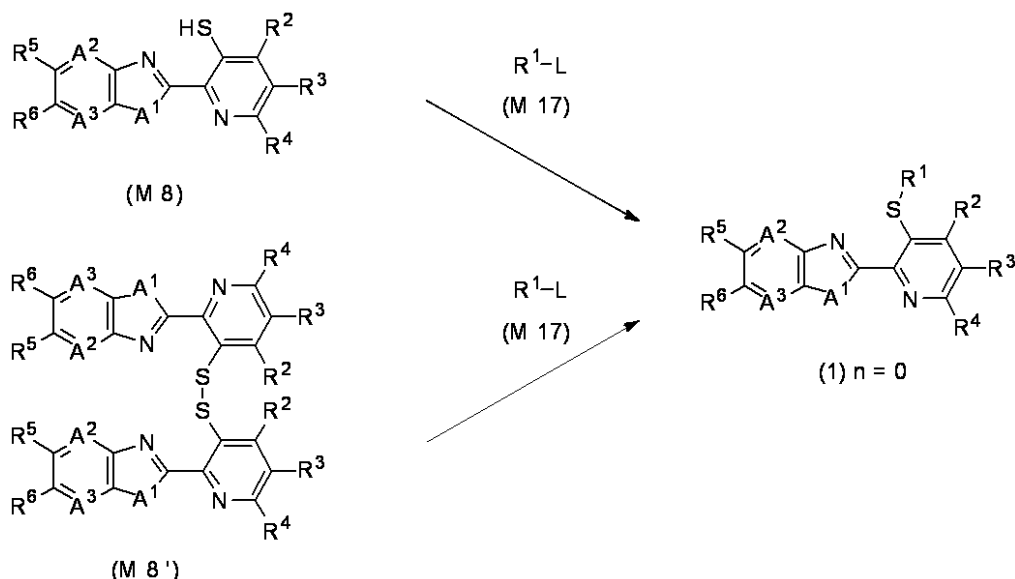
また、中間体化合物(M6)に代えて中間体化合物(M20)を用い、製造法5工程の方法に準じて、nが0である本発明化合物(1)を一段階反応(ワンポット)で製造することもできる。

該反応において V^2 としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

【0125】

(製造法8)

式(1)においてnが0である本発明化合物(1)は、中間体化合物(M8)又はそのジスルフィド体である中間体化合物(M8')と、化合物(M17)とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。



10

〔式中、Lは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基及びメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

ジスルフィド体である中間体化合物(M8')を用いる場合には、通常還元剤の存在下で行われる。

反応に用いられる還元剤としては、例えばヒドロキシメタンスルフィン酸ナトリウム(商品名ロングリット)が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M8)1モルに対して、化合物(M17)が通常1~10モルの割合、塩基が通常1~10モルの割合で用いられる。またジスルフィド体である中間体化合物(M8')を用いる場合には、中間体化合物(M8')1モルに対して、化合物(M17)が通常2~10モルの割合、塩基が通常2~10モルの割合、還元剤が通常1~5モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

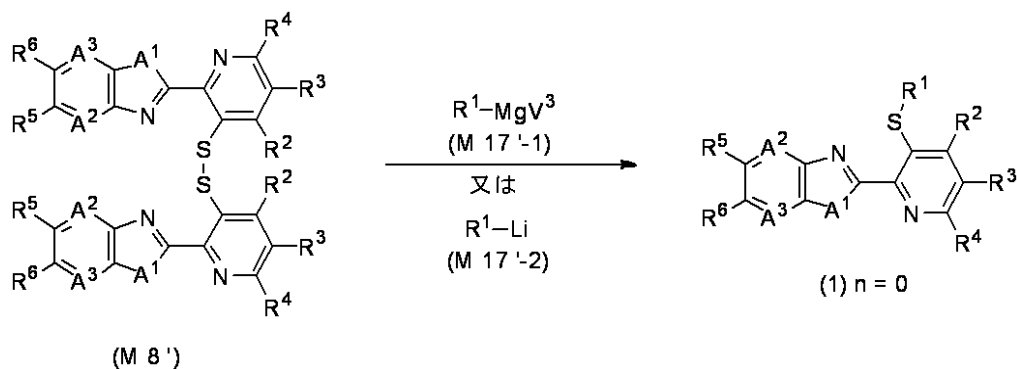
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、nが0である本発明化合物(1)を単離することができる。単離されたnが0である本発明化合物(1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

40

【0126】

(製造法9)

式(1)においてnが0である本発明化合物(1)は、中間体化合物(M8')と化合物(M17'-1)又は化合物(M17'-2)とを反応させることにより製造することができる。



10

〔式中、 V^3 は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。〕

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M 8') 1モルに対して、化合物(M 17'-1)が通常1~2モルの割合で用いられる。また化合物(M 17'-2)を用いる場合には、中間体化合物(M 8') 1モルに対して、化合物(M 17'-2)が通常1~2モルの割合で用

20

いられる。該反応の反応温度は、通常-80~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

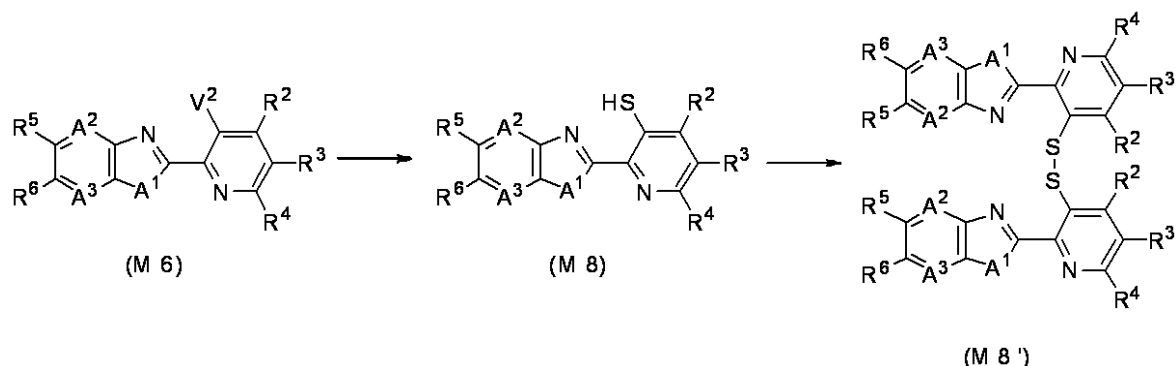
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、 n が0である本発明化合物(1)を単離することができる。単離された n が0である本発明化合物(1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0127】

(製造法10)

中間体化合物(M 6)と硫化剤とを反応させることにより、中間体化合物(M 8)を製造することができる。また、中間体化合物(M 8)を酸化することによりそのジスルフィド体である中間体化合物(M 8')を製造することができる。

30



40

〔式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。〕

化合物(M 7)に代えて硫化ナトリウム、硫化水素ナトリウム又は硫化水素等を用い、製造法5の方法に準じて、中間体化合物(M 8)を製造することができる。

ここで、中間体化合物(M 8)から中間体化合物(M 8')への反応は起こりやすく、中間体化合物(M 8)の合成中に中間体化合物(M 8')が生成する場合もある。

該反応において V^2 としては、フッ素原子又は塩素原子が好ましい。

【0128】

中間体化合物(M 8')は中間体化合物(M 8)を酸化剤の存在下に反応させることに

50

より製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール等のアルコール類、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、酢酸等のカルボン酸類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば酸素、ヨウ素、過酸化水素水、フェリシアン化カリウム等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M8) 1モルに対して、酸化剤が通常0.5～10モルの割合で用いられる。

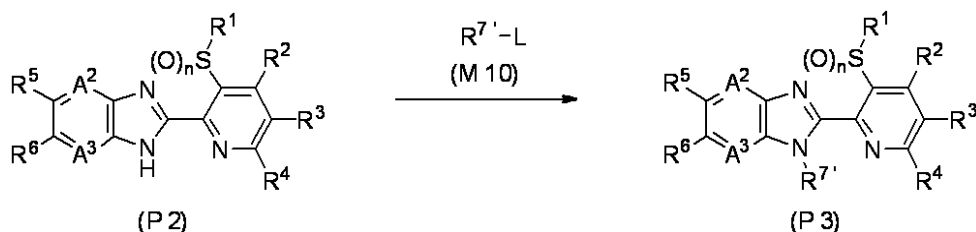
該反応の反応温度は、通常0～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M8')を単離することができる。単離された中間体化合物(M8')は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0129】

(製造法11)

式(1)においてA¹が-NH-である本発明化合物(P2)と、化合物(M10)とを塩基の存在下に反応させることにより、式(1)においてA¹が-NR^{7'}-である本発明化合物(P3)製造することができる。



[式中、R^{7'}は式(1)におけるR⁷のうちの水素原子以外のいずれかを表し、Lは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基及びメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基等が挙げられる。

該反応には、本発明化合物(P2) 1モルに対して、化合物(M10)が通常1～5モルの割合で用いられ、塩基が通常1～3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

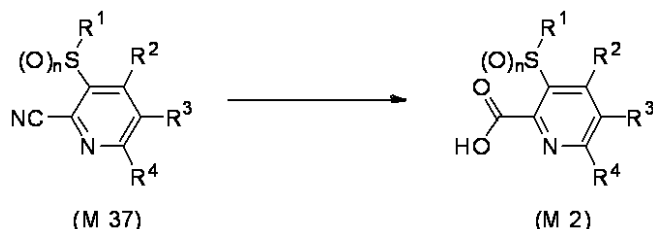
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(P3)を単離することができる。単離された本発明化合物(P3)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0130】

(製造法12)

中間体化合物(M2)は、中間体化合物(M37)を加水分解することにより製造する

ことができる。



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

酸で加水分解する場合、該反応は通常酸の水溶液を溶媒として行われる。

10

反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、硝酸、リン酸、硫酸等の鉱酸類、酢酸、トリフルオロ酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

該反応の反応温度は、通常0～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M 2)を単離することができる。単離された中間体化合物(M 2)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。塩基で加水分解する場合、該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

20

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M 37)1モルに対して、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

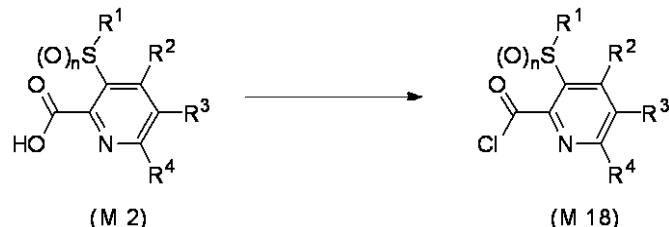
反応終了後は、反応液を酸性にした後、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(M 2)を単離することができる。単離された中間体化合物(M 2)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

30

【0131】

(製造法13)

中間体化合物(M 18)は、中間体化合物(M 2)を塩素化剤の存在下に反応させることにより製造することができる。



40

[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩素化剤としては、塩化チオニル、二塩化オキサリル、オキシ塩化リン等が挙げられる。

50

該反応には、中間体化合物（M 2）1 モルに対して、塩素化剤が通常 1 ～ 5 モルの割合で用いられる。

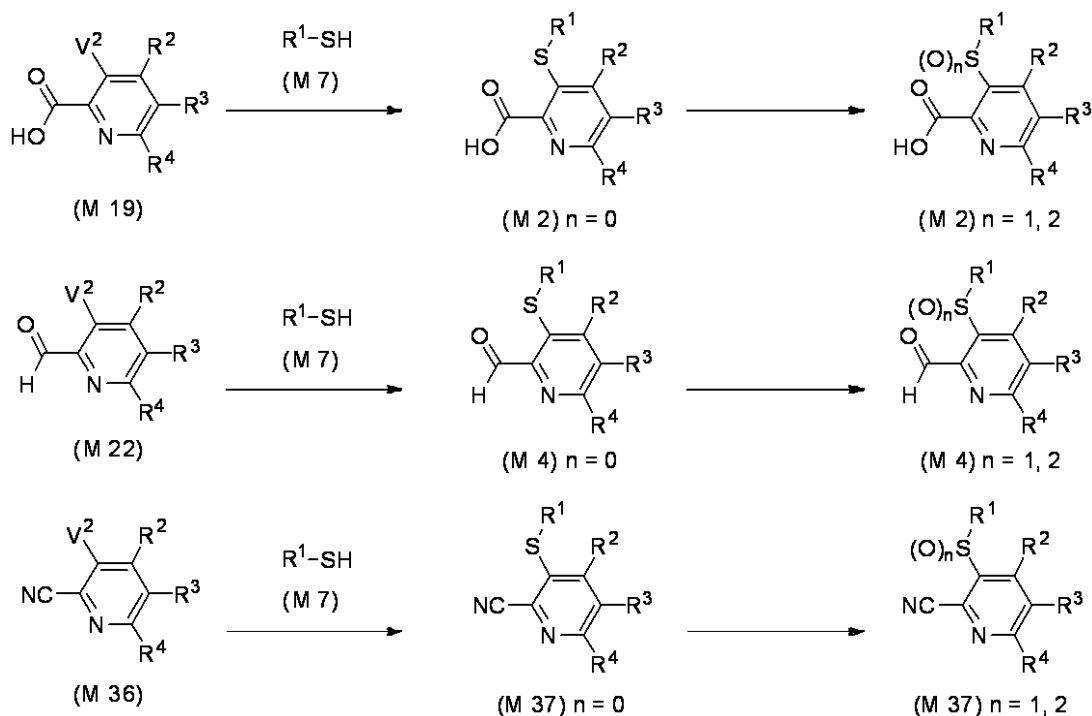
該反応の反応温度は、通常 0 ～ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ～ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、溶媒を留去することにより、中間体化合物（M 18）を単離することができる。

【0132】

（製造法 14）

中間体化合物（M 2）、中間体化合物（M 4）もしくは中間体化合物（M 37）は、それぞれ、中間体化合物（M 19）、中間体化合物（M 22）もしくは中間体化合物（M 36）と、化合物（M 7）とを反応させ、必要に応じて得られた化合物を酸化することによって製造することができる。



[式中、V²はハロゲン原子を表し、その他の記号は式（1）と同じ意味を表す。]

中間体化合物（M 6）に代えて中間体化合物（M 19）を用い、製造法 5 の方法に準じて、n が 0 である中間体化合物（M 2）を製造することができる。

中間体化合物（M 6）に代えて中間体化合物（M 22）を用い、製造法 5 の方法に準じて、n が 0 である中間体化合物（M 4）を製造することができる。

中間体化合物（M 6）に代えて中間体化合物（M 36）を用い、製造法 5 の方法に準じて、n が 0 である中間体化合物（M 37）を製造することができる。

【0133】

n が 0 である本発明化合物（1）に代えて n が 0 である中間体化合物（M 2）を用い、製造法 1 の方法に準じて、n が 1 又は 2 である中間体化合物（M 2）を製造することができる。

n が 0 である本発明化合物（1）に代えて n が 0 である中間体化合物（M 4）を用い、製造法 1 の方法に準じて、n が 1 又は 2 である中間体化合物（M 4）を製造することができる。

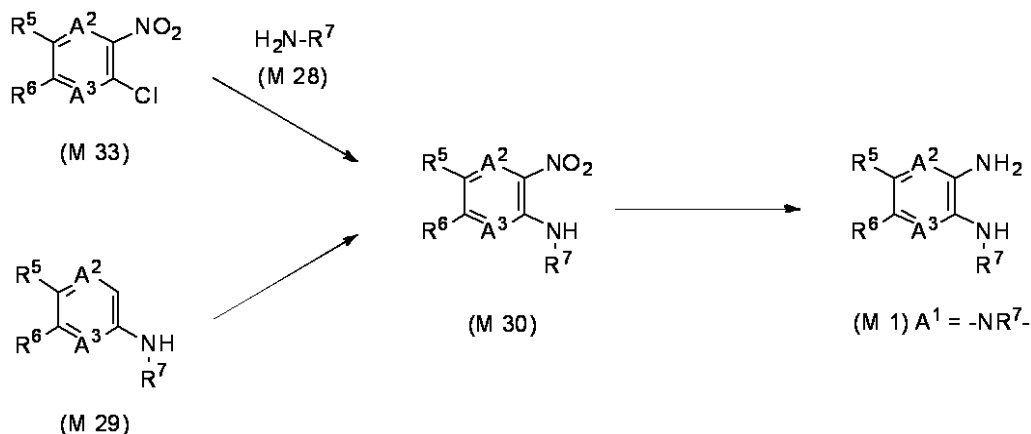
n が 0 である本発明化合物（1）に代えて n が 0 である中間体化合物（M 37）を用い、製造法 1 の方法に準じて、n が 1 又は 2 である中間体化合物（M 37）を製造することができる。

該反応において V²としては、フッ素原子、塩素原子が好ましい。

【0134】

(製造法 15)

中間体化合物 (M 29) をニトロ化するか、あるいは、中間体化合物 (M 33) と化合物 (M 28) とを反応させることにより、中間体化合物 (M 30) を製造することができる。ここで得られた中間体化合物 (M 30) を還元することにより、式 (M 1) において A^1 が $-NR^7-$ である中間体化合物 (M 1) を製造することができる。



10

[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

【0135】

中間体化合物 (M 30) は、中間体化合物 (M 33) と化合物 (M 28) とを塩基の存在下

20

に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。
 反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO 等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩類、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類が挙げられる。

30

該反応には、中間体化合物 (M 33) 1 モルに対して、化合物 (M 28) が通常 1 ~ 10 モルの割合、塩基が通常 0 ~ 10 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 150 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.5 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物 (M 30) を単離することができる。単離された中間体化合物 (M 30) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0136】

40

中間体化合物 (M 30) は、中間体化合物 (M 29) をニトロ化剤の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、酢酸、濃硫酸、濃硝酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるニトロ化剤としては、例えば濃硝酸等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 (M 29) 1 モルに対して、ニトロ化剤が通常 1 ~ 3 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 -10 ~ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

50

反応終了後は、反応混合物を水に注加し、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物 (M 3 0) を単離することができる。単離された中間体化合物 (M 3 0) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

また、式 (M 3 0) において R^7 が水素原子である場合には、化合物 (P 2) に代えて R^7 が水素原子である中間体化合物 (M 3 0) を用い、製造法 1 1 の方法に準じて、式 (M 3 0) において R^7 が水素原子以外の化合物を製造することもできる。

【0137】

A^1 が $-NR^7-$ である中間体化合物 (M 1) は、中間体化合物 (M 3 0) と水素とを、水素添加触媒の存在下に反応させることにより製造することができる。

10

該反応は、通常 1 ~ 100 気圧の水素雰囲気下、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる水素添加触媒としては、例えばパラジウム炭素、水酸化パラジウム、ラネーニッケル、酸化白金等の遷移金属化合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 (M 3 0) 1 モルに対して、水素が通常 3 モルの割合、水素添加触媒が通常 0.001 ~ 0.5 モルの割合で用いられる。

20

該反応は、必要に応じて酸、塩基等を加えて行うこともできる。

反応に用いられる酸としては、酢酸、塩酸等が挙げられ、反応に用いられる塩基としては、トリエチルアミン等の第 3 級アミン類、酸化マグネシウム等が挙げられる。

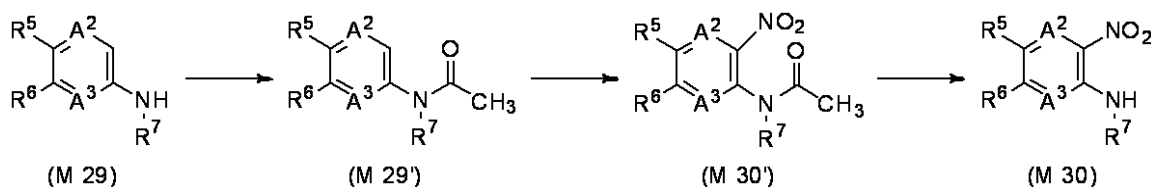
該反応の反応温度は、通常 -20 ~ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物をろ過し、必要に応じて有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、 A^1 が $-NR^7-$ である中間体化合物 (M 1) を単離することができる。単離された A^1 が $-NR^7-$ である中間体化合物 (M 1) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0138】

また中間体化合物 (M 3 0) は、以下に示すように中間体化合物 (M 2 9) をアセチル化して中間体化合物 (M 2 9') を製造した後、得られた中間体化合物 (M 2 9') をニトロ化して中間体化合物 (M 3 0') を製造し、得られた中間体化合物 (M 3 0') を加水分解することにより製造することもできる。

30



[式中、記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

中間体化合物 (M 2 9') は、中間体化合物 (M 2 9) をアシル化剤の存在下に反応させることにより製造することができる。

40

該反応は、通常溶媒の存在下もしくはアシル化剤を溶媒として用いて行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるアシル化剤としては、例えば無水酢酸、パラアセトキシニトロベンゼン等が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

50

反応に用いられる塩基としては、例えばトリエチルアミン、N，N－ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類及びピリジン、4－ジメチルアミノピリジン等の含窒素芳香族化合物類が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（M29）1モルに対して、アセチル化剤が通常1モル以上の割合、塩基が通常0.1～10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物（M29'）を単離することができる。単離された中間体化合物（M29'）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することも

10

【0139】

中間体化合物（M29）に代えて、中間体化合物（M29'）を用い、製造法15の方法に準じて、中間体化合物（M30'）を製造することができる。

【0140】

中間体化合物（M30）は中間体化合物（M30'）を酸または塩基の存在下で加水分解することにより製造することができる。

【0141】

酸で加水分解する場合、該反応は通常酸の水溶液を溶媒として行われる。

反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、硫酸等の鉱酸類、酢酸、トリフルオロ酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

該反応の反応温度は、通常0～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物（M30）を単離することができる。単離された中間体化合物（M30）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0142】

塩基で加水分解する場合、該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1，4－ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、ヒドラジン等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（M30'）1モルに対して、塩基が通常1～10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

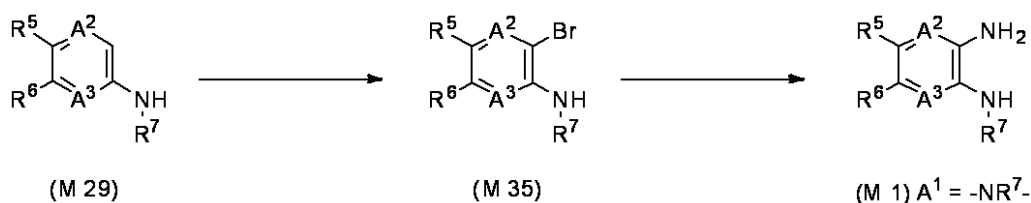
反応終了後は、反応液を酸性にした後、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物（M30）を単離することができる。単離された中間体化合物（M30）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

40

【0143】

（製造法16）

中間体化合物（M29）を臭素化することにより中間体化合物（M35）を製造した後、得られた中間体化合物（M35）をアミノ化することにより、式（M1）においてA¹が－NR⁷－である中間体化合物（M1）を製造することができる。



[式中、記号は式(1)と同じ意味を表す。]

中間体化合物(M 35)は、中間体化合物(M 29)と臭素化剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば水、酢酸、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる臭素化剤としては、例えばN-ブロモスクシンイミド、臭素が挙げられる。

中間体化合物(M 29) 1モルに対して、臭素化剤が通常1～3モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-10～100℃の範囲であり、反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を水に注加してから有機溶媒抽出し、有機層を濃縮する；反応混合物を水に注加して生じた固体を濾過により集める；又は、反応混合物中に生成した固体を濾過により集めることにより中間体化合物(M 35)を単離することができる。単離された中間体化合物(M 35)は、再結晶、クロマトグラフィー等により更に精製することもできる。

【0144】

A¹が-NR⁷-である中間体化合物(M 1)は、中間体化合物(M 35)とアミノ化剤とを銅化合物の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール等のアルコール類、1,4-ジオキサン、ジエチルエーテル、THF等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、ピリジン、キノリン等の含窒素芳香族化合物類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるアミノ化剤としては、例えばアンモニア、アンモニア水、リチウムアミドが挙げられる。

反応に用いられる銅化合物としては、例えば銅、ヨウ化銅(I)、酸化銅(I)、酸化銅(II)、アセチルアセトン銅(II)、酢酸銅(II)、硫酸銅(II)等が挙げられる。

該反応は、必要に応じて配位子を加えて行うこともできる。

反応に用いられる配位子としては、例えばアセチルアセトン、サレン、フェナントロリン等が挙げられる。

該反応は、必要に応じて塩基を加えて行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、例えばピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、DBU、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]-5-ノネン等の含窒素複素環化合物、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン等の第3級アミン類、りん酸三カリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水酸化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。

中間体化合物(M 35) 1モルに対して、アミノ化剤が通常1～5モルの割合で用いら

【0147】

A¹が硫黄原子である中間体化合物(M1)は、中間体化合物(M34)と還元剤とを反応させることにより製造することができる。

該還元反応は例えば鉄粉、亜鉛粉末等の金属粉；塩酸、酢酸等の酸；及び水の存在下で行うことができる。

該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

該反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる還元剤としては、例えば鉄粉、亜鉛粉及び二塩化スズ等の金属粉が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(M34)1モルに対して、金属粉が通常3～10モルの割合で用いられる。

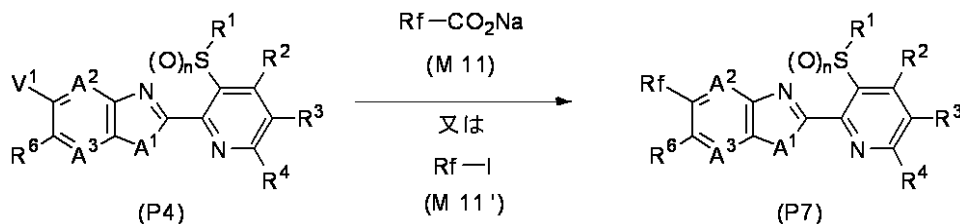
該反応の反応温度は通常0～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物に水を加えた後、有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、A¹が硫黄原子である中間体化合物(M1)を単離することができる。単離されたA¹が硫黄原子である中間体化合物(M1)は、クロマトグラフィー、再結晶等により精製することもできる。

【0148】

(製造法19)

式(1)においてR⁵がC1-C6パーフルオロアルキル基である本発明化合物(P7)は、式(1)においてR⁵がハロゲン原子である本発明化合物(P4)と、化合物(M11)又は化合物(M11')とを、銅化合物の存在下に反応させることにより製造することができる。



[式中、V¹はハロゲン原子を表し、RfはC1-C6パーフルオロアルキル基を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる銅化合物としては、例えば銅、ヨウ化銅(I)が挙げられる。

該反応において化合物(M11)を用いる場合、本発明化合物(P4)1モルに対して、化合物(M11)が通常1～10モルの割合、銅化合物が通常0.5～10モルの割合で用いられ、該反応の反応温度は、通常100～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～48時間の範囲である。

該反応において中間体化合物(M11')を用いる場合、フッ化カリウムを加えても良い。本発明化合物(P4)1モルに対して、化合物(M11')が通常1～10モルの割合、銅化合物が通常0.1～10モルの割合、フッ化カリウムが通常0.1～5モルの割合で用いられ、該反応の反応温度は、通常0～150℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～48時間の範囲である。

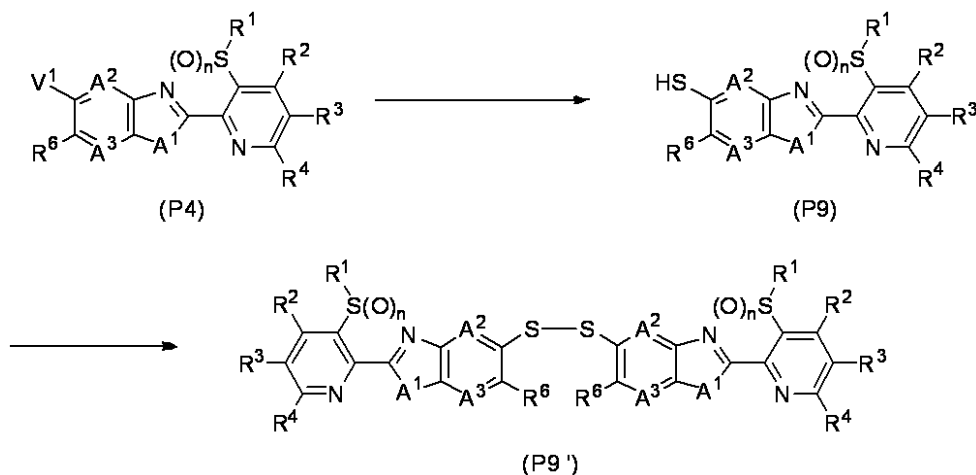
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(P7)を単離することができる。単離された本発明化合物(P7)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応において V^1 としては、臭素原子、ヨウ素原子が好ましい。

【0149】

(製造法20)

本発明化合物(P4)と硫化剤とを反応させることにより、式(1)において R^5 が $-SH$ である本発明化合物(P9)を製造することができる。また、本発明化合物(P9)を酸化することにより、そのジスルフィド体である中間体化合物(P9')を製造することができる。



[式中、 V^1 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

本発明化合物(P9)は、本発明化合物(P4)をチオール化剤及び触媒の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるチオール化剤としては、例えば硫化ナトリウム、硫化ナトリウム9水和物、チオウレアが挙げられる。

反応に用いられる触媒としては、例えば塩化銅(I)、臭化銅(I)、ヨウ化銅(I)が挙げられる。

該反応は、必要に応じて配位子を加えて行うこともできる。

反応に用いられる配位子としては、例えばアセチルアセトン、サレン、フェナントロリン等が挙げられる。

該反応は必要に応じて塩基の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウム等の無機塩基、トリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

該反応には、本発明化合物(P4)1モルに対して、チオール化剤が通常1~10モルの割合、触媒が通常0.1~5モルの割合、配位子が通常0.1~5モルの割合、塩基が通常1モル~2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(P9)を単離することができる。単離された本発明化合物(P9)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。該反応において V^1 としては、臭素原子、ヨウ素原子が好ましい。

ここで、本発明化合物(P9)から中間体化合物(P9')への反応は起こりやすく、本発明化合物(P9)の合成中に中間体化合物(P9')が生成する場合もある。

【0150】

中間体化合物(P9')は本発明化合物(P9)を酸化剤の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール等のアルコール類、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、*tert*-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒、酢酸等のカルボン酸類及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えば酸素、ヨウ素、過酸化水素水、フェリシアン化カリウム等が挙げられる。

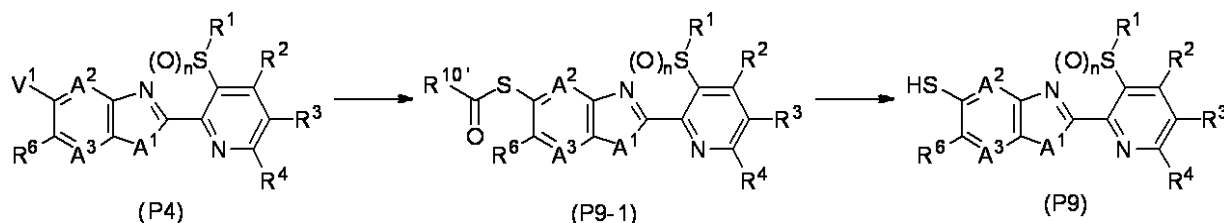
該反応には、本発明化合物(P9) 1モルに対して、酸化剤が通常0.5~10モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常0~100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(P9')を単離することができる。単離された中間体化合物(P9')は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0151】

また本発明化合物(P9)は、本発明化合物(P4)をチオエステル化して中間体化合物(P9-1)を製造した後、得られた中間体化合物(P9-1)を加水分解することにより製造することができる。



[式中、 $R^{10'}$ は式(1)における R^{10} のうちの水素原子以外のいずれかを表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

中間体化合物(P9-1)は、本発明化合物(P4)をチオエステル化剤、塩基及び触媒の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられるチオエステル化剤としては、例えばチオ安息香酸等が挙げられる。

反応に用いられる触媒としては、例えば塩化銅(I)、臭化銅(I)、ヨウ化銅(I)が挙げられる。

該反応は、必要に応じて配位子を加えて行うこともできる。

反応に用いられる配位子としては、例えばアセチルアセトン、サレン、フェナントロリン等が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウム等の無機塩基、トリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

該反応には、本発明化合物(P4) 1モルに対して、チオエステル化剤が通常1~10モルの割合、触媒が通常0.1~5モルの割合、配位子が通常0.1~5モルの割合、塩基が通常1モル~2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50~200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5~24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(P9-1)を単離することができる。単離された中間体化合物(P9-1)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応において V^1 としては、臭素原子、ヨウ素原子が好ましい。

【0152】

本発明化合物（P9）は中間体化合物（P9-1）を加水分解することにより製造することができる。

酸で加水分解する場合、該反応は通常酸の水溶液を溶媒として行われる。

反応に用いられる酸としては、例えば塩酸、硝酸、リン酸、硫酸等の鉱酸類、酢酸、トリフルオロ酢酸等のカルボン酸類が挙げられる。

該反応の反応温度は、通常 $0 \sim 100^\circ\text{C}$ の範囲である。該反応の反応時間は通常 $0.1 \sim 24$ 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（P9）を単離することができる。単離された本発明化合物（P9）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。塩基で加水分解する場合、該反応は通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（P9-1）1モルに対して、塩基が通常 $1 \sim 10$ モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 $0 \sim 120^\circ\text{C}$ の範囲である。該反応の反応時間は通常 $0.1 \sim 24$ 時間の範囲である。

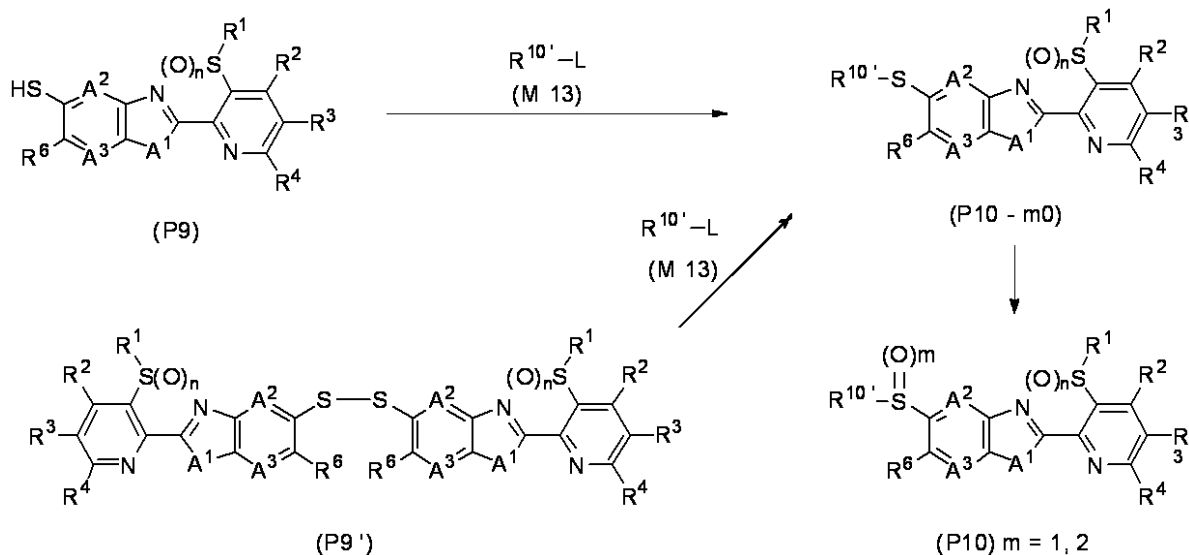
反応終了後は、反応液を酸性にした後、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（P9）を単離することができる。単離された本発明化合物（P9）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

ここで、本発明化合物（P9）から中間体化合物（P9'）への反応は起こりやすく、本発明化合物（P9）の合成中に中間体化合物（P9'）が生成する場合もある。

【0153】

（製造法21）

本発明化合物（P9）又はそのジスルフィド体である中間体化合物（P9'）と、化合物（M13）とを反応させ、 R^5 が $-S(O)_m R^{10'}$ であり、 m が0である本発明化合物（P10-m0）を製造することができる。 m が0である本発明化合物（P10-m0）を酸化することにより、式（1）において R^5 が $-S(O)_m R^{10'}$ であり、 m が1又は2である本発明化合物（P10）を製造することができる。



[式中、 $R^{10'}$ は式 (1) における R^{10} のうちの水素原子以外のいずれかを表し、 L は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基及びメタンスルホニルオキシ基等の脱離基を表し、その他の記号は式 (1) と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO 等の非プロトン性極性溶媒、及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

ジスルフィド体である中間体化合物 ($P9'$) を用いる場合には、通常還元剤の存在下で行われる。

反応に用いられる還元剤としては、例えばヒドロキシメタンスルフィン酸ナトリウム (商品名ロングリット) が挙げられる。

該反応には、本発明化合物 ($P9$) 1 モルに対して、化合物 ($M13$) が通常 1 ~ 10 モルの割合、塩基が通常 1 ~ 10 モルの割合で用いられる。

またジスルフィド体である中間体化合物 ($P9'$) を用いる場合には、中間体化合物 ($P9'$) 1 モルに対して、化合物 ($M13$) が通常 2 ~ 10 モルの割合、塩基が通常 2 ~ 10 モルの割合、還元剤が 1 ~ 5 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 0 ~ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、 m が 0 である本発明化合物 ($P10-m0$) を単離することができる。単離された m が 0 である本発明化合物 ($P10-m0$) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0154】

また、 m が 0 である本発明化合物 ($P10-m0$) のうち、 $R^{10'}$ が C1 - C6 パーフルオロアルキルである化合物は、中間体化合物 ($P9'$)、ヨウ化パーフルオロアルキル及び還元剤とを反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1, 4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO 等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる還元剤としては、例えばテトラキス (ジメチルアミノ) エチレンが挙げられる。

ヨウ化パーフルオロアルキルとしては、例えばヨウ化トリフルオロメタン、ヨウ化ペンタフルオロエタン、ヘプタフルオロ-2-ヨードプロパン等が挙げられる。

該反応には、中間体化合物 ($P9'$) 1 モルに対して、ヨウ化パーフルオロアルキルが通常 2 ~ 10 モルの割合、還元剤が 1 ~ 5 モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常 -80 ~ 50 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0.1 ~ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、 m が 0 である本発明化合物 ($P10-m0$) を単離することができる。単離された m が 0 である本発明化合物 ($P10-m0$) は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0155】

本発明化合物 ($P10$) において、 m が 1 又は 2 である本発明化合物は、 m が 0 である本発明化合物 ($P10-m0$) を酸化剤の存在下に反応させることにより製造することがで

きる。

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる酸化剤としては、例えばm-クロロ過安息香酸又は過酸化水素水が挙げられる。

該反応は必要に応じて触媒の存在下で行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えばタングステン酸ナトリウムが挙げられる。

該反応には、1モルのmが0である本発明化合物（P10-m0）に対して、酸化剤が通常1～5モルの割合、触媒が通常0.01～0.5モルの割合で用いられる。

10

mが1である化合物は、1モルのmが0である本発明化合物（P10-m0）に対して、酸化剤が通常0.8～1.2モルの割合、触媒が通常0.05～0.2モルの割合で用いられ、mが2である化合物は、1モルのmが0である本発明化合物（P10-m0）に対して、酸化剤が通常1.8～5モルの割合、触媒が通常0.05～0.2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常-20～120℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～12時間の範囲である。

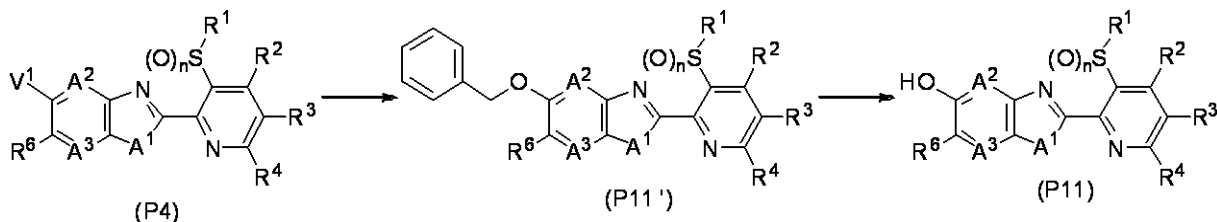
反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を必要に応じて還元剤（例えば亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム）の水溶液、塩基（例えば炭酸水素ナトリウム）の水溶液で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、mが1又は2である本発明化合物（P10）を単離することができる。単離されたmが1又は2である本発明化合物（P10）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

20

【0156】

（製造法22）

式（1）においてR⁵が-OHである本発明化合物（P11）は、本発明化合物（P4）から中間体化合物（P11'）を経て製造することができる。



30

〔式中、V¹はハロゲン原子を表し、その他の記号は式（1）と同じ意味を表す。〕

中間体化合物（P11'）は、本発明化合物（P4）とベンジルアルコールとを塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常溶媒の存在下もしくはベンジルアルコールを溶媒として行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばトルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

40

該反応は、必要に応じて触媒を加えて行うこともできる。

反応に用いられる触媒としては、例えば塩化銅（I）、臭化銅（I）、ヨウ化銅（I）が挙げられる。

該反応は、必要に応じて配位子を加えて行うこともできる。

反応に用いられる配位子としては、例えばアセチルアセトン、サレン、フェナントロリン等が挙げられる。

該反応は通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸セシウム、リン酸三カリウム等の無機塩基が挙げられる。

該反応には、本発明化合物（P4）1モルに対して、ベンジルアルコールが通常1～1

50

0モルの割合、触媒が通常0.1～5モルの割合、配位子が通常0.1～5モルの割合、塩基が通常1モル～2モルの割合で用いられる。

該反応の反応温度は、通常50～200℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物(P11')を単離することができる。単離された中間体化合物(P11')は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

該反応においてV¹としては、臭素原子、ヨウ素原子が好ましい。

【0157】

本発明化合物(P11)は、中間体化合物(P11')と水素とを、水素添加触媒の存在下に反応させることにより製造することができる。

該反応は、通常1～100気圧の水素雰囲気下、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸ブチル等のエステル類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる水素添加触媒としては、例えばパラジウム炭素、水酸化パラジウム、ランーニッケル、酸化白金等の遷移金属化合物が挙げられる。

該反応には、中間体化合物(P11')1モルに対して、水素が通常3モルの割合、水素添加触媒が通常0.001～0.5モルの割合で用いられる。

該反応は、必要に応じて酸、塩基等を加えて行うこともできる。

反応に用いられる酸としては、酢酸、塩酸等が挙げられ、反応に用いられる塩基としては、トリエチルアミン等の第3級アミン類、酸化マグネシウム等が挙げられる。

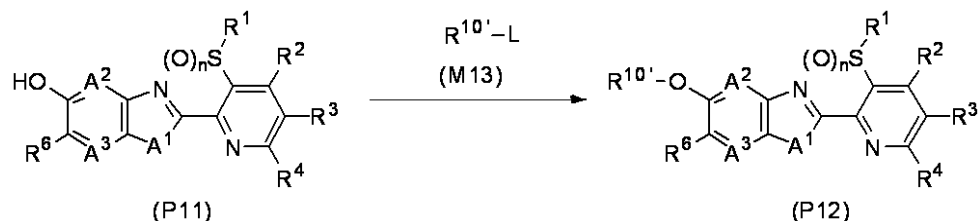
該反応の反応温度は、通常-20～100℃の範囲である。該反応の反応時間は通常0.1～24時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物をろ過し、必要に応じて有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物(P11)を単離することができる。単離された本発明化合物(P11)は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0158】

(製造法23)

式(1)においてR⁵が-OR^{10'}である本発明化合物(P12)は、本発明化合物(P11)と化合物(M13)とを反応させることにより製造することができる。



[式中、R^{10'}は式(1)におけるR¹⁰のうちの水素原子以外のいずれかを表し、その他の記号は式(1)と同じ意味を表す。]

該反応は、通常溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばTHF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、1,4-ジオキサン等のエーテル類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、アセトニトリル等のニトリル類、DMF、NMP、DMSO等の非プロトン性極性溶媒及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等のアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水素化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基、又はトリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

該反応には、本発明化合物（P 1 1）1 モルに対して、化合物（M 1 3）が通常 1 ～ 10 モルの割合、塩基が通常 1 ～ 10 モルの割合で用いられる。

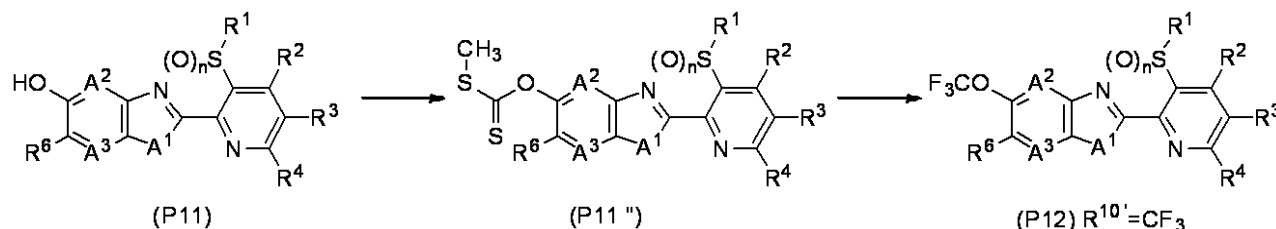
該反応の反応温度は、通常 0 ～ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0 . 1 ～ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、本発明化合物（P 1 2）を単離することができる。単離された本発明化合物（P 1 2）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0159】

また、本発明化合物（P 1 2）のうち、 $R^{10'}$ がトリフルオロメチル基である本発明化合物（P 1 2）は、以下の製造法により製造することができる。

10



[式中、記号は式（1）と同じ意味を表す。]

中間体化合物（P 1 1 ''）は、本発明化合物（P 1 1）を、塩基、二硫化炭素及びメチル化剤と反応させることにより製造することができる。

20

該反応は、溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えば DMF、NMP、DMSO 等の非プロトン性極性溶媒が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば水素化ナトリウム等のアルカリ金属水素化物類が挙げられる。

反応に用いられるメチル化剤としては、例えばヨウ化メチルが挙げられる。

該反応には、本発明化合物（P 1 1）1 モルに対して、塩基が通常 1 ～ 2 モルの割合、二硫化炭素が通常 1 ～ 10 モルの割合、メチル化剤が通常 1 ～ 10 モルの割合で用いられる。

30

該反応の反応温度は、通常 0 ～ 100 °C の範囲である。該反応の反応時間は通常 0 . 5 ～ 24 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、中間体化合物（P 1 1 ''）を単離することができる。単離された中間体化合物（P 1 1 ''）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0160】

本発明化合物（P 1 2）のうち、 $R^{10'}$ がトリフルオロメチル基である本発明化合物（P 1 2）は、中間体化合物（P 1 1 ''）とフッ素化剤とを塩基の存在下に反応させることにより製造することができる。

40

該反応は、溶媒の存在下で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。

該反応は塩基及びフッ素化剤の存在下で行われる。

反応に用いられる塩基としては、例えば 1, 3-ジブロモ-5, 5-ジメチルヒダントインが挙げられる。

反応に用いられるフッ素化剤としては、例えばフッ化テトラ-*n*-ブチルアンモニウム、フッ化水素ピリジン錯体が挙げられる。

該反応には、中間体化合物（P 1 1 ''）1 モルに対して、塩基が通常 1 ～ 10 モルの割合、フッ素化剤が通常 1 ～ 10 モルの割合で用いられる。

50

該反応の反応温度は、通常 $-80 \sim 50^{\circ}\text{C}$ の範囲である。該反応の反応時間は通常 $0.5 \sim 24$ 時間の範囲である。

反応終了後は、反応混合物を有機溶媒で抽出し、有機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、 $\text{R}^{10'}$ がトリフルオロメチル基である本発明化合物（P12）を単離することができる。単離された $\text{R}^{10'}$ がトリフルオロメチル基である本発明化合物（P12）は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0161】

（製造法25）

本発明化合物及び上述の中間体化合物のうち、窒素原子上に孤立電子対を持つ含窒素複素環基を有する化合物と酸化剤とを反応させることにより、場合によって、該窒素原子が酸化されたN-オキシドを製造することができる。

該含窒素複素環基としては、例えばピリジン環が挙げられる。

該反応は、公知の方法で行うことができ、例えばジクロロメタン、クロロホルム、クロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、水及びこれらの混合物等の溶媒中で、m-クロロ過安息香酸又は過酸化水素等の酸化剤を用いて行われる。

【0162】

中間体化合物（M3）としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0163】

式（M3）において、 A^1 が $-\text{NR}^7-$ である化合物；

式（M3）において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式（M3）において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

式（M3）において、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ である化合物；

式（M3）において、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式（M3）において、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が $=\text{CR}^9-$ である化合物；

式（M3）において、 A^1 が $-\text{NR}^7-$ であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ である化合物；

式（M3）において、 A^1 が $-\text{NR}^7-$ であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式（M3）において、 A^1 が $-\text{NR}^7-$ であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が $=\text{CR}^9-$ である化合物；

式（M3）において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ である化合物；

式（M3）において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式（M3）において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が $=\text{CR}^9-$ である化合物；

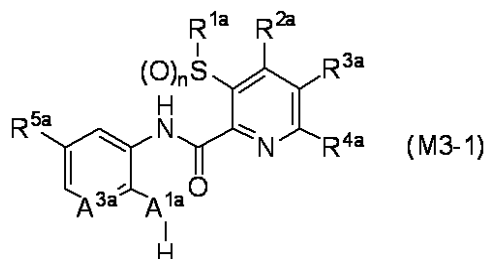
式（M3）において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ である化合物；

式（M3）において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式（M3）において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=\text{CR}^8-$ であり、 A^3 が $=\text{CR}^9-$ である化合物；

【0164】

式（M3-1）



[式中、記号は式（1-1）と同じ意味を表す。]

で示される式 (M3) に記載の化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が酸素原子である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が硫黄原子である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

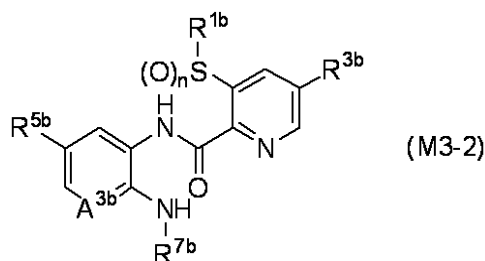
式 (M3-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (M3-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

10

【0165】

式 (M3-2)



[式中、記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

20

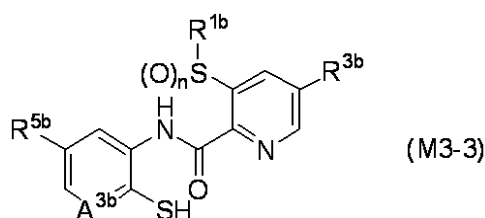
で示される式 (M3-1) に記載の化合物；

式 (M3-2) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (M3-2) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0166】

式 (M3-3)



30

[式中、記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

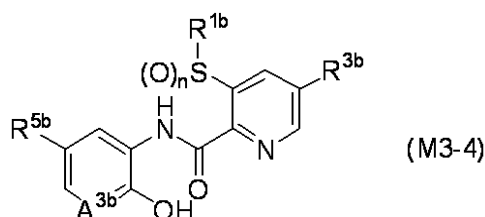
で示される式 (M3-1) に記載の化合物；

式 (M3-3) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (M3-3) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0167】

式 (M3-4)



40

[式中、記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (M3-1) に記載の化合物；

式 (M3-4) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (M3-4) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0168】

中間体化合物 (M6) としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0169】

50

式 (M6) において、 A^1 が $-NR^7-$ である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

式 (M6) において、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (M6) において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (M6) において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物； 10

式 (M6) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

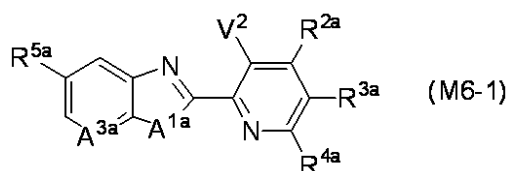
式 (M6) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (M6) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物； 20

【0170】

式 (M6-1)



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-1) と同じ意味を表す。] 30
で示される式 (M6) に記載の化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が酸素原子である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が硫黄原子である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

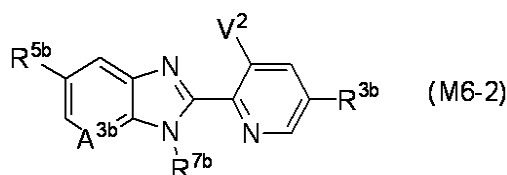
式 (M6-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (M6-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

【0171】

式 (M6-2)



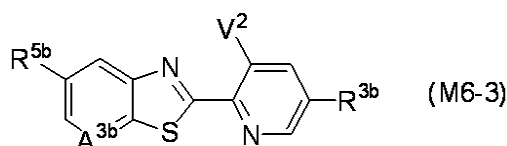
[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。] 40
で示される式 (M6-1) に記載の化合物；

式 (M6-2) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (M6-2) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物； 50

【0172】

式 (M6-3)



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(M6-1)に記載の化合物；

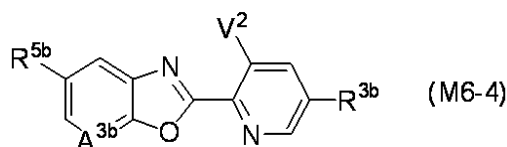
式(M6-3)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(M6-3)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

10

【0173】

式 (M6-4)



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(M6-1)に記載の化合物；

式(M6-4)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(M6-4)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

20

【0174】

中間体化合物(M8)及びそのジスルフィド体(M8')としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0175】

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が $-NR^7-$ である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

30

式(M8)又は式(M8')において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

40

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

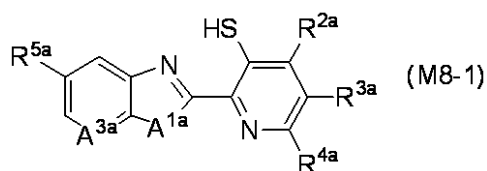
式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M8)又は式(M8')において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

50

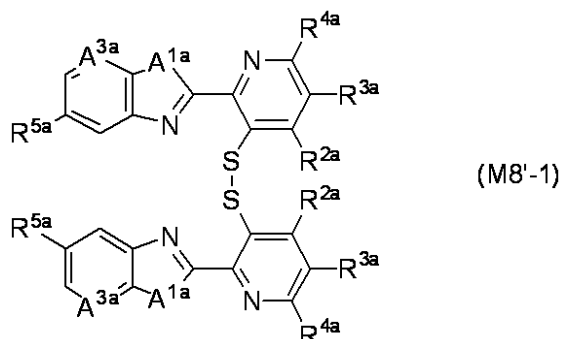
【 0 1 7 6 】

式 (M8-1)



[式中、記号は式(1-1)と同じ意味を表す。]

で示される式(M8)に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式(M8'-1)



[式中、記号は式(1-1)と同じ意味を表す。]

で示される式(M8')に記載の化合物。

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が-NR^{7a}-である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が酸素原子である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が硫黄原子である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が-NR^{7a}-であり、A^{3a}が窒素原子である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が-NR^{7a}-であり、A^{3a}が=C R^{9a}-である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が酸素原子であり、A^{3a}が窒素原子である化合物；

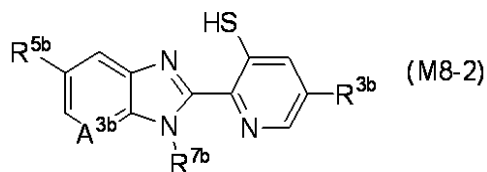
式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が酸素原子であり、A^{3a}が=C R^{9a}-である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が硫黄原子であり、A^{3a}が窒素原子である化合物；

式(M8-1)又は式(M8'-1)において、A^{1a}が硫黄原子であり、A^{3a}が=C R^{9a}-である化合物；

【 0 1 7 7 】

式 (M8-2)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

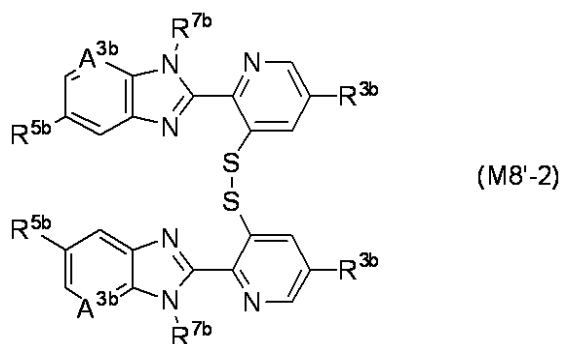
で示される式(M8-1)に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式(M8'-2)

10

20

30

40



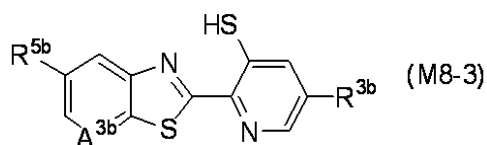
[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]で示される式(M8'-1)に記載の化合物。 10

式(M8-2)又は式(M8'-2)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(M8-2)又は式(M8'-2)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

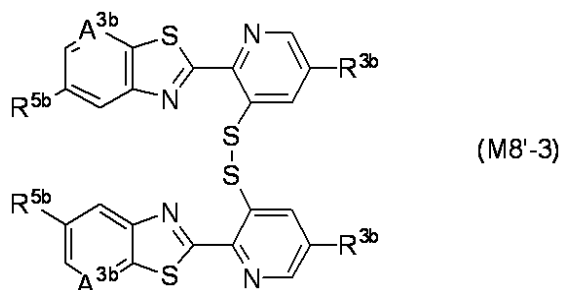
【0178】

式(M8-3)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。] 20

で示される式(M8-1)に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式(M8'-3)



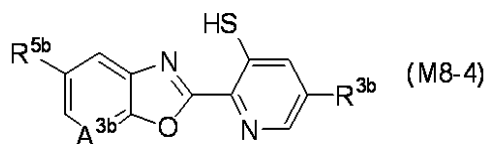
[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]で示される式(M8'-1)に記載の化合物。 30

式(M8-3)又は式(M8'-3)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(M8-3)又は式(M8'-3)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

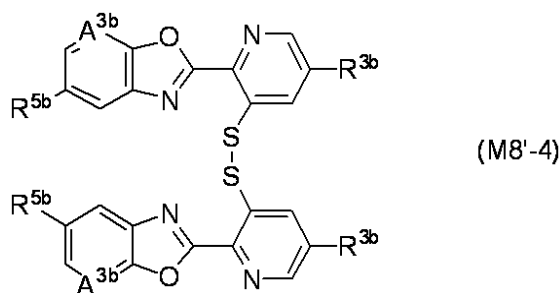
【0179】

式(M8-4)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。] 40

で示される式(M8-1)に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式(M8'-4)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]で示される式(M8'-1)に記載の化合物。

式(M8-4)又は式(M8'-4)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(M8-4)又は式(M8'-4)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0180】

中間体化合物(M20)としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0181】

式(M20)において、 A^1 が $-NR^7-$ である化合物；

式(M20)において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式(M20)において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

式(M20)において、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式(M20)において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M20)において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M20)において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式(M20)において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M20)において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M20)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式(M20)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M20)において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M20)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

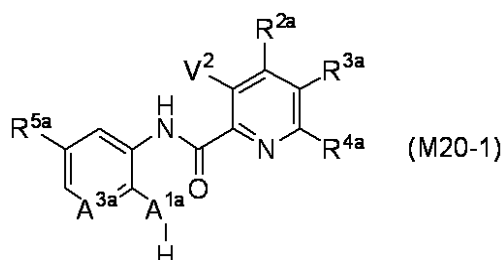
式(M20)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式(M20)において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式(M20)において、 R^2 及び R^4 が水素原子である化合物；

【0182】

式(M20-1)



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式(1-1)と同じ意味を表す。]で示される式(M20)に記載の化合物；

式(M20-1)において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である化合物；

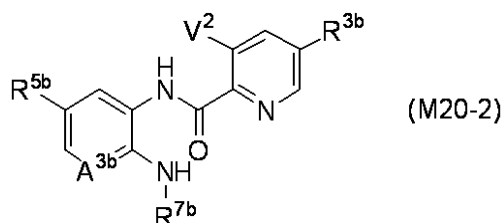
式(M20-1)において、 A^{1a} が酸素原子である化合物；

式 (M20-1) において、 A^{1a} が硫黄原子である化合物；
 式 (M20-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；
 式 (M20-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；
 式 (M20-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；
 式 (M20-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；
 式 (M20-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；
 式 (M20-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；
 式 (M20-1) において、 R^{2a} 及び R^{4a} が水素原子である化合物；

【0183】

式 (M20-2)

10



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (M20-1) に記載の化合物；

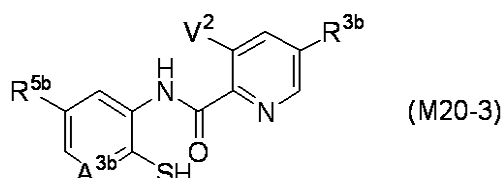
式 (M20-2) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (M20-2) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

20

【0184】

式 (M20-3)



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (M20-1) に記載の化合物；

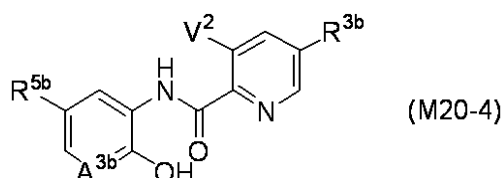
式 (M20-3) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

30

式 (M20-3) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0185】

・ 式 (M20-4)



[式中、 V^2 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (M20-1) に記載の化合物；

40

式 (M20-4) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (M20-4) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0186】

前述のとおり、本発明化合物のうち式 (P4) で示される化合物は、本発明化合物の製造中間体としても用いることができる。式 (1) に記載の本発明化合物 (P4) としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0187】

式 (P4) において、 A^1 が $-NR^7-$ である化合物；

式 (P4) において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式 (P4) において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

50

式 (P 4) において、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (P 4) において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P 4) において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式 (P 4) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (P 4) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P 4) において、 A^1 が $-NR^7-$ であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

・式 (P 4) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

式 (P 4) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

10

式 (P 4) において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

式 (P 4) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

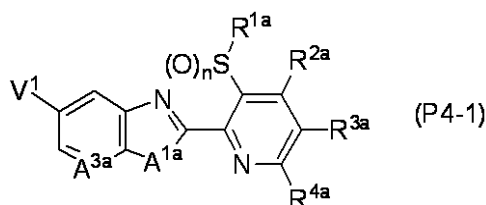
式 (P 4) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P 4) において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

【0188】

式 (P 4-1)

20



[式中、 V^1 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-1) と同じ意味を表す。]
で示される式 (P 4) に記載の化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ である化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が酸素原子である化合物；

30

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が硫黄原子である化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が $-NR^{7a}-$ であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が酸素原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

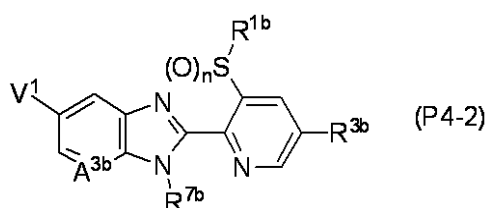
式 (P 4-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式 (P 4-1) において、 A^{1a} が硫黄原子であり、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

【0189】

式 (P 4-2)

40



[式中、 V^1 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]
で示される式 (P 4-1) に記載の化合物；

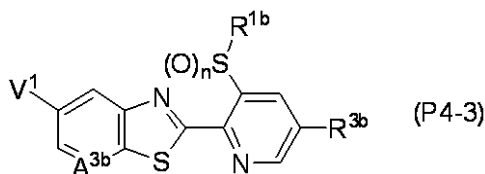
式 (P 4-2) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (P 4-2) において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0190】

50

式 (P 4 - 3)



[式中、 V^1 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1 - 2) と同じ意味を表す。]

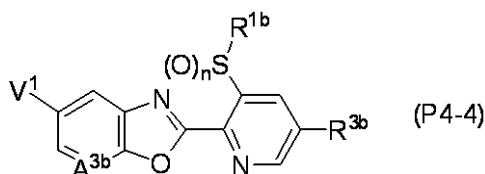
で示される式 (P 4 - 1) に記載の化合物；

式 (P 4 - 3) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (P 4 - 3) において、 A^{3b} が $=C R^{9b}-$ である化合物；

【0191】

式 (P 4 - 4)



[式中、 V^1 はハロゲン原子を表し、その他の記号は式 (1 - 2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (P 4 - 1) に記載の化合物；

式 (P 4 - 4) において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式 (P 4 - 4) において、 A^{3b} が $=C R^{9b}-$ である化合物；

【0192】

前述のとおり、本発明化合物のうち式 (P 9) で示される化合物は、本発明化合物の製造中間体としても用いることができる。式 (1) に記載の本発明化合物 (P 9) 及びそのジスルフィド体 (P 9') としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0193】

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が $-N R^7-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が酸素原子である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が硫黄原子である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^2 が $=C R^8-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^2 が $=C R^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^2 が $=C R^8-$ であり、 A^3 が $=C R^9-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が $-N R^7-$ であり、 A^2 が $=C R^8-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が $-N R^7-$ であり、 A^2 が $=C R^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が $-N R^7-$ であり、 A^2 が $=C R^8-$ であり、 A^3 が $=C R^9-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=C R^8-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=C R^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が酸素原子であり、 A^2 が $=C R^8-$ であり、 A^3 が $=C R^9-$ である化合物；

式 (P 9) 又は式 (P 9') において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=C R^8-$ である化合物；

10

20

30

40

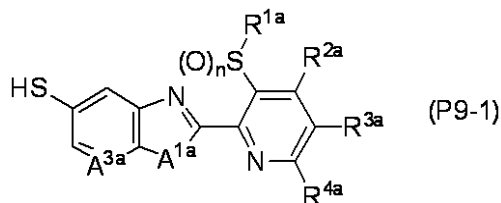
50

式 (P9) 又は式 (P9') において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式 (P9) 又は式 (P9') において、 A^1 が硫黄原子であり、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

【0194】

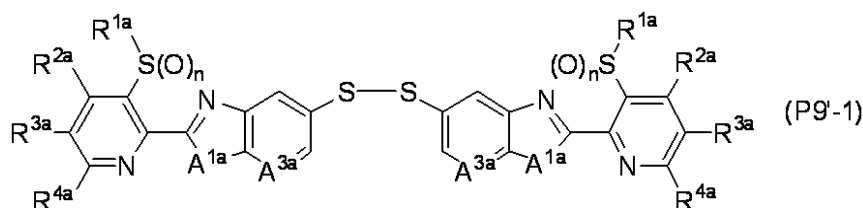
式 (P9-1)



10

[式中、記号は式 (1-1) と同じ意味を表す。]

で示される式 (P9) に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式 (P9'-1)



20

[式中、記号は式 (1-1) と同じ意味を表す。]

で示される式 (P9') に記載の化合物。

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が $-NR^{7a}-$ である化合物；

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が酸素原子である化合物；

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が硫黄原子である化合物；

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が $-NR^{7a}-$ であり、 A^3a が窒素原子である化合物；

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が $-NR^{7a}-$ であり、 A^3a が $=CR^{9a}-$ である化合物；

30

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が酸素原子であり、 A^3a が窒素原子である化合物；

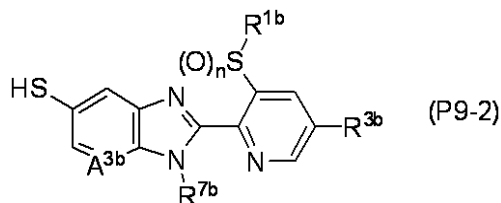
式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が酸素原子であり、 A^3a が $=CR^{9a}-$ である化合物；

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が硫黄原子であり、 A^3a が窒素原子である化合物；

式 (P9-1) 又は式 (P9'-1) において、 A^1a が硫黄原子であり、 A^3a が $=CR^{9a}-$ である化合物；

【0195】

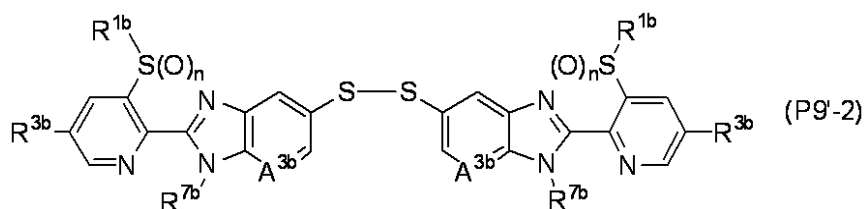
式 (P9-2)



40

[式中、記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (P9-1) に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式 (P9'-2)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]で示される式(P9'-1)に記載の化合物。

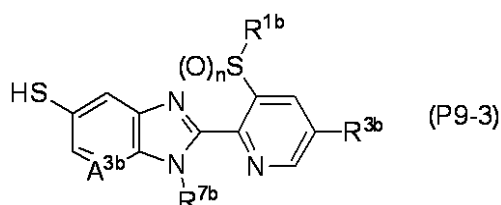
式(P9-2)又は式(P9'-2)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(P9-2)又は式(P9'-2)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

10

【0196】

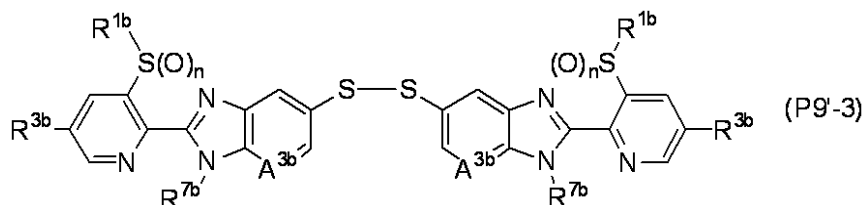
式(P9-3)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(P9-1)に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式(P9'-3)

20



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(P9'-1)に記載の化合物。

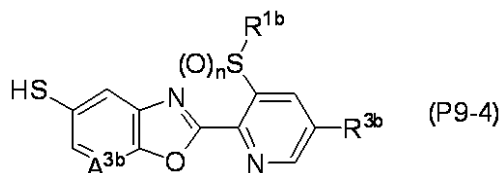
式(P9-3)又は式(P9'-3)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

30

式(P9-3)又は式(P9'-3)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

【0197】

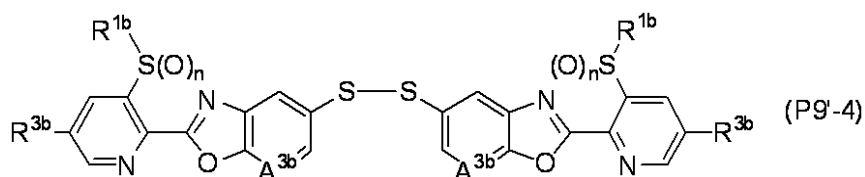
式(P9-4)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(P9-1)に記載の化合物、又は、そのジスルフィド体である式(P9'-4)

40



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(P9'-1)に記載の化合物。

式(P9-4)又は式(P9'-4)において、 A^{3b} が窒素原子である化合物；

式(P9-4)又は式(P9'-4)において、 A^{3b} が $=CR^{9b}-$ である化合物；

50

【0198】

前述のとおり、本発明化合物のうち式（P2）で示される化合物は、本発明化合物の製造中間体としても用いることができる。式（1）に記載の本発明化合物（P2）としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0199】

式（P2）において、 A^2 が $=CR^8-$ である化合物；

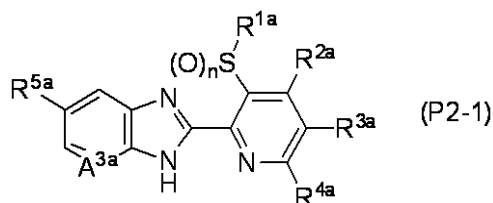
式（P2）において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が窒素原子である化合物；

式（P2）において、 A^2 が $=CR^8-$ であり、 A^3 が $=CR^9-$ である化合物；

【0200】

・式（P2-1）

10



[式中、記号は式（1-1）と同じ意味を表す。]

で示される式（P2）に記載の化合物；

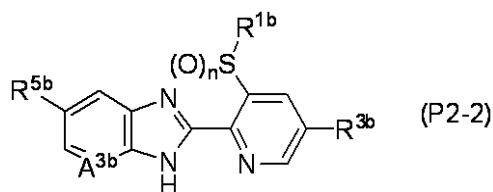
式（P2-1）において、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

式（P2-1）において、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

20

【0201】

式（P2-2）



[式中、記号は式（1-2）と同じ意味を表す。]

で示される式（P2-1）に記載の化合物；

30

式（P2-2）において、 A^{3a} が窒素原子である化合物；

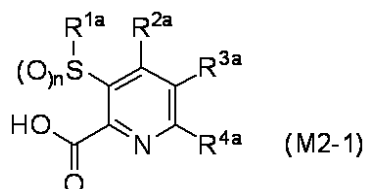
式（P2-2）において、 A^{3a} が $=CR^{9a}-$ である化合物；

【0202】

中間体化合物（M2）としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0203】

式（M2-1）



40

[式中、記号は式（1-1）と同じ意味を表す。]

で示される式（M2）に記載の化合物；

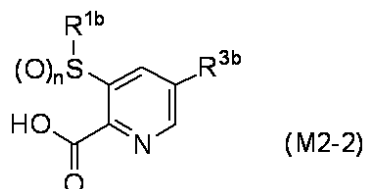
式（M2-1）において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 n が1又は2である化合物；

式（M2-1）において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3a} がトリフルオロメチル基である化合物；

【0204】

式（M2-2）

50



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(M2-1)に記載の化合物；

式(M2-2)において、R^{1b}がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、nが1又は2である化合物；

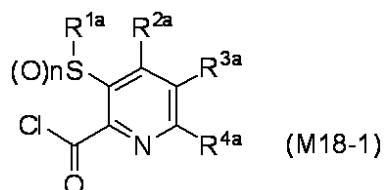
式(M2-2)において、R^{1b}がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、R^{3b}がトリフルオロメチル基である化合物；

【0205】

中間体化合物(M18)としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0206】

式(M18-1)



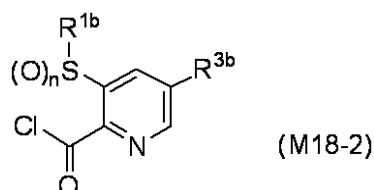
[式中、記号は式(1-1)と同じ意味を表す。]

で示される式(M18)に記載の化合物；

式(M18-1)において、R^{1a}がエチル基又はシクロプロピルメチル基である化合物；

【0207】

式(M18-2)



[式中、記号は式(1-2)と同じ意味を表す。]

で示される式(M18-1)に記載の化合物；

式(M18-2)において、R^{1b}がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、R^{3b}が水素原子である化合物；

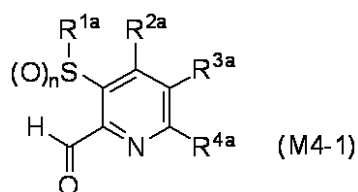
式(M18-2)において、R^{1b}がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、R^{3b}がトリフルオロメチル基である化合物；

【0208】

中間体化合物(M4)としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0209】

式(M4-1)



[式中、記号は式(1-1)と同じ意味を表す。]

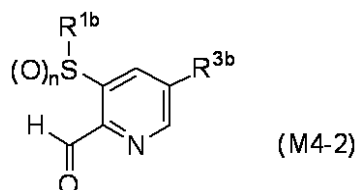
で示される式 (M4) に記載の化合物；

式 (M4-1) において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3a} が水素原子である化合物；

式 (M4-1) において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3a} がトリフルオロメチル基である化合物；

【0210】

式 (M4-2)



10

[式中、記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (M4-1) に記載の化合物；

式 (M4-2) において、 R^{1b} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3b} が水素原子である化合物；

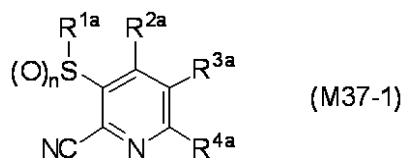
式 (M4-2) において、 R^{1b} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3b} がトリフルオロメチル基である化合物；

【0211】

中間体化合物 (M37) としては、例えば以下の化合物が挙げられる。

【0212】

式 (M37-1)



20

[式中、記号は式 (1-1) と同じ意味を表す。]

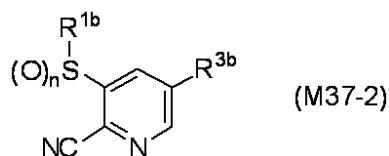
で示される式 (M37) に記載の化合物；

式 (M37-1) において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 n が 1 又は 2 である化合物；

式 (M37-1) において、 R^{1a} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3a} がトリフルオロメチル基である化合物；

【0213】

式 (M37-2)



30

40

[式中、記号は式 (1-2) と同じ意味を表す。]

で示される式 (M37-1) に記載の化合物；

式 (M37-2) において、 R^{1b} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 n が 1 又は 2 である化合物；

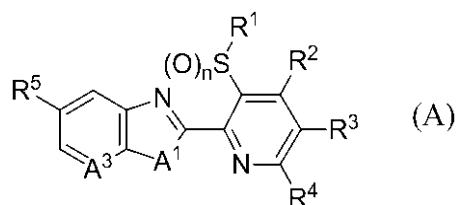
式 (M37-2) において、 R^{1b} がエチル基又はシクロプロピルメチル基であり、 R^{3b} がトリフルオロメチル基である化合物；

【0214】

次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。

式 (A)

50



において、 R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 3 5〕に記載の組み合わせである本発明化合物。

【 0 2 1 5 】

【表 1】

R^1	A^1	A^3	n
Me	NMe	N	0
Me	NMe	N	1
Me	NMe	N	2
Et	NMe	N	0
Et	NMe	N	1
Et	NMe	N	2
Pr	NMe	N	0
Pr	NMe	N	1
Pr	NMe	N	2
iPr	NMe	N	0
iPr	NMe	N	1
iPr	NMe	N	2
tBu	NMe	N	0
tBu	NMe	N	1
tBu	NMe	N	2
CF ₃	NMe	N	0
CF ₃	NMe	N	1
CF ₃	NMe	N	2
CH ₂ CF ₃	NMe	N	0
CH ₂ CF ₃	NMe	N	1
CH ₂ CF ₃	NMe	N	2
CH=CH ₂	NMe	N	0
CH=CH ₂	NMe	N	1
CH=CH ₂	NMe	N	2

【 0 2 1 6 】

【表 2】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	N	2
C≡CH	NMe	N	0
C≡CH	NMe	N	1
C≡CH	NMe	N	2
CH ₂ C≡CH	NMe	N	0
CH ₂ C≡CH	NMe	N	1
CH ₂ C≡CH	NMe	N	2
CycPr	NMe	N	0
CycPr	NMe	N	1
CycPr	NMe	N	2
CH ₂ CycPr	NMe	N	0
CH ₂ CycPr	NMe	N	1
CH ₂ CycPr	NMe	N	2
Me	NMe	CH	0
Me	NMe	CH	1
Me	NMe	CH	2
Et	NMe	CH	0
Et	NMe	CH	1
Et	NMe	CH	2
Pr	NMe	CH	0
Pr	NMe	CH	1
Pr	NMe	CH	2

10

20

30

【0 2 1 7】

【表 3】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	NMe	CH	0
i P r	NMe	CH	1
i P r	NMe	CH	2
t B u	NMe	CH	0
t B u	NMe	CH	1
t B u	NMe	CH	2
C F ₃	NMe	CH	0
C F ₃	NMe	CH	1
C F ₃	NMe	CH	2
CH ₂ C F ₃	NMe	CH	0
CH ₂ C F ₃	NMe	CH	1
CH ₂ C F ₃	NMe	CH	2
CH=CH ₂	NMe	CH	0
CH=CH ₂	NMe	CH	1
CH=CH ₂	NMe	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	CH	2
C≡CH	NMe	CH	0
C≡CH	NMe	CH	1
C≡CH	NMe	CH	2
CH ₂ C≡CH	NMe	CH	0
CH ₂ C≡CH	NMe	CH	1
CH ₂ C≡CH	NMe	CH	2

10

20

30

【 0 2 1 8 】

【表 4】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	NMe	CH	0
C y c P r	NMe	CH	1
C y c P r	NMe	CH	2
CH ₂ C y c P r	NMe	CH	0
CH ₂ C y c P r	NMe	CH	1
CH ₂ C y c P r	NMe	CH	2
Me	NMe	C B r	0
Me	NMe	C B r	1
Me	NMe	C B r	2
E t	NMe	C B r	0
E t	NMe	C B r	1
E t	NMe	C B r	2
P r	NMe	C B r	0
P r	NMe	C B r	1
P r	NMe	C B r	2
i P r	NMe	C B r	0
i P r	NMe	C B r	1
i P r	NMe	C B r	2
t B u	NMe	C B r	0
t B u	NMe	C B r	1
t B u	NMe	C B r	2
C F ₃	NMe	C B r	0
C F ₃	NMe	C B r	1
C F ₃	NMe	C B r	2

10

20

30

【 0 2 1 9 】

【表 5】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	NMe	CB r	0
CH ₂ CF ₃	NMe	CB r	1
CH ₂ CF ₃	NMe	CB r	2
CH=CH ₂	NMe	CB r	0
CH=CH ₂	NMe	CB r	1
CH=CH ₂	NMe	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	NMe	CB r	2
C≡CH	NMe	CB r	0
C≡CH	NMe	CB r	1
C≡CH	NMe	CB r	2
CH ₂ C≡CH	NMe	CB r	0
CH ₂ C≡CH	NMe	CB r	1
CH ₂ C≡CH	NMe	CB r	2
CycPr	NMe	CB r	0
CycPr	NMe	CB r	1
CycPr	NMe	CB r	2
CH ₂ CycPr	NMe	CB r	0
CH ₂ CycPr	NMe	CB r	1
CH ₂ CycPr	NMe	CB r	2

10

20

30

【0 2 2 0】

【表 6】

R ¹	A ¹	A ³	n
Me	NH	N	0
Me	NH	N	1
Me	NH	N	2
Et	NH	N	0
Et	NH	N	1
Et	NH	N	2
Pr	NH	N	0
Pr	NH	N	1
Pr	NH	N	2
iPr	NH	N	0
iPr	NH	N	1
iPr	NH	N	2
tBu	NH	N	0
tBu	NH	N	1
tBu	NH	N	2
CF ₃	NH	N	0
CF ₃	NH	N	1
CF ₃	NH	N	2
CH ₂ CF ₃	NH	N	0
CH ₂ CF ₃	NH	N	1
CH ₂ CF ₃	NH	N	2
CH=CH ₂	NH	N	0
CH=CH ₂	NH	N	1
CH=CH ₂	NH	N	2

10

20

30

【0 2 2 1】

【表 7】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	NH	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	NH	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	NH	N	2
C≡CH	NH	N	0
C≡CH	NH	N	1
C≡CH	NH	N	2
CH ₂ C≡CH	NH	N	0
CH ₂ C≡CH	NH	N	1
CH ₂ C≡CH	NH	N	2
C y c P r	NH	N	0
C y c P r	NH	N	1
C y c P r	NH	N	2
CH ₂ C y c P r	NH	N	0
CH ₂ C y c P r	NH	N	1
CH ₂ C y c P r	NH	N	2
Me	NH	CH	0
Me	NH	CH	1
Me	NH	CH	2
E t	NH	CH	0
E t	NH	CH	1
E t	NH	CH	2
P r	NH	CH	0
P r	NH	CH	1
P r	NH	CH	2

10

20

30

【 0 2 2 2 】

【表 8】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	NH	CH	0
i P r	NH	CH	1
i P r	NH	CH	2
t B u	NH	CH	0
t B u	NH	CH	1
t B u	NH	CH	2
C F ₃	NH	CH	0
C F ₃	NH	CH	1
C F ₃	NH	CH	2
CH ₂ C F ₃	NH	CH	0
CH ₂ C F ₃	NH	CH	1
CH ₂ C F ₃	NH	CH	2
CH=CH ₂	NH	CH	0
CH=CH ₂	NH	CH	1
CH=CH ₂	NH	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	NH	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	NH	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	NH	CH	2
C≡CH	NH	CH	0
C≡CH	NH	CH	1
C≡CH	NH	CH	2
CH ₂ C≡CH	NH	CH	0
CH ₂ C≡CH	NH	CH	1
CH ₂ C≡CH	NH	CH	2

10

20

30

【 0 2 2 3 】

【表 9】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	NH	CH	0
C y c P r	NH	CH	1
C y c P r	NH	CH	2
CH ₂ C y c P r	NH	CH	0
CH ₂ C y c P r	NH	CH	1
CH ₂ C y c P r	NH	CH	2
Me	NH	C B r	0
Me	NH	C B r	1
Me	NH	C B r	2
E t	NH	C B r	0
E t	NH	C B r	1
E t	NH	C B r	2
P r	NH	C B r	0
P r	NH	C B r	1
P r	NH	C B r	2
i P r	NH	C B r	0
i P r	NH	C B r	1
i P r	NH	C B r	2
t B u	NH	C B r	0
t B u	NH	C B r	1
t B u	NH	C B r	2
C F ₃	NH	C B r	0
C F ₃	NH	C B r	1
C F ₃	NH	C B r	2

10

20

30

【 0 2 2 4 】

【表 1 0】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	NH	CB r	0
CH ₂ CF ₃	NH	CB r	1
CH ₂ CF ₃	NH	CB r	2
CH=CH ₂	NH	CB r	0
CH=CH ₂	NH	CB r	1
CH=CH ₂	NH	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	NH	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	NH	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	NH	CB r	2
C≡CH	NH	CB r	0
C≡CH	NH	CB r	1
C≡CH	NH	CB r	2
CH ₂ C≡CH	NH	CB r	0
CH ₂ C≡CH	NH	CB r	1
CH ₂ C≡CH	NH	CB r	2
CycPr	NH	CB r	0
CycPr	NH	CB r	1
CycPr	NH	CB r	2
CH ₂ CycPr	NH	CB r	0
CH ₂ CycPr	NH	CB r	1
CH ₂ CycPr	NH	CB r	2

10

20

30

【 0 2 2 5】

【表 1 1】

R ¹	A ¹	A ³	n
Me	N (CH ₂ OMe)	N	0
Me	N (CH ₂ OMe)	N	1
Me	N (CH ₂ OMe)	N	2
Et	N (CH ₂ OMe)	N	0
Et	N (CH ₂ OMe)	N	1
Et	N (CH ₂ OMe)	N	2
Pr	N (CH ₂ OMe)	N	0
Pr	N (CH ₂ OMe)	N	1
Pr	N (CH ₂ OMe)	N	2
iPr	N (CH ₂ OMe)	N	0
iPr	N (CH ₂ OMe)	N	1
iPr	N (CH ₂ OMe)	N	2
tBu	N (CH ₂ OMe)	N	0
tBu	N (CH ₂ OMe)	N	1
tBu	N (CH ₂ OMe)	N	2
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	N	0
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	N	1
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	N	2
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	N	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	N	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	N	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	N	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	N	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	N	2

10

20

30

【0 2 2 6】

【表 1 2】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	N	2
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	N	0
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	N	1
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	N	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	N	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	N	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	N	2
CycPr	N (CH ₂ OMe)	N	0
CycPr	N (CH ₂ OMe)	N	1
CycPr	N (CH ₂ OMe)	N	2
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ OMe)	N	0
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ OMe)	N	1
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ OMe)	N	2
Me	N (CH ₂ OMe)	CH	0
Me	N (CH ₂ OMe)	CH	1
Me	N (CH ₂ OMe)	CH	2
Et	N (CH ₂ OMe)	CH	0
Et	N (CH ₂ OMe)	CH	1
Et	N (CH ₂ OMe)	CH	2
Pr	N (CH ₂ OMe)	CH	0
Pr	N (CH ₂ OMe)	CH	1
Pr	N (CH ₂ OMe)	CH	2

10

20

30

【0 2 2 7】

【表 1 3】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	N (CH ₂ OMe)	CH	0
i P r	N (CH ₂ OMe)	CH	1
i P r	N (CH ₂ OMe)	CH	2
t B u	N (CH ₂ OMe)	CH	0
t B u	N (CH ₂ OMe)	CH	1
t B u	N (CH ₂ OMe)	CH	2
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CH	0
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CH	1
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CH	2
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CH	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CH	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CH	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CH	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CH	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CH	2
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CH	0
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CH	1
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CH	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CH	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CH	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CH	2

10

20

30

【 0 2 2 8 】

【表 1 4】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	N (CH ₂ OMe)	CH	0
C y c P r	N (CH ₂ OMe)	CH	1
C y c P r	N (CH ₂ OMe)	CH	2
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OMe)	CH	0
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OMe)	CH	1
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OMe)	CH	2
Me	N (CH ₂ OMe)	C B r	0
Me	N (CH ₂ OMe)	C B r	1
Me	N (CH ₂ OMe)	C B r	2
E t	N (CH ₂ OMe)	C B r	0
E t	N (CH ₂ OMe)	C B r	1
E t	N (CH ₂ OMe)	C B r	2
P r	N (CH ₂ OMe)	C B r	0
P r	N (CH ₂ OMe)	C B r	1
P r	N (CH ₂ OMe)	C B r	2
i P r	N (CH ₂ OMe)	C B r	0
i P r	N (CH ₂ OMe)	C B r	1
i P r	N (CH ₂ OMe)	C B r	2
t B u	N (CH ₂ OMe)	C B r	0
t B u	N (CH ₂ OMe)	C B r	1
t B u	N (CH ₂ OMe)	C B r	2
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	C B r	0
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	C B r	1
CF ₃	N (CH ₂ OMe)	C B r	2

10

20

30

【 0 2 2 9 】

【表 1 5】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OMe)	CB r	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OMe)	CB r	2
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CB r	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OMe)	CB r	2
CycPr	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
CycPr	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
CycPr	N (CH ₂ OMe)	CB r	2
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ OMe)	CB r	0
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ OMe)	CB r	1
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ OMe)	CB r	2

10

20

30

【0 2 3 0】

【表 1 6】

R ¹	A ¹	A ³	n
Me	N (CH ₂ OE t)	N	0
Me	N (CH ₂ OE t)	N	1
Me	N (CH ₂ OE t)	N	2
Et	N (CH ₂ OE t)	N	0
Et	N (CH ₂ OE t)	N	1
Et	N (CH ₂ OE t)	N	2
Pr	N (CH ₂ OE t)	N	0
Pr	N (CH ₂ OE t)	N	1
Pr	N (CH ₂ OE t)	N	2
i Pr	N (CH ₂ OE t)	N	0
i Pr	N (CH ₂ OE t)	N	1
i Pr	N (CH ₂ OE t)	N	2
t Bu	N (CH ₂ OE t)	N	0
t Bu	N (CH ₂ OE t)	N	1
t Bu	N (CH ₂ OE t)	N	2
CF ₃	N (CH ₂ OE t)	N	0
CF ₃	N (CH ₂ OE t)	N	1
CF ₃	N (CH ₂ OE t)	N	2
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OE t)	N	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OE t)	N	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OE t)	N	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	N	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	N	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	N	2

10

20

30

【 0 2 3 1 】

【表 1 7】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	N	2
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	N	0
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	N	1
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	N	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	N	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	N	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	N	2
C y c P r	N (CH ₂ OE t)	N	0
C y c P r	N (CH ₂ OE t)	N	1
C y c P r	N (CH ₂ OE t)	N	2
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OE t)	N	0
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OE t)	N	1
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OE t)	N	2
Me	N (CH ₂ OE t)	CH	0
Me	N (CH ₂ OE t)	CH	1
Me	N (CH ₂ OE t)	CH	2
E t	N (CH ₂ OE t)	CH	0
E t	N (CH ₂ OE t)	CH	1
E t	N (CH ₂ OE t)	CH	2
P r	N (CH ₂ OE t)	CH	0
P r	N (CH ₂ OE t)	CH	1
P r	N (CH ₂ OE t)	CH	2

10

20

30

【 0 2 3 2 】

【表 1 8】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	N (CH ₂ OE t)	CH	0
i P r	N (CH ₂ OE t)	CH	1
i P r	N (CH ₂ OE t)	CH	2
t B u	N (CH ₂ OE t)	CH	0
t B u	N (CH ₂ OE t)	CH	1
t B u	N (CH ₂ OE t)	CH	2
C F ₃	N (CH ₂ OE t)	CH	0
C F ₃	N (CH ₂ OE t)	CH	1
C F ₃	N (CH ₂ OE t)	CH	2
CH ₂ C F ₃	N (CH ₂ OE t)	CH	0
CH ₂ C F ₃	N (CH ₂ OE t)	CH	1
CH ₂ C F ₃	N (CH ₂ OE t)	CH	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CH	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CH	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CH	2
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CH	0
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CH	1
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CH	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CH	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CH	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CH	2

10

20

30

【 0 2 3 3 】

【表 19】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	N (CH ₂ OE t)	CH	0
C y c P r	N (CH ₂ OE t)	CH	1
C y c P r	N (CH ₂ OE t)	CH	2
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OE t)	CH	0
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OE t)	CH	1
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ OE t)	CH	2
Me	N (CH ₂ OE t)	C B r	0
Me	N (CH ₂ OE t)	C B r	1
Me	N (CH ₂ OE t)	C B r	2
E t	N (CH ₂ OE t)	C B r	0
E t	N (CH ₂ OE t)	C B r	1
E t	N (CH ₂ OE t)	C B r	2
P r	N (CH ₂ OE t)	C B r	0
P r	N (CH ₂ OE t)	C B r	1
P r	N (CH ₂ OE t)	C B r	2
i P r	N (CH ₂ OE t)	C B r	0
i P r	N (CH ₂ OE t)	C B r	1
i P r	N (CH ₂ OE t)	C B r	2
t B u	N (CH ₂ OE t)	C B r	0
t B u	N (CH ₂ OE t)	C B r	1
t B u	N (CH ₂ OE t)	C B r	2
CF ₃	N (CH ₂ OE t)	C B r	0
CF ₃	N (CH ₂ OE t)	C B r	1
CF ₃	N (CH ₂ OE t)	C B r	2

10

20

30

【 0 2 3 4 】

【表 2 0】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ OE t)	CB r	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ OE t)	CB r	2
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CB r	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ OE t)	CB r	2
Cy c P r	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
Cy c P r	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
Cy c P r	N (CH ₂ OE t)	CB r	2
CH ₂ Cy c P r	N (CH ₂ OE t)	CB r	0
CH ₂ Cy c P r	N (CH ₂ OE t)	CB r	1
CH ₂ Cy c P r	N (CH ₂ OE t)	CB r	2

10

20

30

【 0 2 3 5】

【表 2 1】

R ¹	A ¹	A ³	n
Me	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
Me	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
Me	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
Et	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
Et	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
Et	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
Pr	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
Pr	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
Pr	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
i Pr	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
i Pr	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
i Pr	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
t Bu	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
t Bu	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
t Bu	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	N	2

10

20

30

【 0 2 3 6 】

【表 2 2】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	N	0
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	N	1
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	N	2
Me	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
Me	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
Me	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
E t	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
E t	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
E t	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2

10

20

30

【 0 2 3 7 】

【表 2 3】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
i P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
i P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
t B u	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
t B u	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
t B u	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
CH ₂ C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
CH ₂ C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
CH ₂ C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2

10

20

30

【 0 2 3 8 】

【表 2 4】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	0
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	1
CH ₂ C y c P r	N (CH ₂ C≡CH)	CH	2
Me	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	0
Me	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	1
Me	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	2
E t	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	0
E t	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	1
E t	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	2
P r	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	0
P r	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	1
P r	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	2
i P r	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	0
i P r	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	1
i P r	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	2
t B u	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	0
t B u	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	1
t B u	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	2
C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	0
C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	1
C F ₃	N (CH ₂ C≡CH)	C B r	2

10

20

30

【 0 2 3 9 】

【表 2 5】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
CH ₂ CF ₃	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
CH ₂ C≡CH	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2
CycPr	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
CycPr	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
CycPr	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	0
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	1
CH ₂ CycPr	N (CH ₂ C≡CH)	CB r	2

10

20

30

【0 2 4 0】

【表 2 6】

R ¹	A ¹	A ³	n
Me	O	N	0
Me	O	N	1
Me	O	N	2
Et	O	N	0
Et	O	N	1
Et	O	N	2
Pr	O	N	0
Pr	O	N	1
Pr	O	N	2
i Pr	O	N	0
i Pr	O	N	1
i Pr	O	N	2
t Bu	O	N	0
t Bu	O	N	1
t Bu	O	N	2
CF ₃	O	N	0
CF ₃	O	N	1
CF ₃	O	N	2
CH ₂ CF ₃	O	N	0
CH ₂ CF ₃	O	N	1
CH ₂ CF ₃	O	N	2
CH=CH ₂	O	N	0
CH=CH ₂	O	N	1
CH=CH ₂	O	N	2

10

20

30

【 0 2 4 1 】

【表 2 7】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	O	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	O	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	O	N	2
C≡CH	O	N	0
C≡CH	O	N	1
C≡CH	O	N	2
CH ₂ C≡CH	O	N	0
CH ₂ C≡CH	O	N	1
CH ₂ C≡CH	O	N	2
C y c P r	O	N	0
C y c P r	O	N	1
C y c P r	O	N	2
CH ₂ C y c P r	O	N	0
CH ₂ C y c P r	O	N	1
CH ₂ C y c P r	O	N	2
Me	O	CH	0
Me	O	CH	1
Me	O	CH	2
E t	O	CH	0
E t	O	CH	1
E t	O	CH	2
P r	O	CH	0
P r	O	CH	1
P r	O	CH	2

10

20

30

【 0 2 4 2 】

【表 2 8】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	O	CH	0
i P r	O	CH	1
i P r	O	CH	2
t B u	O	CH	0
t B u	O	CH	1
t B u	O	CH	2
C F ₃	O	CH	0
C F ₃	O	CH	1
C F ₃	O	CH	2
CH ₂ C F ₃	O	CH	0
CH ₂ C F ₃	O	CH	1
CH ₂ C F ₃	O	CH	2
CH=CH ₂	O	CH	0
CH=CH ₂	O	CH	1
CH=CH ₂	O	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	O	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	O	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	O	CH	2
C≡CH	O	CH	0
C≡CH	O	CH	1
C≡CH	O	CH	2
CH ₂ C≡CH	O	CH	0
CH ₂ C≡CH	O	CH	1
CH ₂ C≡CH	O	CH	2

10

20

30

【 0 2 4 3 】

【表 2 9】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	O	CH	0
C y c P r	O	CH	1
C y c P r	O	CH	2
CH ₂ C y c P r	O	CH	0
CH ₂ C y c P r	O	CH	1
CH ₂ C y c P r	O	CH	2
Me	O	CB r	0
Me	O	CB r	1
Me	O	CB r	2
E t	O	CB r	0
E t	O	CB r	1
E t	O	CB r	2
P r	O	CB r	0
P r	O	CB r	1
P r	O	CB r	2
i P r	O	CB r	0
i P r	O	CB r	1
i P r	O	CB r	2
t B u	O	CB r	0
t B u	O	CB r	1
t B u	O	CB r	2
CF ₃	O	CB r	0
CF ₃	O	CB r	1
CF ₃	O	CB r	2

10

20

30

【 0 2 4 4 】

【表 3 0】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	O	CB r	0
CH ₂ CF ₃	O	CB r	1
CH ₂ CF ₃	O	CB r	2
CH=CH ₂	O	CB r	0
CH=CH ₂	O	CB r	1
CH=CH ₂	O	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	O	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	O	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	O	CB r	2
C≡CH	O	CB r	0
C≡CH	O	CB r	1
C≡CH	O	CB r	2
CH ₂ C≡CH	O	CB r	0
CH ₂ C≡CH	O	CB r	1
CH ₂ C≡CH	O	CB r	2
CycPr	O	CB r	0
CycPr	O	CB r	1
CycPr	O	CB r	2
CH ₂ CycPr	O	CB r	0
CH ₂ CycPr	O	CB r	1
CH ₂ CycPr	O	CB r	2

10

20

30

【 0 2 4 5】

【表 3 1】

R ¹	A ¹	A ³	n
Me	S	N	0
Me	S	N	1
Me	S	N	2
Et	S	N	0
Et	S	N	1
Et	S	N	2
Pr	S	N	0
Pr	S	N	1
Pr	S	N	2
i Pr	S	N	0
i Pr	S	N	1
i Pr	S	N	2
t Bu	S	N	0
t Bu	S	N	1
t Bu	S	N	2
CF ₃	S	N	0
CF ₃	S	N	1
CF ₃	S	N	2
CH ₂ CF ₃	S	N	0
CH ₂ CF ₃	S	N	1
CH ₂ CF ₃	S	N	2
CH=CH ₂	S	N	0
CH=CH ₂	S	N	1
CH=CH ₂	S	N	2

10

20

30

【 0 2 4 6 】

【表 3 2】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CH=CH ₂	S	N	0
CH ₂ CH=CH ₂	S	N	1
CH ₂ CH=CH ₂	S	N	2
C≡CH	S	N	0
C≡CH	S	N	1
C≡CH	S	N	2
CH ₂ C≡CH	S	N	0
CH ₂ C≡CH	S	N	1
CH ₂ C≡CH	S	N	2
C y c P r	S	N	0
C y c P r	S	N	1
C y c P r	S	N	2
CH ₂ C y c P r	S	N	0
CH ₂ C y c P r	S	N	1
CH ₂ C y c P r	S	N	2
Me	S	CH	0
Me	S	CH	1
Me	S	CH	2
E t	S	CH	0
E t	S	CH	1
E t	S	CH	2
P r	S	CH	0
P r	S	CH	1
P r	S	CH	2

10

20

30

【 0 2 4 7 】

【表 3 3】

R ¹	A ¹	A ³	n
i P r	S	CH	0
i P r	S	CH	1
i P r	S	CH	2
t B u	S	CH	0
t B u	S	CH	1
t B u	S	CH	2
C F ₃	S	CH	0
C F ₃	S	CH	1
C F ₃	S	CH	2
CH ₂ C F ₃	S	CH	0
CH ₂ C F ₃	S	CH	1
CH ₂ C F ₃	S	CH	2
CH=CH ₂	S	CH	0
CH=CH ₂	S	CH	1
CH=CH ₂	S	CH	2
CH ₂ CH=CH ₂	S	CH	0
CH ₂ CH=CH ₂	S	CH	1
CH ₂ CH=CH ₂	S	CH	2
C≡CH	S	CH	0
C≡CH	S	CH	1
C≡CH	S	CH	2
CH ₂ C≡CH	S	CH	0
CH ₂ C≡CH	S	CH	1
CH ₂ C≡CH	S	CH	2

10

20

30

【 0 2 4 8 】

【表 3 4】

R ¹	A ¹	A ³	n
C y c P r	S	CH	0
C y c P r	S	CH	1
C y c P r	S	CH	2
CH ₂ C y c P r	S	CH	0
CH ₂ C y c P r	S	CH	1
CH ₂ C y c P r	S	CH	2
Me	S	CB r	0
Me	S	CB r	1
Me	S	CB r	2
E t	S	CB r	0
E t	S	CB r	1
E t	S	CB r	2
P r	S	CB r	0
P r	S	CB r	1
P r	S	CB r	2
i P r	S	CB r	0
i P r	S	CB r	1
i P r	S	CB r	2
t B u	S	CB r	0
t B u	S	CB r	1
t B u	S	CB r	2
CF ₃	S	CB r	0
CF ₃	S	CB r	1
CF ₃	S	CB r	2

10

20

30

【 0 2 4 9】

【表 3 5】

R ¹	A ¹	A ³	n
CH ₂ CF ₃	S	CB r	0
CH ₂ CF ₃	S	CB r	1
CH ₂ CF ₃	S	CB r	2
CH=CH ₂	S	CB r	0
CH=CH ₂	S	CB r	1
CH=CH ₂	S	CB r	2
CH ₂ CH=CH ₂	S	CB r	0
CH ₂ CH=CH ₂	S	CB r	1
CH ₂ CH=CH ₂	S	CB r	2
C≡CH	S	CB r	0
C≡CH	S	CB r	1
C≡CH	S	CB r	2
CH ₂ C≡CH	S	CB r	0
CH ₂ C≡CH	S	CB r	1
CH ₂ C≡CH	S	CB r	2
CycPr	S	CB r	0
CycPr	S	CB r	1
CycPr	S	CB r	2
CH ₂ CycPr	S	CB r	0
CH ₂ CycPr	S	CB r	1
CH ₂ CycPr	S	CB r	2

10

20

30

【0250】

(上記の〔表1〕～〔表35〕において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を表し、Prはn-プロピル基を表し、iPrはイソプロピル基を表し、tBuはtert-ブチル基を表し、CycPrはシクロプロピル基を表す。)

【0251】

式(A)において、R²がフッ素原子であり、R³及びR⁴が水素原子であり、R⁵がトリフルオロメチル基であり、R¹、A¹、A³及びnが、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、R³がフッ素原子であり、R²及びR⁴が水素原子であり、R⁵がトリフルオロメチル基であり、R¹、A¹、A³及びnが、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

40

式(A)において、R⁴がフッ素原子であり、R²及びR³が水素原子であり、R⁵がトリフルオロメチル基であり、R¹、A¹、A³及びnが、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、R²が塩素原子であり、R³及びR⁴が水素原子であり、R⁵がトリフルオロメチル基であり、R¹、A¹、A³及びnが、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、R³が塩素原子であり、R²及びR⁴が水素原子であり、R⁵がトリフルオロメチル基であり、R¹、A¹、A³及びnが、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

50

式 (A) において、 R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がペンタフルオロエチル基で 50

式（Ａ）において、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がペンタフルオロエチル基であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表１〕～〔表３５〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 がメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヘプタフ 50

式（Ａ）において、 R^3 が塩素原子であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメトキシ基であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表１〕～〔表３５〕に記載の組合

【 0 2 5 5 】

50

式（Ａ）において、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチルスルファニル基であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表１〕～ 50

式 (A) において、 R^3 が塩素原子であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフル

10

20

30

40

50

50

式 (A) において、 R^3 がメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原

50

子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^4 がメチル基であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 がトリフルオロメトキシ基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 が2-ピリジル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 が3-クロロ-2-ピリジル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 が2-ピリミジニル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 が $-SF_5$ であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がヨウ素原子であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

【0260】

式(A)において、 R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^2 がフッ素原子であり、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 がフッ素原子であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^4 がフッ素原子であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^2 が塩素原子であり、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 R^3 が塩素原子であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^4 が塩素原子であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^2 が臭素原子であり、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 が臭素原子であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^4 が臭素原子であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

10

式 (A) において、 R^2 がメチル基であり、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 がメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^4 がメチル基であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

20

式 (A) において、 R^2 がトリフルオロメチル基であり、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^4 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^3 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

30

式 (A) において、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 がトリフルオロメトキシ基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 が 2-ピリジル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 が 3-クロロ-2-ピリジル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

40

式 (A) において、 R^3 が 2-ピリミジニル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

式 (A) において、 R^3 が $-SF_5$ であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が $-SF_5$ であり、 R^1 、 A^1 、 A^3 及び n が、〔表 1〕～〔表 35〕に記載の組み合わせである化合物。

【0261】

式 (A) において、 A^3 が $N(\rightarrow O)$ であり、 R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 が

50

トリフルオロメチル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がペンタフルオロエチル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^2 、 R^3 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がペンタフルオロエチル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^3 がトリフルオロメチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がペンタフルオロエチル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

式(A)において、 A^3 が $N(→O)$ であり、 R^3 がペンタフルオロエチル基であり、 R^2 及び R^4 が水素原子であり、 R^5 がトリフルオロメチルスルホニル基であり、 R^1 、 A^1 及び n が、〔表1〕～〔表35〕に記載の組み合わせである化合物。

【0262】

本発明化合物が効力を有する有害生物としては、例えば、有害昆虫類や有害ダニ類等の有害節足動物及び線虫が挙げられる。かかる有害生物としては、具体的には例えば、以下のものが挙げられる。

【0263】

半翅目害虫：ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 等のウンカ類、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*) 等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、ミカンクロアブラムシ (*Toxoptera citricidus*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*) 等のアブラムシ類、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、ホソヘリカメムシ (*Riptortus clavatus*)、クモヘリカメムシ (*Leptocoris chinensis*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris parvus*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*) 等のカメムシ類、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthu*

s spiniferus) 等のコナジラミ類、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、サンホーゼカイガラムシ (*Comstockaspis perniciosus*)、シトラススノースケール (*Unaspis citri*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、イセリヤカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kranthiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinus*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*) 等のカイガラムシ類、グンバイムシ類、トコジラミ (*Cimex lectularius*) 等のトコジラミ類、及びキジラミ類。

【0264】

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、サンカメイガ (*Tryporyza incertulas*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウワバ (*Plusia nigrisigna*)、トリコブルシア属、ヘリオティス属、ヘリコベルバ属等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ類、アドキソフィエス属、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、アズキサヤムシガ (*Matsumuraesia azukivora*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、コドリंगा (*Cydia pomonella*) 等のハマキガ類、チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoneella*) のホソガ類、モモシンクイガ (*Carposina niponensis*) 等のシンクイガ類、リオネティア属等のハモグリガ類、リマントリア属、ユープロクティス属等のドクガ類、コナガ (*Plutella xylostella*) 等のスガ類、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*) ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*) 等のキバガ類、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ類、及びイガ (*Tinea translucens*)、コイガ (*Tineola bisselliella*) 等のヒロズコガ類。

【0265】

アザミウマ目害虫：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips parvi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*) 等のアザミウマ類。

【0266】

双翅目害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネッタイエカ (*Culex quinquefasciatus*) 等のイエカ類、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*) 等のエーデス属、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*) 等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Musc*

10

20

30

40

50

ina stabulans)等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ(Delia platura)、タマネギバエ(Delia antiqua)等のハナバエ類、イネハモグリバエ(Agromyza oryzae)、イネヒメハモグリバエ(Hydrellia griseola)、トマトハモグリバエ、(Liriomyza sativae)、マメハモグリバエ(Liriomyza trifolii)、ナモグリバエ(Chromatomyia horticola)等のハモグリバエ類、イネキモグリバエ(Chlorops oryzae)等のキモグリバエ類、ウリミバエ(Dacus cucurbitae)、チチュウカイミバエ(Ceratititis capitata)等のミバエ類、ショウジョウバエ類、オオキモンノミバエ(Megaselia spiracularis)等のノミバエ類、オオチョウバエ(Clogmia albipunctata)等のチョウバエ類、クロバネキノコバエ類、ブユ類、ウシアブ(Tabanus trigonus)等のアブ類、シラミバエ類及びサシバエ類。

【0267】

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム(Diabrotica virgifera virgifera)、サザンコーンルートワーム(Diabrotica undecimpunctata howardi)等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ(Anomala cuprea)、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popillia japonica)等のコガネムシ類、メイヅウィービル(Sitophilus zeamais)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus)、アズキゾウムシ(Callosobruchus chinenensis)、イネゾウムシ(Echinocnemus squameus)、ワタミゾウムシ(Anthrenus grandis)、シバオサゾウムシ(Sphenophorus venatus)等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ(Tenebrio molitor)、コクヌストモドキ(Tribolium castaneum)等のゴミムシダマシ類、イネドロオイムシ(Oulema oryzae)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、コロラドハムシ(Leptinotarsa decemlineata)等のハムシ類、ヒメマルカツオブシムシ(Anthrenus verbasci)、ハラジロカツオブシムシ(Dermestes maculatus)等のカツオブシムシ類、タバコシバンムシ(Lasioderma serricorne)等のシバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintioctopunctata)等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)等のキクイムシ類、ナガシクイムシ類、ヒョウホンムシ類、ゴマダラカミキリ(Anoplophora malasiaca)等のカミキリムシ類、コメツキムシ類(Agrion spp.)、及びアオバアリガタハネカクシ(Paederus fuscipes)。

【0268】

直翅目害虫：トノサマバッタ(Locusta migratoria)、ケラ(Gryllotalpa africana)、コバネイナゴ(Oxya yezoensis)、ハネナガイナゴ(Oxya japonica)、及びコオロギ類。

【0269】

隠翅目害虫：ネコノミ(Ctenocephalides felis)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ヒトノミ(Pulex irritans)、ケオプスネズミノミ(Xenopsylla cheopis)等。

【0270】

シラミ目害虫：コロモジラミ(Pediculus humanus corporis)、アタマジラミ(Pediculus humanus humanus)、ケジラミ(Phthirus pubis)、ウシジラミ(Haematopinus eur

ysternus), ヒツジジラミ (*Dalmalinia ovis*), ブタジラミ (*Haematopinus suis*), イヌジラミ (*Linognathus setosus*) 等。

【0271】

ハジラミ目害虫：ヒツジハジラミ (*Dalmalinia ovis*)、ウシハジラミ (*Dalmalinia bovis*)、ニワトリハジラミ (*Menopon gallinae*)、イヌハジラミ (*Trichodectes canis*)、ネコハジラミ (*Felicola subrostrata*) 等

【0272】

膜翅目害虫： イエヒメアリ (*Monomorium pharaonis*)、クロヤマアリ (*Formica fusca japonica*)、ルリアリ (*Ochetellus glaber*)、アミメアリ (*Pristomyrmex pungens*)、オオズアリ (*Pheidole noda*)、ハキリアリ (*Acromyrmex* spp.)、ファイヤーアント (*Solenopsis* spp.)、アルゼンチンアリ (*Linepithema humile*) 等のアリ類、スズメバチ類、アリガタバチ類、及びカブラハバチ (*Athalia rosae*)、ニホンカブラバチ (*Athalia japonica*) 等のハバチ類。

【0273】

線虫類： イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴメセンチュウ (*Nothotylenchus acris*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)。

【0274】

ゴキブリ目害虫：チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*)、クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)。

【0275】

シロアリ目害虫：ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、コウシュンシロアリ (*Neotermes koshunensis*)、サツマシロアリ (*Glyptotermes satsumensis*)、ナカジマシロアリ (*Glyptotermes nakajimai*)、カタンシロアリ (*Glyptotermes fuscus*)、コダマシロアリ (*Glyptotermes kodamai*)、クシモトシロアリ (*Glyptotermes kushimensis*)、オオシロアリ (*Hodotermopsis japonica*)、コウシュウイエシロアリ (*Coptotermes guangzhouensis*)、アマミシロアリ (*Reticulitermes miyatakei*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flaviceps amamianus*)、カンモンシロアリ (*Reticulitermes* sp.)、タカサゴシロアリ (*Nasutitermes takasagoensis*)、ニトベシロアリ (*Pericapritermes nitobei*)、ムシャシロアリ (*Sinocapritermes mushae*) 等。

【0276】

10

20

30

40

50

ダニ目害虫：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、オリゴニカス属等のハダニ類、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocoptruta citri*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、チャノサビダニ (*Calacar carinatus*)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*) 等のフシダニ類、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) 等のホコリダニ類、ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*) 等のヒメハダニ類、ケナガハダニ類、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanicus*)、アメリカンイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、ブラックレグドチック (*Ixodes scapularis*)、アメリカキラマダニ (*Amblyomma americanum*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 等のマダニ類、ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ハウレンソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*) 等のコナダニ類、コナヒョウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、ヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoides pteronyssinus*) 等のヒョウヒダニ類、ホソツメダニ (*Cheyletus eruditus*)、クワガタツメダニ (*Cheyletus malaccensis*)、ミナミツメダニ (*Cheyletus moorei*)、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*) 等のツメダニ類、ミミヒゼンダニ (*Octodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) 等のヒゼンダニ類、イヌニキビダニ (*Demodex canis*) 等のニキビダニ類、ズツキダニ類、ササラダニ類、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylvarum*)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ類、アオツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*) 等のツツガムシ類、及びカバキコマチグモ (*Chiracanthium japonicum*)、セアカゴケグモ (*Latrodectus hasseltii*) 等のクモ類等。

唇脚綱類：ゲジ (*Thereuonema hilgendorfi*)、トビズムカデ (*Scolopendra subspinipes*) 等。

倍脚綱類：ヤケヤスデ (*Oxidus gracilis*)、アカヤスデ (*Nedyopus tambanus*) 等。

等脚目類：オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*) 等。

腹足綱類：チャコウラナメクジ (*Limax marginatus*)、キイロコウラナメクジ (*Limax flavus*) 等。

【0277】

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物と不活性担体とを含有する。本発明の有害生物防除剤は、通常、本発明化合物と固体担体、液体担体、ガス状担体等の不活性担体とを混合し、必要に応じて界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、乳剤、油剤、粉剤、粒剤、水和剤、フロアブル剤、マイクロカプセル剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤、樹脂製剤、シャンプー剤、ペースト状製剤、泡沫剤、炭酸ガス製剤、錠剤等に製剤化されている。これらの製剤は蚊取り線香、電気蚊取りマット、液体蚊取り製剤、燻煙剤、燻蒸剤、シート製剤、スポットオン剤、経口処理剤に加工されて、使用されることもある。

本発明の有害生物防除剤は、本発明化合物を通常0.01～95重量%含有する。

【0278】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、合成含水酸化珪素、タルク、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム、水和シリカ等）、化学肥料（硫安、燐安、硝安、尿素、塩安等）等の微粉末及び粒状物等、並びに合成樹脂（ポリプロピレン、ポリアクリロニトリル、ポリメタクリル酸メチル、ポリエチレンテレフタレート等のポリエステル樹脂、ナイロンー6、ナイロンー11、ナイロンー66等のナイロン樹脂、ポリアミド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリ塩化ビニリデン、塩化ビニループロピレン共重合体等）があげられる。

【0279】

液体担体としては、例えば水、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、ブタノール、ヘキサノール、ベンジルアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、フェノキシエタノール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、エチルベンゼン、ドデシルベンゼン、フェニルキシリルエタン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル、ミリスチン酸イソプロピル、オレイン酸エチル、アジピン酸ジイソプロピル、アジピン酸ジイソブチル、プロピレングリコールモノメチルエーテルアセテート等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、エチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルエーテル、プロピレングリコールモノメチルエーテル、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、3-メトキシー3-メチルー1-ブタノール等）、酸アミド類（N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン、四塩化炭素等）、スルホキシド類（ジメチルスルホキシド等）、炭酸プロピレン及び植物油（大豆油、綿実油等）が挙げられる。

【0280】

ガス状担体としては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG（液化石油ガス）、ジメチルエーテル及び炭酸ガスがあげられる。

【0281】

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリアルエーテル、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル等の非イオン界面活性剤、及びアルキルスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸塩等の陰イオン界面活性剤が挙げられる。

【0282】

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤、着色剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、糖類（でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2,6-ジ-tert-ブチルー4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチルー4-メトキシフェノールと3-tert-ブチルー4-メトキシフェノールとの混合物）が挙げられる。

【0283】

樹脂製剤の基材としては、例えば塩化ビニル系重合体、ポリウレタン等を挙げることができ、これらの基材には必要によりフタル酸エステル類（フタル酸ジメチル、フタル酸ジオクチル等）、アジピン酸エステル類、ステアリン酸等の可塑剤が添加されていてもよい。樹脂製剤は該基材中に化合物を通常の混練装置を用いて混練した後、射出成型、押出成型、プレス成型等により成型することにより得られ、必要により更に成型、裁断等の工程を経て、板状、フィルム状、テープ状、網状、ひも状等の樹脂製剤に加工できる。これらの樹脂製剤は、例えば動物用首輪、動物用イヤータグ、シート製剤、誘引ひも、園芸用

10

20

30

40

50

支柱として加工される。

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等が挙げられ、更に必要に応じて、ジブチルヒドロキシトルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ末等の子供やペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

【0284】

本発明の有害生物防除方法は、本発明化合物の有効量を有害生物に直接、及び／又は、有害生物の生息場所（植物、土壌、家屋内、動物体等）に施用することにより行われる。本発明の有害生物防除方法には、通常、本発明の有害生物防除剤の形態で用いられる。

【0285】

本発明の有害生物防除剤を農業分野の有害生物防除に用いる場合、その施用量は、10000m²あたりの本発明化合物量で通常1～10000gである。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常、有効成分濃度が0.01～10000ppmとなるように水で希釈して施用し、粒剤、粉剤等は、通常、そのまま施用する。

【0286】

これらの製剤や製剤の水希釈液は、有害生物又は有害生物から保護すべき作物等の植物に直接散布処理してもよく、また耕作地の土壌に生息する有害生物を防除するために、該土壌に処理してもよい。

【0287】

また、シート状やひも状に加工した樹脂製剤を作物に巻き付ける、作物近傍に張り渡す、株元土壌に敷く等の方法により処理することもできる。

【0288】

本発明の有害生物防除剤を家屋内に生息する有害生物の防除に用いる場合、その施用量は、面上に処理する場合は処理面積1m²あたりの本発明化合物量で、通常、0.01～1000mgであり、空間に処理する場合は処理空間1m³あたりの本発明化合物量で、通常、0.01～500mgである。本発明の有害生物防除剤が乳剤、水和剤、フロアブル剤等に製剤化されている場合は、通常有効成分濃度が0.1～10000ppmとなるように水で希釈して施用し、油剤、エアゾール剤、燻煙剤、毒餌剤等はそのまま施用する。

【0289】

本発明の有害節足動物防除剤をウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ、ニワトリ用の家畜、イヌ、ネコ、ラット、マウス等の小動物の外部寄生虫防除に用いる場合は、獣医学的に公知の方法で動物に使用することができる。具体的な使用方法としては、全身抑制を目的とする場合には、例えば錠剤、飼料混入、坐薬、注射（筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内等）により投与され、非全身的抑制を目的とする場合には、例えば油剤若しくは水性液剤を噴霧する、ポアオン処理若しくはスポットオン処理を行う、シャンプー製剤で動物を洗う又は樹脂製剤を首輪や耳札にして動物に付ける等の方法により用いられる。動物体に投与する場合の本発明化合物の量は、通常動物の体重1kgに対して、0.1～1000mgの範囲である。

【0290】

本発明の有害生物防除剤は、下記「作物」が栽培されている農地で使用することができる。

農作物：トウモロコシ、イネ、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク、ソルガム、ワタ、ダイズ、ピーナッツ、ソバ、テンサイ、ナタネ、ヒマワリ、サトウキビ、タバコ等。

野菜：ナス科野菜（ナス、トマト、ピーマン、トウガラシ、ジャガイモ等）、ウリ科野菜（キュウリ、カボチャ、ズッキーニ、スイカ、メロン等）、アブラナ科野菜（ダイコン、カブ、セイヨウワサビ、コールラビ、ハクサイ、キャベツ、カラシナ、ブロッコリー、カリフラワー等）、キク科野菜（ゴボウ、シュンギク、アーティチョーク、レタス等）、ユリ科野菜（ネギ、タマネギ、ニンニク、アスパラガス）、セリ科野菜（ニンジン、パセ

10

20

30

40

50

リ、セロリ、アメリカボウフウ等)、アカザ科野菜(ハウレンソウ、フダンソウ等)、シソ科野菜(シソ、ミント、バジル等)、イチゴ、サツマイモ、ヤマノイモ、サトイモ等。

果樹:仁果類(リンゴ、セイヨウナシ、ニホンナシ、カリン、マルメロ等)、核果類(モモ、スモモ、ネクタリン、ウメ、オウトウ、アンズ、プルーン等)、カンキツ類(ウンシュウミカン、オレンジ、レモン、ライム、グレープフルーツ等)、堅果類(クリ、クルミ、ハシバミ、アーモンド、ピスタチオ、カシューナッツ、マカダミアナッツ等)、液果類(ブルーベリー、クランベリー、ブラックベリー、ラズベリー等)、ブドウ、カキ、オリーブ、ビワ、バナナ、コーヒー、ナツメヤシ、ココヤシ、アブラヤシ等。

果樹以外の樹木:チャ、クワ、花木類(サツキ、ツバキ、アジサイ、サザンカ、シキミ、サクラ、ユリノキ、サルスベリ、キンモクセイ等)、街路樹(トネリコ、カバノキ、ハナミズキ、ユーカリ、イチョウ、ライラック、カエデ、カシ、ポプラ、ハナズオウ、フウ、プラタナス、ケヤキ、クロベ、モミノキ、ツガ、ネズ、マツ、トウヒ、イチイ、ニレ、トチノキ等)、サンゴジュ、イヌマキ、スギ、ヒノキ、クロトン、マサキ、カナメモチ、等。

芝生:シバ類(ノシバ、コウライシバ等)、バミューダグラス類(ギョウギシバ等)、ベントグラス類(コヌカグサ、ハイコヌカグサ、イトコヌカグサ等)、ブルーグラス類(ナガハグサ、オオスズメノカタビラ等)、フェスク類(オニウシノケグサ、イトウシノケグサ、ハイウシノケグサ等)、ライグラス類(ネズミムギ、ホソムギ等)、カモガヤ、オオアワガエリ等。

その他:花卉類(バラ、カーネーション、キク、トルコギキョウ、カスミソウ、ガーベラ、マリーゴールド、サルビア、ペチュニア、バーベナ、チューリップ、アスター、リンドウ、ユリ、パンジー、シクラメン、ラン、スズラン、ラベンダー、ストック、ハボタン、プリムラ、ポインセチア、グラジオラス、カトレア、デージー、シンビジューム、ベゴニア等)、バイオ燃料植物(ヤトロファ、クルカス、ベニバナ、アマナズナ類、スイッチグラス、ミスカンサス、クサヨシ、ダンチク、ケナフ、キャッサバ、ヤナギ、藻類等)、観葉植物等。

【0291】

「作物」には、遺伝子組換え作物も含まれる。

【0292】

本発明の有害生物防除剤は、他の殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物成長調節剤、除草剤及び共力剤と混用又は併用することができる。かかる殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤及び共力剤の有効成分の例を以下に示す。

【0293】

殺虫剤の有効成分

(1) 有機リン化合物

アセフェート(acephate)、りん化アルミニウム(Aluminium phosphide)、ブタチオホス(buthiofos)、キャドサホス(cadusafos)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル(chlorpyrifos-methyl)、シアノホス(cyanophos:CYAP)、ダイアジノン(diazinon)、DCIP(dichlorodiiisopropyl ether)、ジクロフェンチオン(dichlofenthion:ECF)、ジクロルボス(dichlorvos:DDVP)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジスルホトン(disulfoton)、EPN、エチオン(ethion)、エトプロホス(ethoprophos)、エトリムホス(etrifos)、フェンチオン(fenthion:MPP)、フェニトロチオン(fenitrothion:MEP)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ホルモチオン(formothion)、りん化水素(Hydrogen phosphide)、イソフェンホス(isofenphos)、イソキサチオン(isoxathion)、マラチオン(ma

lathion)、メスルフェンホス(mesulfenfos)、メチダチオン(methidathion:DMTP)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレッド(naled:BRP)、オキシデプロホス(oxydeprofos:ESP)、パラチオン(parathion)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet:PMP)、ピリミホスメチル(pirimiphos-methyl)、ピリダフェンチオン(pyridafenthion)、キナルホス(quinalphos)、フェントエート(phenthoate:PAP)、プロフェノホス(propenofos)、プロパホス(propaphos)、プロチオホス(prothiophos)、ピラクロホス(pyraclorfos)、サリチオン(salithion)、スルプロホス(sulprofos)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、テルブホス(terbufos)、チオメトン(thiometon)、トリクロルホン(trichlorophon:DEP)、バミドチオン(vamidothion)、フォレート(phorate)、及びカズサホス(cadusafos)

10

。

(2) カーバメート化合物

アラニカルブ(alanycarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、BPMC、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、クロエトカルブ(cloethocarb)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoproc carb:MIPC)、メトルカルブ(metolcarb)、メソミル(methomyly)、メチオカルブ(methiocarb)、NAC、オキサミル(oxamyly)、ピリミカーブ(pirimicarb)、プロボキスル(propoxur:PHC)、XMC、チオジカルブ(thiodicarb)、キシリルカルブ(xyllylcarb)、及びアルジカルブ(aldicarb)。

20

【0294】

(3) ピレスロイド化合物

30

アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、ベンフルスリン(benfluthrin)、ベーターシフルトリン(beta-cyfluthrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、シベルメトリン(cypermethrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルフェンプロックス(flufenoprox)、フルメスリン(flumethrin)、フルバリネート(fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、イミプロトリン(imiprothrin)、ペルメトリン(permethrin)、プラレトリン(prallethrin)、ピレトリン(pyrethrins)、レスメトリン(resmethrin)、シグマーサイパーメスリン(sigma-cypermethrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、フェノトリン(phenothrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、アルファシベルメトリン(alpha-cypermethrin)、ゼータシベルメトリン(zeta-cypermethrin)、ラムダシハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマ

40

50

シハロトリン (gamma-cyhalothrin)、フラメトリン (furamet
hrin)、タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、メトフルトリ
ン (metofluthrin)、プロフルトリン (profluthrin)、ジメフル
トリン (dimefluthrin)、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4- (メトキ
シメチル) ベンジル (E Z) - (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S R) - 2, 2-ジメチル
- 3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、2, 3, 5, 6-テトラフ
ルオロ-4-メチルベンジル (E Z) - (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S R) - 2, 2-
ジメチル-3-プロプ-1-エニルシクロプロパンカルボキシレート、及び2, 3, 5,
6-テトラフルオロ-4- (メトキシメチル) ベンジル (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S
R) - 2, 2-ジメチル-3- (2-メチル-1-プロペニル) シクロプロパンカルボキ
シレート、2, 3, 5, 6-テトラフルオロ-4- (メトキシメチル) ベンジル (E Z)
- (1 R S, 3 R S; 1 R S, 3 S R) - 2, 2-ジメチル-3- (2-シアノ-1-プ
ロペニル) シクロプロパンカルボキシレート。

10

(4) ネライストキシシン化合物

カルタップ (cartap)、ベンスルタップ (bensultap)、チオシクラム
(thiocyclam)、モノスルタップ (monosultap)、及びビスルタッ
プ (bisultap)。

【0295】

(5) ネオニコチノイド化合物

イミダクロプリド (imidacloprid)、ニテンピラム (nitenpyra
m)、アセタミプリド (acetamiprid)、チアメトキサム (thiameth
oxam)、チアクロプリド (thiacloprid)、ジノテフラン (dinote
furan)、及びクロチアニジン (clothianidin)。

20

(6) ベンゾイル尿素化合物

クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、ビストリフルロン (bist
rifuluron)、ジアフェンチウロン (diafenthionuron)、ジフルベン
ズロン (diflubenzuron)、フルアズロン (fluazuron)、フルシ
クロクスロン (flucycloxaduron)、フルフェノクスロン (flufenox
uron)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ルフエヌロン (lufe
nuron)、ノバルロン (novaluron)、ノビフルムロン (noviflum
uron)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、トリフルムロン (tr
iflumuron)、及びトリアズロン (triazuron)。

30

(7) フェニルピラゾール化合物

アセトプロール (acetoprole)、エチプロール (ethiprole)、フ
ィプロニル (fipronil)、バニリプロール (vaniliprole)、ピリプ
ロール (pyriprole)、及びピラフルプロール (pyrafluprole)。

(8) Btトキシシン

バチルス・チューリンゲンシス菌由来の生芽胞及び産生結晶毒素、及びそれらの混合物
;

(9) ヒドラジン化合物

40

クロマフェノジド (chromafenozide)、ハロフェノジド (halofe
nozide)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、及びテブフ
ェノジド (tebufenozide)。

(10) 有機塩素化合物

アルドリル (aldrin)、ディルドリン (dieldrin)、ジエノクロル (d
ienochlor)、エンドスルファン (endosulfan)、及びメトキシクロ
ル (methoxychlor)。

【0296】

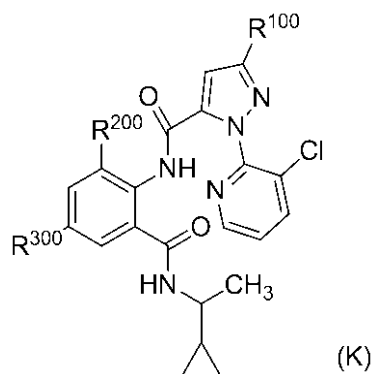
(11) その他の殺虫剤有効成分

マシン油 (machine oil)、硫酸ニコチン (nicotine-sulfa

50

te) ; アベルメクチン (avermectin-B)、ブロモプロピレート (bromopropylate)、ブプロフェジン (buprofezin)、クロルフェナピル (chlorphenapyr)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、シロマジン (cyromazine)、D-D (1, 3-Dichloropropene)、エマメクチンベンゾエート (emamectin-benzoate)、フェナザキン (fenazaquin)、フルピラゾホス (flupyrazofos)、ハイドロブレン (hydroprene)、メトブレン (methoprene)、インドキサカルブ (indoxacarb)、メトキサジアゾン (metoxadiazon)、ミルベマイシンA (milbemycin-A)、ピメトロジン (pymetrozine)、ピリダリル (pyridalyl)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、スピノサッド (spinosad)、スルフラミド (sulfluramid)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トリアゼメイト (triazamate)、フルベンジアミド (flubendiamide)、レピメクチン (lepimectin)、亜ひ酸 (Arsenic acid)、ベンクロチアズ (benclothiaz)、石灰窒素 (Calcium cyanamide)、石灰硫黄合剤 (Calcium polysulfide)、クロルデン (chlordane)、DDT、DSP、フルフェネリウム (flufennerim)、フロニカミド (flonicamid)、フルリムフェン (flurimfen)、ホルメタネート (formetanate)、メタム・アンモニウム (metam-ammonium)、メタム・ナトリウム (metam-sodium)、臭化メチル (Methyl bromide)、オレイン酸カリウム (Potassium oleate)、プロトリフェンブート (protrifenbute)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スルフォキサフロール (sulfoxafloer)、硫黄 (Sulfur)、メタフルミゾン (metaflumizone)、スピロテトラマト (spirotetramat)、ピリフルキナゾン (pyrifluquinazone)、スピネトラム (spinetoram)、クロラントラニリプロール (chlorantraniliprole)、トラロピリル (tralopyril)、シアントラニリプロール (cyantraniliprole)、

下記式 (K)



[式中、

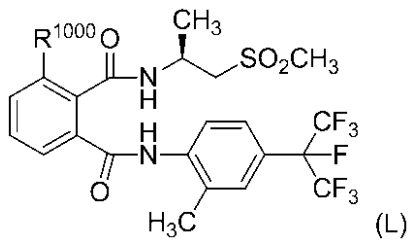
R^{100} は塩素、臭素又はトリフルオロメチル基を表し、

R^{200} は塩素、臭素又はメチル基を表し、

R^{300} は塩素、臭素又はシアノ基を表す。]

で示される化合物、及び

下記式 (L)



〔式中、

R^{1000} は塩素、臭素又はヨウ素を表す。〕

で示される化合物。

10

【0297】

殺ダニ剤の有効成分

アセキノシル (acequinocyl)、アミトラズ (amitraz)、ベンゾキシメート (benzoximate)、ビフェナゼート (bifenaate)、フェニソプロモレート (bromopropylate)、キノメチオネート (chinomethionat)、クロルベンジレート (chlorobenzilate)、CPCBS (chlorfenson)、クロフェンテジン (clofentezine)、シフルメトフェン (cyflumetofen)、ケルセン (ジコホル: dicofol)、エトキサゾール (etoxazole)、酸化フェンブタスズ (fenbutatin oxide)、フェノチオカルブ (fenothiocarb)、フェンピロキシメート (fenpyroximate)、フルアクリピリム (fluacrypyrim)、フルプロキシフェン (fluproxyfen)、ヘキシチアゾクス (hexythiazox)、プロパルギット (propargite: BPPS)、ポリナクチン複合体 (polynactins)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジフェン (Pyrimidifen)、テブフェンピラド (tebufenpyrad)、テトラジホン (tetradi fon)、スピロディクロフェン (spirodiclofen)、スピロメシフェン (spiromesifen)、スピロテトラマット (spirotetr amat)、アミドフルメット (amidoflumet)、及びシエノピラフェン (cyenopyrafen)。

20

【0298】

殺線虫剤の有効成分

DCIP、フォスチアゼート (fosthiazate)、塩酸レバミゾール (levamisol)、メチルイソチオシアネート (methyisothiocyanate)、酒石酸モランテル (morantel tartarate)、及びイミシアホス (imicyafos)。

30

【0299】

殺菌剤の有効成分

プロピコナゾール (propiconazole)、プロチオコナゾール (prothioconazole)、トリアジメノール (triadimenol)、プロクロラズ (prochloraz)、ペンコナゾール (penconazole)、テブコナゾール (tebuconazole)、フルシラゾール (flusilazole)、ジニコナゾール (diniconazole)、ブロムコナゾール (bromuconazole)、エポキシコナゾール (epoxiconazole)、ジフェノコナゾール (difenoconazole)、シプロコナゾール (cyproconazole)、メトコナゾール (metconazole)、トリフルミゾール (triflumizole)、テトラコナゾール (tetraconazole)、マイクロブタニル (myclobutanil)、フェンブコナゾール (fenbuconazole)、ヘキサコナゾール (hexaconazole)、フルキンコナゾール (fluquinconazole)、トリティコナゾール (triticonazole)、ビテルタノール (bitertanol)、イマザリル (imazalil)、フルトリアホール (flutri

40

50

a f o l) 等のアゾール殺菌化合物；

フェンプロピモルフ (fenpropimorph)、トリデモルフ (tridemorph)、フェンプロピジン (fenpropidin) 等の環状アミン殺菌化合物；

カルベンダジム (carbendazim)、ベノミル (benomyl)、チアベンダゾール (thiabendazole)、チオファネートメチル (thiophanate-methyl) 等のベンズイミダゾール殺菌化合物；

プロシミドン (procymidone)；シプロディニル (cyprodinil)；

ピリメタニル (pyrimethanil)；ジエトフェンカルブ (diethofencarb)；チウラム (thiuram)；フルアジナム (fluazinam)；マン

コゼブ (mancozeb)；イプロジオン (iprodione)；ビクロゾリン (vinclozolin)；クロタロニル (chlorothalonil)；キャ

タン (captan)；メパニピリム (mepanipyrim)；フェンピクロニル (fenpiclonil)；フルジオキシニル (fludioxonil)；ジクロフル

アニド (dichlofluanid)；フォルベット (folpet)；クレソキシム

メチル (kresoxim-methyl)；アゾキシストロビン (azoxystrobin)；トリフロキシストロビン (trifloxystrobin)；フルオキサス

トロビン (fluoxastrobin)；ピコキシストロビン (picoxystrobin)；ピラクロストロビン (pyraclostrobin)；ジモキシストロビン

(dimoxystrobin)；ピリベンカルブ (pyribencarb)；スピロ

キサミン (spiroxamine)；キノキシフェン (quinoxifen)；フェ

ンヘキサミド (fenhexamid)；ファミキサドン (famoxadone)；フェ

ナミドン (fenamidone)；ゾキサミド (zoxamide)；エタボキサム

(ethaboxam)；アミスルブロム (amisulbrom)；イプロヴァリカル

ブ (iprovalicarb)；ベンチアバリカルブ (benthiavalicarb)；シアゾファミド (cyazofamid)；マンジプロパミド (mandipropamid)；ボスカリド (boscalid)；ペンチオピラド (penthioopyrad)；メトラフェノン (metrafenone)；フルオピラン (fluopir

an)；ビキサフェン (bixafen)；シフルフェナミド (cyflufenamid)；プロキナジド (proquinazid)；イソチアニル (isotianil) 及びチアジニル (tiadinil)。

【0300】

除草剤の有効成分

(1) フェノキシ脂肪酸除草性化合物

2, 4-PA、MCP、MCPB、フェノチオール (phenothiol)、メコプロップ (mecoprop)、フルロキシピル (fluroxypyr)、トリクロピル (triclopyr)、クロメプロップ (clomeprop)、及びナプロアニリド (naproanilide)。

(2) 安息香酸除草性化合物

2, 3, 6-TBA、ジカンバ (dicamba)、クロピラリド (clopyralid)、ピクロラム (picloram)、アミノピラリド (aminopyralid)、キンクロラック (quinclorac)、及びキンメラック (quinmerac)。

(3) 尿素除草性化合物

ジウロン (diuron)、リニュロン (linuron)、クロルトロン (chlortoluron)、イソプロツロン (isoproturon)、フルオメツロン (fluometuron)、イソウロン (isouron)、テブチウロン (tebuthiuron)、メタベンズチアズロン (methabenzthiazuron)、クミルロン (cymyluron)、ダイムロン (daimuron)、及びメチルダイムロン (methyl-daimuron)。

(4) トリアジン除草性化合物

アトラジン (atrazine)、アメトリン (ametoryn)、シアナジン (cyanazine)、シマジン (simazine)、プロパジン (propazine)、シメトリン (simetryn)、ジメタメトリン (dimethametryn)、プロメトリン (prometryn)、メトリブジン (metribuzin)、トリアジフラム (triaziflam)、及びインダジフラム (indaziflam)。

(5) ビピリジニウム除草性化合物

パラコート (paraquat)、及びジクワット (diquat)。

【0301】

(6) ヒドロキシベンゾニトリル除草性化合物

ブロモキシニル (bromoxynil)、及びアイオキシニル (ioxynil)。

10

(7) ジニトロアニリン除草性化合物

ペンディメタリン (pendimethalin)、プロジアミン (prodiamine)、及びトリフルラリン (trifluralin)。

(8) 有機リン除草性化合物

アミプロホスメチル (amiprofos-methyl)、ブタミホス (butamifos)、ベンスリド (bensulide)、ピペロホス (piperophos)、アニロホス (anilofos)、グリホサート (glyphosate)、グルホシネート (glufosinate)、グルホシネート-P (glufosinate-P)、及びビアラホス (bialaphos)。

20

(9) カーバメート除草性化合物

ジアレート (di-allate)、トリアレート (tri-allate)、EPTC、ブチレート (butylate)、ベンチオカーブ (benthiocarb)、エスプロカルブ (esprocarb)、モリネート (molinate)、ジメピペレート (dimepiperate)、スエップ (swep)、クロルプロファム (chlorpropham)、フェンメディファム (phenmedipham)、フェニソファム (phenisopham)、ピリブチカルブ (pyributicarb)、及びアシュラム (asulam)。

(10) 酸アミド除草性化合物

プロパニル (propanil)、プロピザミド (propyzamide)、プロモブチド (bromobutide)、及びエトベンザニド (etobenzanid)。

30

【0302】

(11) クロロアセトアニリド除草性化合物

アセトクロール (acetochlor)、アラクロール (alachlor)、ブタクロール (butachlor)、ジメテナミド (dimethenamid)、プロパクロール (propachlor)、メタザクロール (metazachlor)、メトラクロール (metolachlor)、プレチラクロール (pretilachlor)、テニルクロール (thenylchlor)、及びペトキサミド (pethoxamid)。

(12) ジフェニルエーテル除草性化合物

アシフルオルフェン (acifluorfen-sodium)、ビフェノックス (bifenox)、オキシフルオルフェン (oxyfluorfen)、ラクトフェン (lactofen)、フォメサフェン (fomesafen)、クロメトキシニル (chloromethoxynil)、及びアクロニフェン (aclonifen)。

40

(13) 環状イミド除草性化合物

オキサジアゾン (oxadiazon)、シニドンエチル (cinidon-ethyl)、カルフェントラゾンエチル (carfentrazone-ethyl)、スルフエントラゾン (sulfentrazone)、フルミクロラックペンチル (flumiclorac-pentyl)、フルミオキサジン (flumioxazin)、ピラフルフェンエチル (pyraflufen-ethyl)、オキサジアルギル (oxadiazargyl)、ペントキサゾン (pentoxazone)、フルチアセットメチル (fl

50

uthiacet-methyl)、ブタフェナシル(butafenacil)、ベンズフェンジゾン(benzfendizone)、ベンカルバゾン(bencarbazone)、及びサフルフェナシル(saflufenacil)。

(14) ピラゾール除草性化合物

ベンゾフェナップ(benzofenap)、ピラゾレート(pyrazolate)、ピラゾキシフェン(pyrazoxyfen)、トプラメゾン(topramezone)、及びピラスルホトール(pyrasulfotole)。

(15) トリケトン除草性化合物

イソキサフルトール(isoxaflutole)、ベンゾビシクロン(benzobicyclon)、スルコトリオン(sulcotrione)、メソトリオン(mesotrione)、テンボトリオン(tembotrione)、及びテフルiltrione)。

10

(16) アリールオキシフェノキシプロピオン酸除草性化合物

クロジナホッププロパルギル(clodinafop-propargyl)、シハロホップブチル(cyhalofop-butyl)、ジクロホップメチル(diclofop-methyl)、フェノキサプロップエチル(fenoxaprop-ethyl)、フルアジホップブチル(fluzafop-butyl)、ハロキシホップメチル(haloxfop-methyl)、及びキザロホップエチル(quizalofop-ethyl)、メタミホップ(metamifop)。

(17) トリオンオキシム除草性化合物

アロキシジム(alloxydim-sodium)、セトキシジム(sethoxydim)、ブトロキシジム(butroxydim)、クレソジム(clethodim)、クロプロキシジム(cloproxydim)、シクロキシジム(cycloxydim)、テプラロキシジム(tepraloxym)、トラルコキシジム(tralkoxydim)、及びプロフォキシジム(profoxydim)。

20

【0303】

(18) スルホニル尿素除草性化合物

クロルスルフロン(chlorosulfuron)、スルホメツロンメチル(sulfometuron-methyl)、メトスルフロンメチル(metsulfuron-methyl)、クロリムロンエチル(chlorimuron-ethyl)、トリベニユロンメチル(tribenuron-methyl)、トリアスルフロン(triasulfuron)、ベンスルフロンメチル(bensulfuron-methyl)、チフェンスルフロンメチル(thifensulfuron-methyl)、ピラズスルフロンエチル(pyrazosulfuron-ethyl)、プリミスルフロンメチル(primisulfuron-methyl)、ニコスルフロン(nicosulfuron)、アミドスルフロン(amidosulfuron)、シノスルフロン(cinosulfuron)、イマズスルフロン(imazosulfuron)、リムスルフロン(rimsulfuron)、ハロスルフロンメチル(halosulfuron-methyl)、プロスルフロン(prosulfuron)、エタメトスルフロンメチル(ethametsulfuron-methyl)、トリフルスルフロンメチル(triflursulfuron-methyl)、フラザスルフロン(flazasulfuron)、シクロスルファミロン(cyclosulfamuron)、フルピルスルフロン(flupyrsulfuron)、スルホスルフロン(sulfosulfuron)、アジムスルフロン(azimsulfuron)、エトキシスルフロン(ethoxysulfuron)、オキサスルフロン(oxasulfuron)、ヨードスルフロンメチルナトリウム(iodosulfuron-methyl-sodium)、フォラムスルフロン(foramsulfuron)、メソスルフロンメチル(mesosulfuron-methyl)、トリフロキシスルフロン(trifloxysulfuron)、トリトスルフロン(tritosulfuron)、オルソスルファミロン(orthosulfamuron)、フルセトスルフロン(flucetosul

30

40

50

furon)、及びプロピリスルフロン(propyrisulfuron)。

(19) イミダゾリノン除草性化合物

イマザメタベンズメチル(imazamethabenz-methyl)、イマザメタピル(imazamethapyr)、イマザモックス(imazamox)、イマザピル(imazapyr)、イマザキン(imazaquin)、及びイマゼタピル(imazethapyr)。

(20) スルホンアミド除草性化合物

フルメトスラム(flumetsulam)、メトスラム(metosulam)、ジクロスラム(diclosulam)、フロラスラム(florasulam)、クロランスラムメチル(cloransulam-methyl)、ペノキススラム(penoxsulam)、及びピロキススラム(pyroxsulam)。

10

(21) ピリミジニルオキシ安息香酸除草性化合物

ピリチオバックナトリウム(pyriithiobac-sodium)、ビスピリバックナトリウム(bispyribac-sodium)、ピリミノバックメチル(pyriminobac-methyl)、ピリベンゾキシム(pyribenzoxim)、ピリフタリド(pyrifthalid)、及びピリミスルファン(pyrimisulfan)。

(22) その他の除草性化合物

ベンタゾン(bentazon)、ブロマシル(bromacil)、ターバシル(terbacil)、クロルチアミド(chlororthiamid)、イソキサベン(isoxaben)、ジノセブ(dinoseb)、アミトロール(amitrole)、シンメチリン(cinmethylin)、トリジファン(tridiphane)、ダラボン(dalapon)、ジフルフェンゾピルナトリウム(diflufenzopyr-sodium)、ジチオピル(dithiopyr)、チアゾピル(thiazopyr)、フルカルバゾンナトリウム(flucarbazone-sodium)、プロポキシカルバゾンナトリウム(propoxycarbazone-sodium)、メフェナセット(mefenacet)、フルフェナセット(flufenacet)、フェントラザミド(fentrazamide)、カフェンストロール(cafenstrole)、インダノファン(indanofan)、オキサジクロメホン(oxaziclomefone)、ベンフレセート(benfuresate)、ACN、ピリデート(pyridate)、クロリダゾン(chloridazon)、ノルフルラゾン(norflurazon)、フルルタモン(flurtamone)、ジフルフェニカン(diflufenican)、ピコリナフェン(picolinafen)、ベフルブタミド(beflubutamid)、クロマゾン(clomazone)、アミカルバゾン(amicarbazone)、ピノキサデン(pinoxaden)、ピラクロニル(pyraclonil)、ピロキサスルホン(pyroxasulfone)、チエンカルバゾンメチル(thiencarbazone-methyl)、アミノシクロピラクロール(aminocyclopyrachlor)、イプフェンカルバゾン(ipfencarbazone)、及びメチオゾリン(methiozolin)。

20

30

【0304】

40

共力剤の有効成分

ピペロニル ブトキサイド(piperonyl butoxide)、セサメックス(sesamex)、スルホキシド(sulfoxide)、N-(2-エチルヘキシル)-8, 9, 10-トリノルボルン-5-エン-2, 3-ジカルボキシイミド(MGK 264)、N-デクリイミダゾール(N-decylimidazole)、WARF-アンチレジスタント(WARF-antiresistant)、TBPT、TPP、IBP、PSCP、ヨウ化メチル(CH₃I)、t-フェニルブテノン(t-phenyl butenone)、ジエチルマレエート(diethylmaleate)、DMC、FDMC、ETP、及びETN。

【実施例】

50

【0305】

以下、本発明を製造例、参考製造例、製剤例及び試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例のみに限定されるものではない。

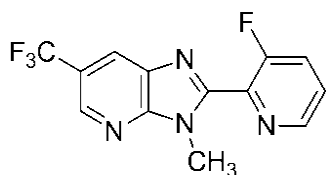
まず、本発明化合物の製造について、製造例を示す。

【0306】

製造例 1 (1)

N²-メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン 0.76 g、3-フルオロピリジン-2-カルボアルデヒド 0.50 g、亜硫酸水素ナトリウム 0.50 g 及び DMF 3 ml の混合物を 120℃ で 8 時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、中間体化合物 (M6-2) と記す。) 0.43 g を得た。

中間体化合物 (M6-2)



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.75 (1H, d), 8.66-8.63 (1H, m), 8.40 (1H, d), 7.73-7.67 (1H, m), 7.56-7.51 (1H, m), 4.16 (3H, s).

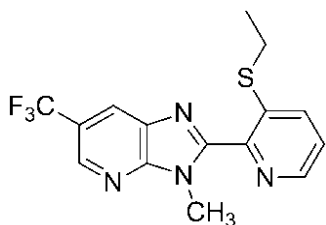
【0307】

製造例 1 (2)

中間体化合物 (M6-2) 1.23 g と DMF 3.5 ml の混合物に、氷冷下、ナトリウムエタニチオラート 0.48 g を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本発明化合物 1 と記す。) 1.39 g を得た。

【0308】

本発明化合物 1



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.73 (1H, d), 8.53 (1H, dd), 8.39 (1H, d), 7.80 (1H, dd), 7.40 (1H, dd), 4.04 (3H, s), 2.97 (2H, q), 1.35 (3H, t).

【0309】

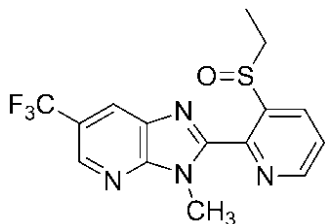
製造例 2、3

2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.62 g 及びクロロホルム 10 ml の混合物に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 0.79 g を添加した後、室温で 5 時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスル

ィニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(以下、本発明化合物2と記す。) 87 mg、及び2-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(以下、本発明化合物3と記す。) 0.49 gを得た。

【0310】

本発明化合物2

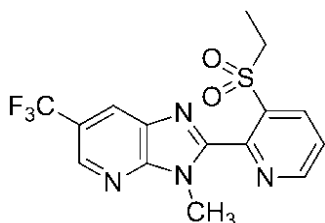


10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.85 (1H, dd), 8.77 (1H, s), 8.67 (1H, dd), 8.34 (1H, s), 7.69 (1H, dd), 4.36 (3H, s), 3.72-3.62 (1H, m), 3.14-3.04 (1H, m), 1.47 (3H, t).

【0311】

本発明化合物3



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.01 (1H, dd), 8.76 (1H, s), 8.55 (1H, dd), 8.31 (1H, s), 7.74 (1H, dd), 3.88 (3H, s), 3.83 (2H, q), 1.37 (3H, t).

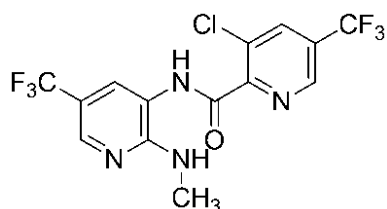
【0312】

製造例4(1)

N^2 -メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2, 3-ジアミン 0.70 g、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸 0.53 g、WSC 0.82 g、HOBt 42 mg 及びピリジン 4.5 ml の混合物を、60℃で4時間攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、中間体化合物(M20-3)を得た。

30

中間体化合物(M20-3)

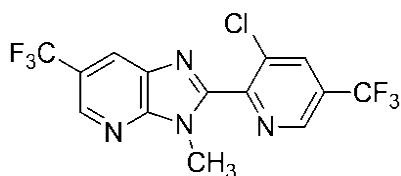


40

得られた中間体化合物(M3-4)の全量、p-トルエンスルホン酸一水和物 1.04 g 及びN-メチルピロリジノン 4 ml の混合物を、150℃で2.5時間加熱攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン(以下、中間体化合物(M6-3)と記す。) 0.71 gを得た。

中間体化合物(M6-3)

50



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.96 (1H, d), 8.79 (1H, d), 8.42 (1H, d), 8.22 (1H, d), 4.02 (3H, s).

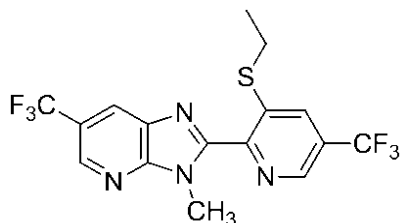
【0313】

製造例 4 (2)

2-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.71 g と DMF 4 ml の混合物に、氷冷下、ナトリウムエタンチオラート 0.24 g を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本発明化合物 4 と記す。) 0.76 g を得た。

【0314】

本発明化合物 4



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.77 (1H, d), 8.75 (1H, d), 8.43 (1H, d), 7.93 (1H, d), 4.11 (3H, s), 3.02 (2H, q), 1.40 (3H, t).

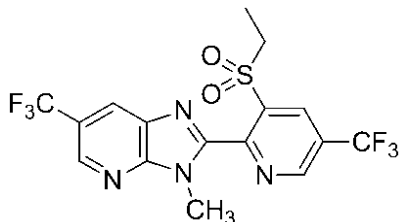
【0315】

製造例 5

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.61 g 及びクロロホルム 10 ml の混合物に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 0.66 g を添加した後、室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下で濃縮し、2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本発明化合物 5 と記す。) 0.62 g を得た。

【0316】

本発明化合物 5



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.25 (1H, d), 8.80 (1H, d), 8.79 (1H, d), 8.34 (1H, d), 3.96 (2H, q), 3.94 (3H, s), 1.42 (3H, t).

【0317】

10

20

30

40

50

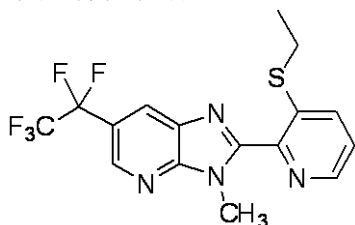
製造例 6

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 835 mg、ペンタフルオロプロピオン酸ナトリウム 2.0 g、ヨウ化銅 2.0 g、NMP 10 mL、キシレン 50 mL の混合物を、150℃で8時間加熱撹拌した。室温まで放冷後、40%アンモニア水溶液および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 6 と記す。） 303 mg を得た。

10

【0318】

本発明化合物 6



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.69 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.40 (1H, d), 7.80 (1H, dd), 7.39 (1H, dd), 4.06 (3H, s), 2.97 (2H, q), 1.34 (3H, t).

20

【0319】

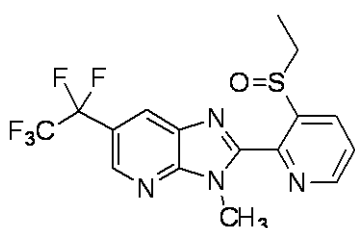
製造例 7、8

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 254 mg、クロロホルム 10 mL の混合物に、氷冷下 m-クロロ過安息香酸（純度 65% 以上）266 mg を加えた。混合物を室温まで昇温し、0.5 時間撹拌した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エタンスルフィニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 7 と記す。） 8 mg 及び 2-(3-エタンスルホニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 8 と記す。） 235 mg を得た。

30

【0320】

本発明化合物 7

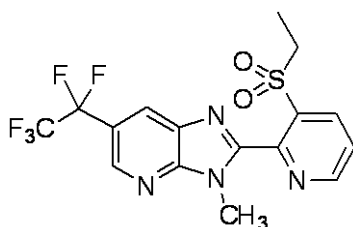


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.85 (1H, dd), 8.72 (1H, d), 8.68 (1H, dd), 8.31 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 4.36 (3H, s), 3.72-3.61 (1H, m), 3.17-3.06 (1H, m), 1.47 (3H, t).

40

【0321】

本発明化合物 8



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.00 (1H, dd), 8.72 (1H, d), 8.55 (1H, dd), 8.30 (1H, d), 7.73 (1H, dd), 3.89 (3H, s), 3.84 (2H, q), 1.37 (3H, t).

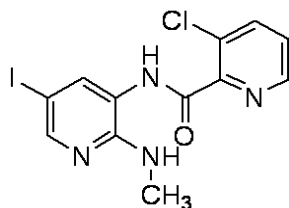
【0322】

10

製造例 9 (1)

5-ヨード-N²-メチル-ピリジン-2, 3-ジアミン 1.9 g、ピリジン 6 mL の混合物に、WSC 1.28 g、HOBt 86 mg 及び 3-クロロ-ピリジン-2-カルボン酸 1.3 g を加え、室温下 9 時間攪拌した。この反応混合物に水を注加し、析出した粉を濾取し、クロロホルムで洗浄する事で、3-クロロ-ピリジン-2-カルボン酸 (5-ヨード-2-メチルアミノ-ピリジン-3-イル)-アミド (以下、中間体化合物 (M20-7) と記す。) 3.6 g を得た。

中間体化合物 (M20-7)



20

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6) δ : 9.95 (1H, s), 8.65 (1H, d), 8.15-8.10 (2H, m), 8.00 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 6.30 (1H, d), 2.81 (3H, d).

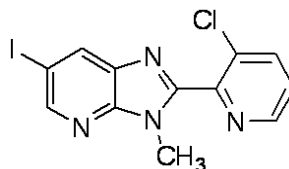
【0323】

製造例 9 (2)

中間体化合物 (M20-7) 3.4 g、p-トルエンスルホン酸一水和物 5.8 g、DMF 30 mL、トルエン 120 mL の混合物を、130°C で 12 時間加熱攪拌した。室温まで放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、中間体化合物 (M6-7) と記す。) 2.0 g を得た。

30

中間体化合物 (M6-7)



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.70 (1H, d), 8.66-8.63 (1H, m), 8.47-8.44 (1H, m), 7.95 (1H, d), 7.45 (1H, dd), 3.90 (3H, s).

【0324】

製造例 9 (3)

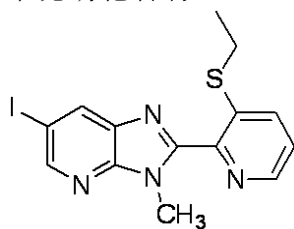
中間体化合物 (M6-7) 2.0 g、ナトリウムエタンチオラート 888 mg、DMF 45 mL の混合物を、50°C で 12 時間加熱攪拌した。室温まで放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた

50

後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物9と記す。)1.0gを得た。

【0325】

本発明化合物9



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.61 (1H, d), 8.51 (1H, dd), 8.45 (1H, d), 7.76 (1H, dd), 7.37 (1H, dd), 3.96 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.33 (3H, t).

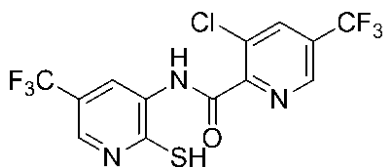
【0326】

製造例10(1)

3-アミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-チオール0.45g、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸0.55g、WSC0.67g、HOBt31mg及びピリジン4.5mLの混合物を、60℃で4時間攪拌した。放冷した反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮することにより、中間体化合物(M20-9)を得た。

20

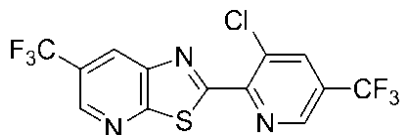
中間体化合物(M20-9)



得られた中間体化合物(M20-9)の全量、p-トルエンスルホン酸一水和物1.04g及びN-メチルピロリジノン3.5mLの混合物を、150℃で2時間加熱攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、中間体化合物(M6-9)と記す。)0.29gを得た。

30

中間体化合物(M6-9)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.94 (1H, d), 8.90 (1H, d), 8.69 (1H, d), 8.19 (1H, d).

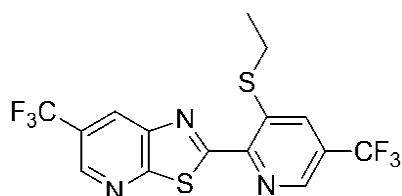
40

【0327】

製造例10(2)

2-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて中間体化合物(M6-9)を用い、製造例4(2)記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本発明化合物10と記す。)を得た。

本発明化合物10



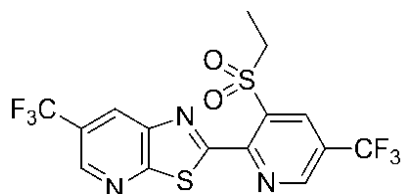
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.91 (1H, d), 8.70–8.67 (2H, m), 7.91 (1H, s), 3.09 (2H, q), 1.51 (3H, t).

【0328】

製造例 11

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジンを用い、製造例5記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本発明化合物11と記す。)を得た。

本発明化合物 11



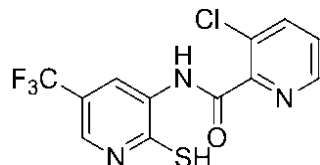
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.19 (1H, d), 8.98 (1H, d), 8.89 (1H, d), 8.61 (1H, d), 4.17 (2H, q), 1.49 (3H, t).

【0329】

製造例 12 (1)

3-アミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-チオール 0.45 g、3-クロロピリジン-2-カルボン酸 0.39 g、WSC 0.67 g、HOBt 31 mg 及びピリジン 4 ml の混合物を、室温で12時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、析出した固体を濾取した。得られた固体を水及びn-ヘキサンで洗浄後、乾燥し、3-クロロピリジン-2-カルボン酸(2-メルカプト-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-アミド(以下、中間体化合物(M20-11)と記す。) 0.45 g を得た。

中間体化合物 (M20-11)

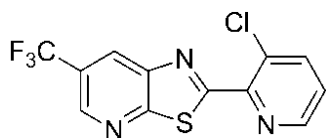


【0330】

製造例 12 (2)

中間体化合物(M20-11) 0.45 g、p-トルエンスルホン酸一水和物 0.70 g 及びNMP 4 mL の混合物を、150℃で2時間攪拌した。放冷した反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-クロロピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、中間体化合物(M6-11)と記す。) 0.47 g を得た。

中間体化合物 (M6-11)



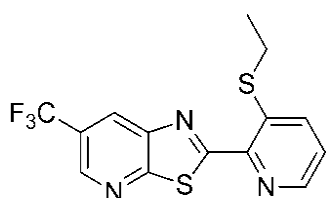
【0331】

製造例 12 (3)

2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて中間体化合物(M6-11)を用い、製造例 1(2)記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本発明化合物41と記す。)を得た。

10

本発明化合物 41



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.87 (1H, d), 8.64 (1H, d), 8.48 (1H, dd), 7.76 (1H, dd), 7.37 (1H, dd), 3.06 (2H, q), 1.49 (3H, t).

20

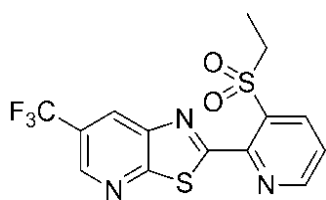
【0332】

製造例 12 (4)

2-(3-エチルスルファニル-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン 0.36 g 及びクロロホルム 5 ml の混合物に、m-クロロ過安息香酸(純度 65%以上) 0.56 g を加え、室温で 12 時間攪拌した。反応混合物に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液と飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧下で濃縮し、2-(3-エチルスルホニル-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン(以下、本発明化合物 12 と記す。) 0.27 g、及び 2-(3-エチルスルホニル-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)チアゾロ[5,4-b]ピリジン 4-オキシド(以下、本発明化合物 22 と記す。) 91 mg を得た。

30

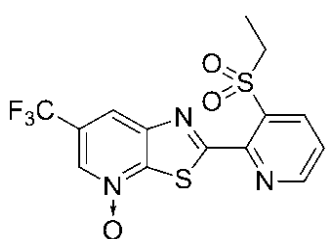
本発明化合物 12



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.98-8.93 (2H, m), 8.66 (1H, dd), 8.57 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 4.13 (2H, q), 1.45 (3H, t).

40

本発明化合物 22



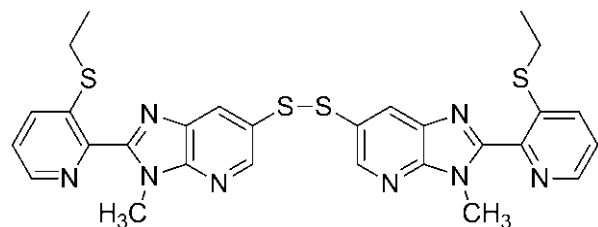
50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.96 (1H, dd), 8.68 (1H, dd), 8.62 (1H, s), 8.20 (1H, s), 7.74 (1H, dd), 4.06 (2H, q), 1.44 (3H, t).

【0333】

製造例13 (1)

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン1.1g、ヨウ化銅160mg、硫化ナトリウム9水和物2.7g、DMF10mLの混合物を、110℃で5時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下式



で示される化合物(以下、中間体化合物(P9'-1)と記す。)710mgを得た。

中間体化合物(P9'-1)

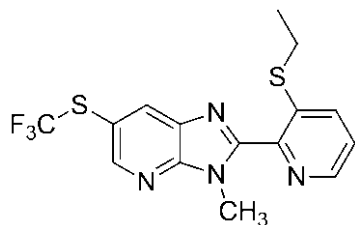
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 8.56-8.55 (2H, m), 8.53-8.50 (2H, m), 8.38-8.36 (2H, m), 8.04 (2H, d), 7.61-7.56 (2H, m), 3.87 (6H, brs), 3.00 (4H, q), 1.23-1.16 (6H, m).

【0334】

製造例13 (2)

中間体化合物(P9'-1)710mgとDMF12mLの混合物を、-60℃に冷却し、トリフルオロヨードメタン10gを加えた。この混合物に-40℃で、テトラキス(ジメチルアミノ)エチレン1.2mLを滴下した。-10℃まで昇温し、-10℃で5時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物13と記す。)530mgを得た。

本発明化合物13



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.67 (1H, d), 8.52 (1H, dd), 8.46 (1H, d), 7.79 (1H, dd), 7.39 (1H, dd), 4.03 (3H, s), 2.97 (2H, q), 1.36 (3H, t).

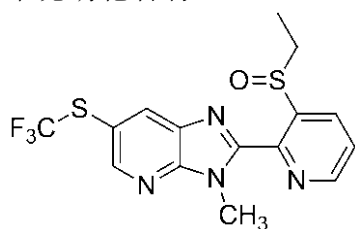
【0335】

製造例14、15

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン200mg、m-クロロ過安息香酸(純度65%以上)230mg、クロロホルム10mLの混合物を、氷冷下5時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルフィニル-ピリジン-2-イル)-

3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物14と記す。）89mg及び2-（3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル）-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物15と記す。）130mgを得た。

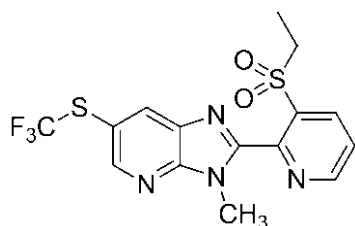
本発明化合物14



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.87–8.83 (1H, m), 8.73–8.64 (2H, m), 8.41 (1H, d), 7.72–7.66 (1H, m), 4.34 (3H, s), 3.72–3.62 (1H, m), 3.17–3.05 (1H, m), 1.47 (3H, t).

本発明化合物15



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.01–8.98 (1H, m), 8.71 (1H, d), 8.55–8.52 (1H, m), 8.39 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 3.90–3.81 (5H, m), 1.36 (3H, t).

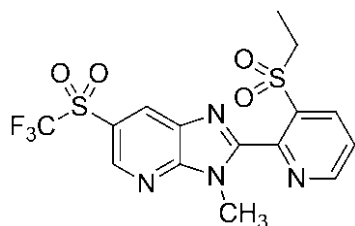
【0336】

製造例16

2-（3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル）-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン270mg、タングステン酸ナトリウム2水和物110mg、アセトニトリル5mLの混合物に、40℃で30%過酸化水素水2mLを加えた。80℃まで昇温し、24時間攪拌した。混合物に、飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-（3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル）-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルホニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物16と記す。）280mgを得た。

30

本発明化合物16



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.08 (1H, d), 9.04 (1H, dd), 8.71 (1H, d), 8.57 (1H, dd), 7.79 (1H, dd), 3.93 (3H, s), 3.82 (2H, q), 1.38 (3H, t).

【0337】

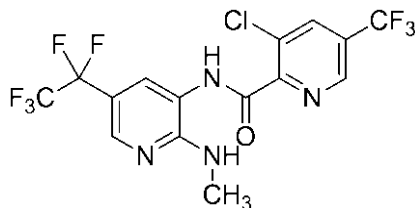
製造例17(1)

N^2 -メチル-5-ペンタフルオロエチル-ピリジン-2,3-ジアミン590mg、3-クロロ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-カルボン酸560mg、WSC52

50

0 m g、H O B t 3 5 m g、ピリジン 5 m L の混合物を、室温下 5 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮することにより、中間体化合物 (M 2 0 - 1 7) を得た。

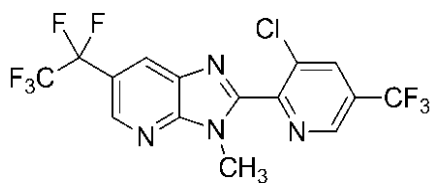
中間体化合物 (M 2 0 - 1 7)



10

得られた中間体化合物 (M 2 0 - 1 7) を D M F 7 . 5 m L、トルエン 3 0 m L の混合溶媒に溶解し、p - トルエンスルホン酸 1 水和物 1 . 5 g を加え、1 6 0 °C で 6 時間攪拌した。反応混合物を室温まで放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、t - ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2 - (3 - クロロ - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン (以下、中間体化合物 (M 6 - 1 7) と記す。) 5 4 0 m g を得た。

中間体化合物 (M 6 - 1 7)



20

$^1\text{H-NMR}$ (C D C l ₃) δ : 8 . 9 6 (1 H , d) , 8 . 7 4 (1 H , d) , 8 . 4 0 (1 H , d) , 8 . 2 3 (1 H , d) , 4 . 0 3 (3 H , s) .

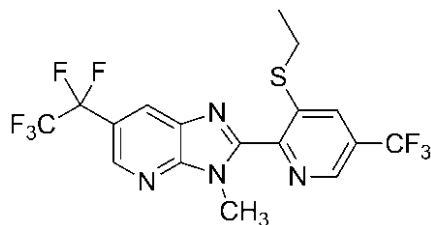
【 0 3 3 8 】

製造例 1 7 (2)

2 - (3 - フルオロピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジンに代えて、中間体化合物 (M 6 - 1 7) を用い、製造例 1 (2) 記載の方法に準じて、2 - (3 - エチルスルファニル - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン (以下、本発明化合物 1 7 と記す。) を得た。

30

本発明化合物 1 7



40

$^1\text{H-NMR}$ (C D C l ₃) δ : 8 . 7 5 (1 H , d) , 8 . 7 1 (1 H , d) , 8 . 4 2 (1 H , d) , 7 . 9 3 (1 H , d) , 4 . 1 2 (3 H , s) , 3 . 0 3 (2 H , q) , 1 . 4 1 (3 H , t) .

【 0 3 3 9 】

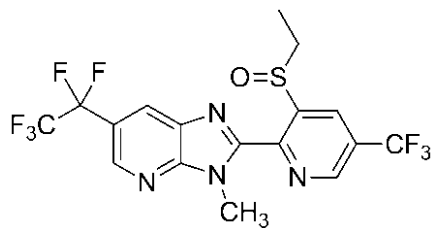
製造例 1 8、1 9

2 - (3 - エチルスルファニルピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - トリフルオロメチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジンに代えて、2 - (3 - エチルスルファニル - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - 3 - メチル - 6 - ペンタフルオロエチル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジンを用い、製造例 2 , 3 記載の方法に準じて、2 - (3 - エチルスルフィニル - 5 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル) - 3

50

ーメチルー6ーペンタフルオロエチルー3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物18と記す。)及び2-(3-エチルスルホニルー5-トリフルオロメチルーピリジン-2-イル)ー3-メチルー6-ペンタフルオロエチルー3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物19と記す。)を得た。

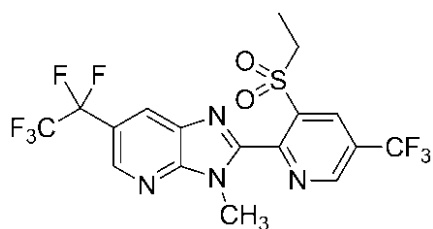
本発明化合物18



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.10 (1H, d), 8.94 (1H, d), 8.76 (1H, d), 8.36 (1H, d), 4.41 (3H, s), 3.76–3.66 (1H, m), 3.18–3.07 (1H, m), 1.49 (3H, t).

本発明化合物19



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.27 (1H, d), 8.80 (1H, d), 8.76 (1H, s), 8.34 (1H, s), 4.01–3.94 (5H, m), 1.41 (3H, t).

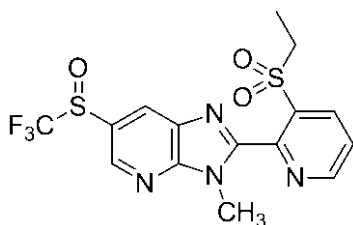
【0340】

製造例20

2-(3-エチルスルホニルーピリジン-2-イル)ー3-メチルー6-トリフルオロメチルスルファニルー3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン500mg及びクロロホルム10mLの混合物に、氷冷下m-クロロ過安息香酸(純度65%以上)429mgを加え、室温で1時間及び50℃で2時間攪拌した。反応混合物にチオ硫酸ナトリウム水溶液及び炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルホニルーピリジン-2-イル)ー3-メチルー6-トリフルオロメチルスルフィニルー3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物20と記す。)353mgを得た。

30

本発明化合物20



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.02 (1H, dd), 8.77 (1H, d), 8.60–8.52 (2H, m), 7.75 (1H, dd), 3.91 (3H, s), 3.83 (2H, q), 1.38 (3H, t).

【0341】

製造例21(1)

4-ヨードー2-ニトロフェニルアミン2.0g、60%水素化ナトリウム(油状)330mg、DMF20mLの混合物に、氷冷下ヨードメタン470μLを滴下した。この反応混合物を室温に昇温した後、2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチル

50

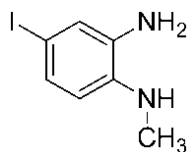
で抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、(4-ヨード-2-ニトロフェニル)-メチルアミン 2.0 g を得た。



【0342】

製造例 21 (2)

鉄粉 1.7 g、酢酸 2.2 mL、エタノール 80 mL、水 25 mL の混合物を 70 °C で攪拌した。その反応混合物に (4-ヨード-2-ニトロフェニル)-メチルアミン 2.0 g 及びエタノール 20 mL の混合物を滴下した。滴下後、70 °C で 6 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、THF で洗い込んだ。得られた濾液を減圧下濃縮した。得られた残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、4-ヨード-N¹-メチルベンゼン-1,2-ジアミン 1.6 g を得た。

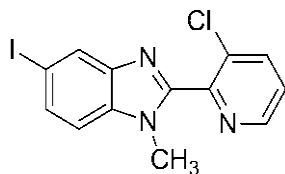


【0343】

製造例 21 (3)

4-ヨード-N¹-メチルベンゼン-1,2-ジアミン 850 mg、3-クロロピリジン-2-カルボン酸 590 mg、WSC 790 mg、HOBt 46 mg、ピリジン 10 mL の混合物を、100 °C で 12 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-クロロピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、中間体化合物 (M6-21) と記す。) 930 mg を得た。

中間体化合物 (M6-21)

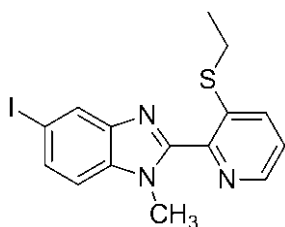


【0344】

製造例 21 (4)

2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4,5-b] ピリジンに代えて、中間体化合物 (M6-21) を用い、製造例 1 (2) 記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 21 と記す。) を得た。

本発明化合物 21



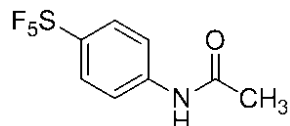
¹H-NMR (CDCl₃) δ : 8.49 (1H, dd), 8.22 (1H, d), 7.7

5 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 7.35 (1H, dd), 7.21 (1H, d), 3.87 (3H, s), 2.92 (2H, q), 1.32 (3H, t).

【0345】

製造例22(1)

4-アミノフェニルサルファーペンタフルオリド5.2g、無水酢酸2.7mL、トリエチルアミン6.6mL及びクロロホルム20mLの混合物を、室温下3時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、クロロホルムで抽出した。得られた残渣をヘキサン、酢酸エチルを用いて再結晶を行い4-アセトアミドフェニルサルファーペンタフルオリド5.4gを得た。

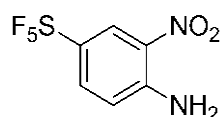


10

【0346】

製造例22(2)

4-アセトアミドフェニルサルファーペンタフルオリド5.4g、硫酸15mLの混合物に、氷冷下発煙硝酸905mLを滴下した。滴下後、室温で3時間攪拌した。反応混合物を氷にあげ、析出した結晶を濾取した。結晶を水で洗浄後、乾燥することで4-アミノ-3-ニトロフェニルサルファーペンタフルオリド5.2gを得た。

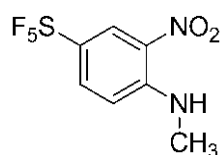


20

【0347】

製造例22(3)

4-アミノ-3-ニトロフェニルサルファーペンタフルオリド2.0g、60%水素化ナトリウム(油状)310mg及びDMF15mLの混合物に、氷冷下ヨードメタン447μLを滴下した。滴下後、室温で3時間攪拌した。反応混合物を氷にあげ、析出した固体を濾取した。固体を水で洗浄後、乾燥することでメチル-(2-ニトロ-4-ペンタフルオロスルファニルフェニル)-アミン2.0gを得た。



30

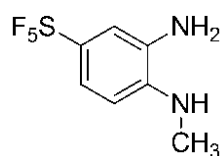
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.60 (1H, d), 8.28 (1H, brs), 7.78 (1H, dd), 6.89 (1H, d), 3.10 (3H, d).

【0348】

製造例22(4)

(4-ヨード-2-ニトロフェニル)-メチルアミンに代えて、メチル-(2-ニトロ-4-ペンタフルオロスルファニルフェニル)-アミンを用い、製造例21(2)に記載の方法に準じて、N¹-メチル-4-ペンタフルオロスルファニルベンゼン-1,2-ジアミンを得た。

40



【0349】

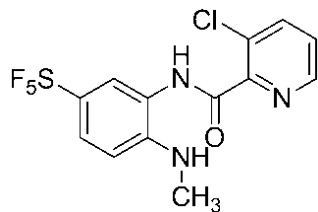
製造例22(5)

5-ヨード-N²-メチルピリジン-2,3-ジアミンに代えて、N¹-メチル-4-ペンタフルオロスルファニルベンゼン-1,2-ジアミンを用い、製造例9(1)に記載の方法に準じて、3-クロロピリジン-2-カルボン酸(2-メチルアミノ-5-ペン

50

タフルオロスルファニルフェニル)ーアミド(以下、中間体化合物(M20-23)と記す。))を得た。

中間体化合物(M20-23)



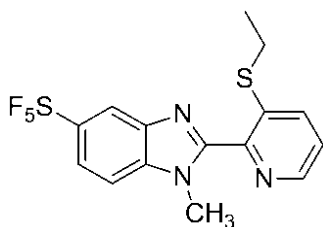
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.57 (1H, s), 8.55 (1H, dd), 7.91 (1H, dd), 7.81 (1H, d), 7.59 (1H, dd), 7.50–7.45 (1H, m), 6.71 (1H, d), 4.52 (1H, d), 2.93 (3H, d)

【0350】

製造例22(6)

中間体化合物(M20-23) 405mg、DMF 10mlの混合物に、氷冷下、ナトリウムエタニチオラート 193mgを加え、室温で8時間及び60度で2時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロスルファニル-1H-ベンズイミダゾール(以下、本発明化合物23と記す。) 411mgを得た。

本発明化合物23



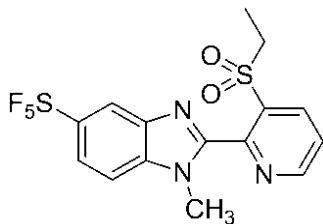
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.50 (1H, dd), 8.33 (1H, d), 7.79–7.74 (2H, m), 7.46–7.43 (1H, m), 7.37 (1H, dd), 3.92 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.33 (3H, t).

【0351】

製造例23

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロスルファニル-1H-ベンズイミダゾールを用い、製造例11に記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロスルファニル-1H-ベンズイミダゾール(以下、本発明化合物24と記す。)を得た。

本発明化合物24



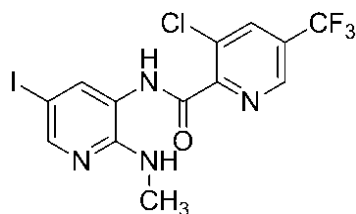
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.96 (1H, dd), 8.50 (1H, dd), 8.24 (1H, d), 7.79 (1H, dd), 7.68 (1H, dd), 7.48 (1H, d), 3.82 (2H, q), 3.75 (3H, s), 1.34 (3H, t).

【0352】

製造例24(1)

3-クロロピリジン-2-カルボン酸に代えて、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸を用い、製造例9(1)記載の方法に準じて、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸(5-ヨード-2-メチルアミノピリジン-3-イル)-アミド(以下、中間体化合物(M20-35)と記す。)を得た。

中間体化合物(M20-35)



10

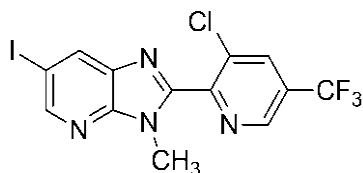
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.33 (1H, s), 8.80 (1H, d), 8.28 (1H, d), 8.17 (1H, d), 8.00 (1H, d), 4.60 (1H, s), 3.01 (3H, d).

【0353】

製造例24(2)

3-クロロピリジン-2-カルボン酸(5-ヨード-2-メチルアミノピリジン-3-イル)-アミドに代えて、中間体化合物(M20-35)を用い、製造例9(2)記載の方法に準じて、2-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、中間体化合物(M6-35)を得た。

中間体化合物(M6-35)



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.95 (1H, s), 8.68 (1H, s), 8.49 (1H, s), 8.20 (1H, s), 3.95 (3H, s).

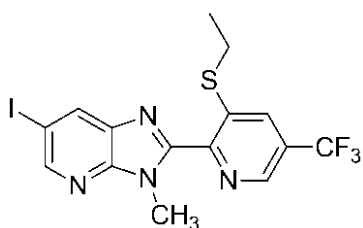
【0354】

製造例24(3)

2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて、中間体化合物(M6-35)を用い、製造例1(2)記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物42と記す。)を得た。

本発明化合物42

40



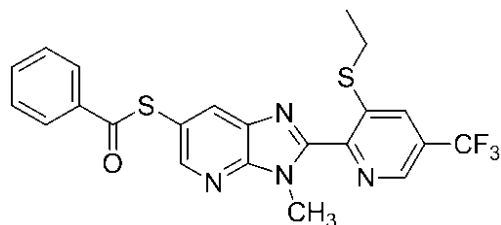
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.73 (1H, s), 8.65 (1H, d), 8.49 (1H, d), 7.91 (1H, s), 4.04 (3H, s), 3.01 (2H, q), 1.39 (3H, t).

【0355】

50

製造例 24 (4)

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-6-ヨード-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 900 mg、チオ安息香酸 320 μ L、ヨウ化銅 45 mg、1,10-フェナントロリン 85 mg、ジイソプロピルエチルアミン 940 μ L、トルエン 25 mL の混合物を、110℃で8時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、チオ安息香酸 S-[2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン] エステル 990 mg を得た。



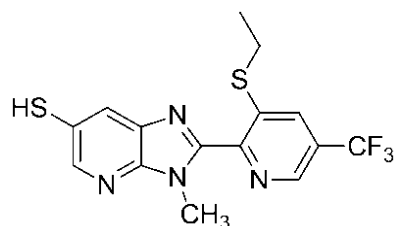
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74 (1H, s), 8.54 (1H, d), 8.33 (1H, d), 8.07 (2H, dd), 7.92 (1H, s), 7.63 (1H, t), 7.51 (2H, t), 4.10 (3H, s), 3.01 (2H, q), 1.39 (3H, t).

【0356】

製造例 24 (5)

チオ安息香酸 S-[2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン] エステル 1.8 g、炭酸カリウム 1.1 g、メタノール 20 mL の混合物を室温下 4.5 時間攪拌した。反応混合物に、飽和塩化アンモニウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下濃縮することで、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-チオール (以下、本発明化合物 43 と記す。) 1.2 g を得た。

本発明化合物 43



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.73 (1H, s), 8.46 (1H, d), 8.19 (1H, d), 7.90 (1H, s), 4.04 (3H, s), 3.01 (2H, q), 1.39 (3H, t).

【0357】

製造例 24 (6)

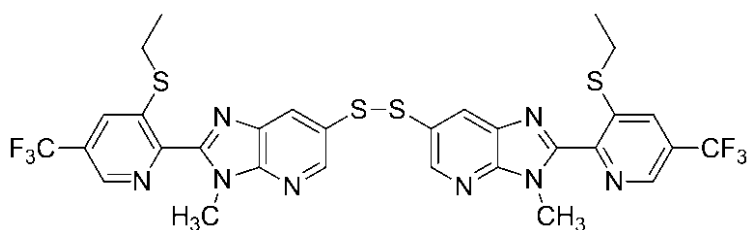
2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-6-チオール 1.2 g、ヨウ素 20 mg、DMF 30 mL の混合物を、室温下、空気雰囲気中 12 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、下式

10

20

30

40



で示される化合物（以下、中間体化合物（P 9' - 4）と記す。）800mgを得た。

中間体化合物（P 9' - 4）

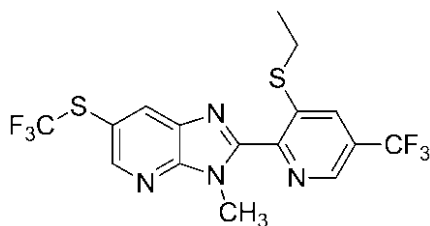
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.73 (2H, s), 8.52 (2H, d), 8.35 (2H, d), 7.91 (2H, d), 4.06 (6H, s), 3.04–2.98 (4H, m), 1.39 (6H, t).

【0358】

製造例24(7)

中間体化合物（P 9' - 1）に代えて、中間体化合物（P 9' - 4）を用い、製造例13(2)記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物28と記す）を得た。

本発明化合物28



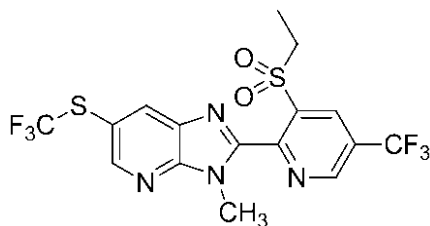
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75 (1H, d), 8.71 (1H, d), 8.50 (1H, d), 7.93 (1H, d), 4.10 (3H, s), 3.03 (2H, q), 1.41 (3H, t).

【0359】

製造例24(8)

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 299mg及びクロロホルム30mLの混合物に、氷冷下m-クロロ過安息香酸（純度65%以上）0.34gを加え、氷冷下、5時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物44と記す。）0.24gを得た。

本発明化合物44



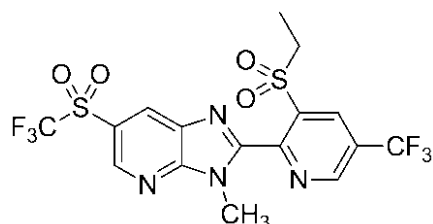
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.24 (1H, d), 8.79 (1H, d), 8.74 (1H, d), 8.40 (1H, d), 3.97 (2H, q), 3.93 (3H, s), 1.42 (3H, t).

製造例24(9)

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロ

メチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンを用い、製造例16記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルホニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物25と記す。)を得た。

本発明化合物25



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.28 (1H, d), 9.10 (1H, d), 8.80 (1H, d), 8.72 (1H, d), 3.98 (3H, s), 3.93 (2H, q), 1.43 (3H, t).

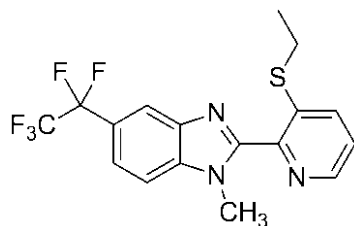
【0360】

製造例25

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾール340mg、ヨウ化銅410mg、ペンタフルオロプロピオン酸ナトリウム800mg、NMP5mL、キシレン5mLの混合物を、160℃で5時間攪拌した。反応混合物を室温まで放冷後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び28%アンモニア溶液を注加し、t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾール(以下、本発明化合物26と記す。)240mgを得た。

20

本発明化合物26



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.50 (1H, dd), 8.16 (1H, s), 7.77 (1H, dd), 7.57 (1H, d), 7.53 (1H, d), 7.36 (1H, dd), 3.93 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.33 (3H, t).

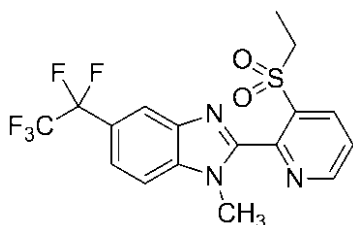
【0361】

製造例26

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて、2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾールを用い、製造例5に記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾール(以下、本発明化合物27と記す。)を得た。

40

本発明化合物27



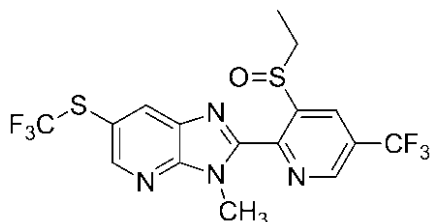
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.98 (1H, dd), 8.53 (1H, dd), 8.06 (1H, s), 7.70 (1H, dd), 7.60 (1H, d), 7.56 (1H, d), 3.86–3.78 (5H, m), 1.34 (3H, t).

【0362】

製造例 27

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 0.18 g 及びクロロホルム 4 ml の混合物に、氷冷下 m-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 0.21 g を加え、氷冷下、5 分間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチルスルファニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン (以下、本発明化合物 29 と記す。) 0.16 g を得た。

本発明化合物 29



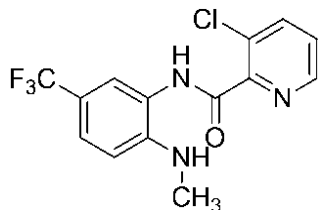
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.10–9.07 (1H, m), 8.94–8.91 (1H, m), 8.77–8.74 (1H, m), 8.46–8.44 (1H, m), 4.38 (3H, s), 3.76–3.65 (1H, m), 3.16–3.05 (1H, m), 1.49 (3H, t).

【0363】

製造例 28 (1)

5-ヨード-N²-メチル-ピリジン-2,3-ジアミンに代えて、N¹-メチル-4-トリフルオロメチル-ベンゼン-1,2-ジアミンを用い、製造例 9 (1) に記載の方法に準じて、3-クロロ-ピリジン-2-カルボン酸 (2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチル-フェニル)-アミド (以下、中間体化合物 (M20-29) と記す。) を得た。

中間体化合物 (M20-29)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.56 (1H, s), 8.55–8.54 (1H, m), 7.91 (1H, dd), 7.70 (1H, d), 7.49–7.43 (3H, m), 6.79 (1H, d), 2.93 (3H, d).

【0364】

製造例 28 (2)

中間体化合物 (M20-29) 800 mg、ナトリウムエタンチオラート 350 mg、D

10

20

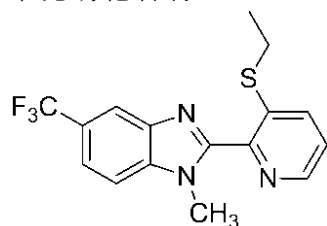
30

40

50

MF 10 mL の混合物を、100℃で5時間攪拌した。反応混合物に、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール（以下、本発明化合物30と記す。）410mgを得た。

本発明化合物30



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.51 (1H, dd), 8.17 (1H, d), 7.78 (1H, dd), 7.61 (1H, dd), 7.52 (1H, d), 7.38 (1H, dd), 3.93 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.33 (3H, t).

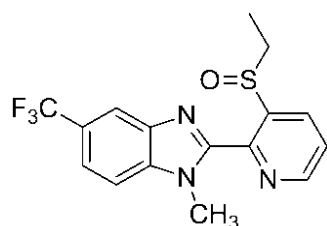
【0365】

製造例29、30

2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて、2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾールを用い、製造例2、3に記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルフィニルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール（以下、本発明化合物31と記す。）及び2-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール（以下、本発明化合物32と記す。）を得た。

20

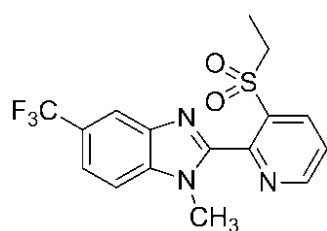
本発明化合物31



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.77 (1H, d), 8.61 (1H, d), 8.05 (1H, s), 7.61 (1H, dd), 7.55 (1H, d), 7.48 (1H, d), 4.20 (3H, s), 3.73-3.61 (1H, m), 3.11-3.00 (1H, m), 1.47 (3H, t).

本発明化合物32



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.95 (1H, dd), 8.50 (1H, dd), 8.09 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 7.61 (1H, d), 7.53 (1H, d), 3.83 (2H, q), 3.75 (3H, s), 1.33 (3H, t).

【0366】

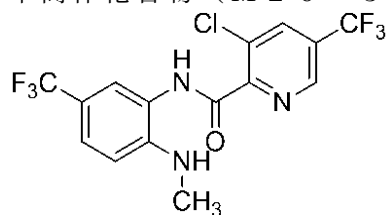
製造例31(1)

5-ヨード-N²-メチルピリジン-2,3-ジアミンに代えて、N¹-メチル-4-トリフルオロメチルベンゼン-1,2-ジアミンを用い、3-クロロピリジン-2-カ

50

ルボン酸に代えて、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸を用い、製造例9(1)に記載の方法に準じて、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルフェニル)-アミド(以下、中間体化合物(M20-31)と記す。)を得た。

中間体化合物(M20-31)



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.42 (1H, s), 8.80 (1H, d), 8.16 (1H, d), 7.71 (1H, s), 7.47 (1H, d), 6.81 (1H, d), 4.32 (1H, s), 2.93 (3H, d).

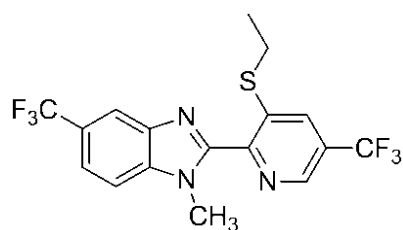
【0367】

製造例31(2)

3-クロロピリジン-2-カルボン酸(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルフェニル)-アミドに代えて、中間体化合物(M20-31)を用い、製造例28(2)記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール(以下、本発明化合物33と記す。)及び3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸(2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルフェニル)-アミド(以下、中間体化合物(M3-32)と記す。)を得た。

20

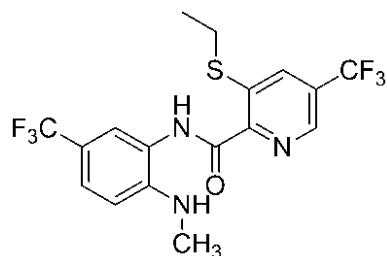
本発明化合物33



30

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.72 (1H, d), 8.21 (1H, d), 7.91 (1H, d), 7.63 (1H, d), 7.54 (1H, d), 4.00 (3H, s), 3.00 (2H, q), 1.38 (3H, t).

中間体化合物(M3-32)



40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.64 (1H, s), 8.53 (1H, d), 7.86 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.41 (1H, dd), 6.76 (1H, d), 4.35 (1H, d), 2.96 (2H, q), 2.90 (3H, d), 1.44 (3H, t).

【0368】

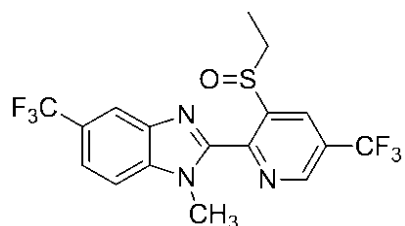
製造例32、33

2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチ

50

ルー 1 H-ベンズイミダゾールを用い、製造例 2, 3 記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルフィニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1 H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 3 4 と記す。) 及び 2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1 H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 3 5 と記す。) を得た。

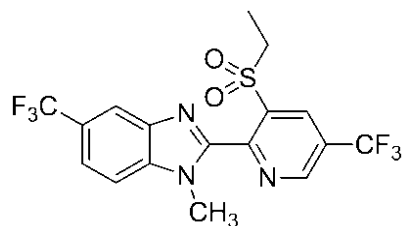
本発明化合物 3 4



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, d), 8.91 (1H, d), 8.12 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 7.60 (1H, d), 4.32 (3H, s), 3.80-3.70 (1H, m), 3.15-3.05 (1H, m), 1.51 (3H, t).

本発明化合物 3 5



20

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.22 (1H, d), 8.77 (1H, d), 8.10 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 7.57 (1H, d), 3.98 (2H, q), 3.84 (3H, s), 1.40 (3H, t).

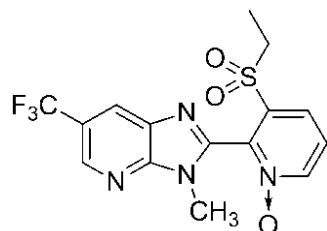
【0369】

製造例 3 4、3 5

2-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 550 mg 及びクロロホルム 15 ml の混合物に m-クロロ過安息香酸 (純度 65% 以上) 750 mg を加え、20 時間加熱還流した。反応混合物に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、減圧下濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルホニル-1-オキシピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン (以下、本発明化合物 3 6 と記す。) 168 mg、及び 2-(3-エチルスルホニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3 H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 4-オキシド (以下、本発明化合物 3 7 と記す。) 73 mg を得た。

30

本発明化合物 3 6



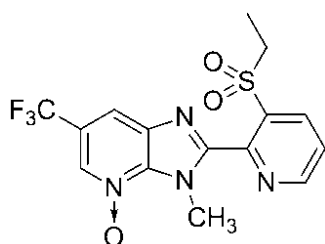
40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.79 (1H, d), 8.54 (1H, dd), 8.33 (1H, d), 7.99 (1H, dd), 7.69 (1H, dd), 3.85-3.7

50

4 (4 H, m), 3.52-3.42 (1 H, m), 1.34 (3 H, t).

本発明化合物 37



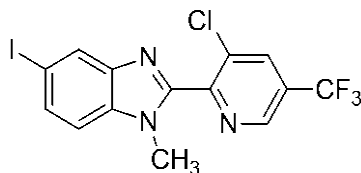
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.03 (1 H, dd), 8.53 (1 H, dd), 8.47 (1 H, d), 7.92 (1 H, d), 7.77 (1 H, dd), 4.29 (3 H, s), 3.69 (2 H, q), 1.36 (3 H, t).

【0370】

製造例 36 (1)

N^2 -メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミンに代えて、4-ヨード- N^1 -メチル-ベンゼン-1,2-ジアミンを用い、製造例 4 (1) 記載の方法に準じて、2-(3-クロロ-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、中間体化合物 (M6-41) と記す。) を得た。

中間体化合物 (M6-41)



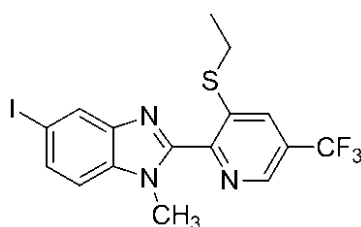
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.92 (1 H, d), 8.23 (1 H, d), 8.17 (1 H, d), 7.66 (1 H, dd), 7.23 (1 H, d), 3.85 (3 H, s).

【0371】

製造例 36 (2)

2-(3-フルオロピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4,5-b] ピリジンに代えて、中間体化合物 (M6-41) を用い、製造例 1 (2) に記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 45 と記す。) を得た。

本発明化合物 45

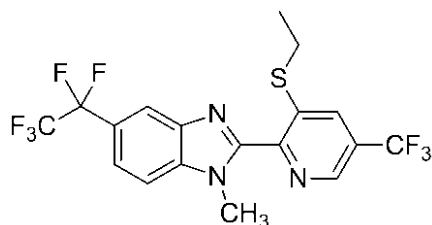


【0372】

製造例 36 (3)

2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾールに代えて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-5-ヨード-1-メチル-1H-ベンズイミダゾールを用い、製造例 25 記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 38 と記す。) を得た。

本発明化合物 38



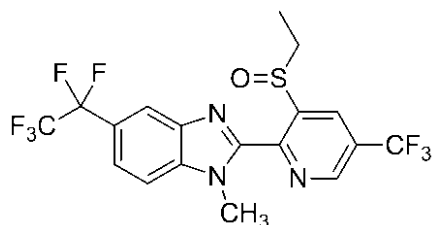
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.72 (1H, d), 8.20 (1H, s), 7.91 (1H, d), 7.60 (1H, d), 7.55 (1H, d), 4.00 (3H, s), 3.01 (2H, q), 1.39 (3H, t).

【0373】

製造例 37、38

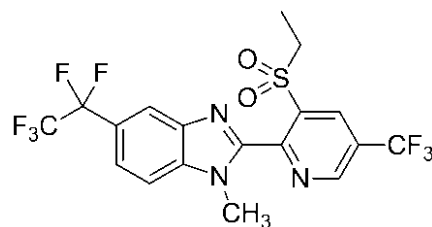
2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジンに代えて、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾールを用い、製造例 2, 3 記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルフィニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 39 と記す。) 及び 2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチル-ピリジン-2-イル)-1-メチル-5-ペンタフルオロエチル-1H-ベンズイミダゾール (以下、本発明化合物 40 と記す。) を得た。

本発明化合物 39



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.05 (1H, d), 8.91 (1H, d), 8.10 (1H, s), 7.66-7.60 (2H, m), 4.33 (3H, s), 3.80-3.69 (1H, m), 3.17-3.07 (1H, m), 1.50 (3H, t).

本発明化合物 40



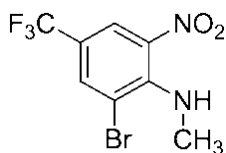
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.22 (1H, d), 8.77 (1H, d), 8.08 (1H, s), 7.63 (1H, d), 7.58 (1H, d), 3.99 (2H, q), 3.84 (3H, s), 1.40 (3H, t).

【0374】

製造例 39 (1)

メチル-(2-ニトロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-アミン 16 g、アセトニトリル 200 mL の混合物に、氷冷下 N-ブロモスクシンイミド 15 g を加えた。この反応混合物を室温下 5 時間攪拌した。得られた反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、(2-ブロモ-6-ニトロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-メチル-アミン 15 g を得た。

(2-ブロモ-6-ニトロ-4-トリフルオロメチル-フェニル)-メチル-アミン



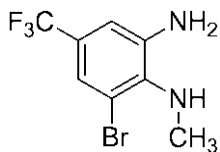
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.12 (1H, s), 7.86 (1H, s), 6.48 (1H, brs), 3.07 (3H, d).

【0375】

製造例 39 (2)

鉄粉 11 g、酢酸 12 mL、THF 40 mL、水 10 mL の混合物に、70℃で加熱攪拌下（2-ブロモ-6-ニトロ-4-トリフルオロメチルフェニル）-メチルアミン 10 g と THF 50 mL の混合物を滴下した。滴下後 70℃で 3 時間加熱攪拌した。得られた反応混合物をセライト濾過し、THF で洗浄した。得られたろ液を減圧下濃縮した。得られた残渣に 10% 水酸化ナトリウム水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮し、3-ブロモ-N²-メチル-5-トリフルオロメチルベンゼン-1, 2-ジアミン 11 g を得た。

3-ブロモ-N²-メチル-5-トリフルオロメチルベンゼン-1, 2-ジアミン

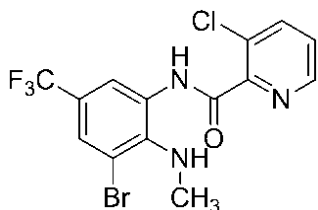


【0376】

製造例 39 (3)

5-ヨード-N²-メチルピリジン-2, 3-ジアミンに代えて、3-ブロモ-N²-メチル-5-トリフルオロメチルベンゼン-1, 2-ジアミンを用い、製造例 9 (1) に記載の方法に準じて、3-クロロピリジン-2-カルボン酸（3-ブロモ-2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルフェニル）-アミド（以下、中間体化合物 (M20-43) と記す。）を得た。

中間体化合物 (M20-43)



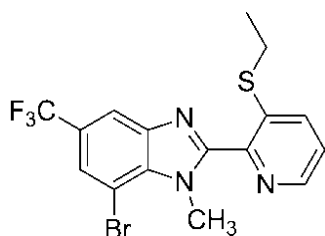
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.63 (1H, s), 8.77 (1H, d), 8.58 (1H, dd), 7.91 (1H, dd), 7.56 (1H, d), 7.47 (1H, dd), 3.75-3.68 (1H, m), 2.83 (3H, d).

【0377】

製造例 39 (4)

中間体化合物 (M20-29) に代えて、中間体化合物 (M20-43) を用い、製造例 28 (2) に記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-7-ブロモ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール（以下、本発明化合物 75 と記す。）、3-エチルスルファニルピリジン-2-カルボン酸（3-ブロモ-2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルフェニル）-アミド（以下、中間体化合物 (M3-42) と記す。）及び 2-(3-クロロピリジン-2-イル)-7-ブロモ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール（以下、中間体化合物 (M6-43) と記す。）を得た。

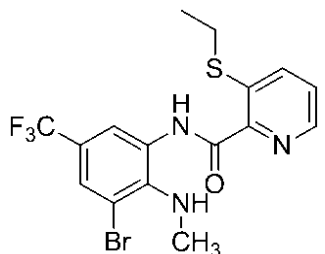
本発明化合物 75



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.54 (1H, dd), 8.08 (1H, d), 7.79 (1H, dd), 7.72 (1H, d), 7.40 (1H, dd), 4.13 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.32 (3H, t).

10

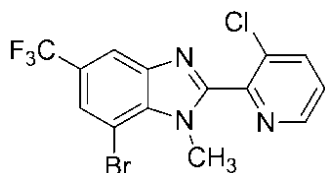
中間体化合物 (M3-42)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.80 (1H, s), 8.82 (1H, s), 8.38 (1H, dd), 7.74 (1H, d), 7.54 (1H, s), 7.42 (1H, dd), 3.75-3.65 (1H, br m), 2.97 (2H, q), 2.82 (3H, d), 1.45 (3H, t).

20

中間体化合物 (M6-43)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.71 (1H, dd), 8.08 (1H, d), 7.95 (1H, dd), 7.74 (1H, d), 7.47 (1H, dd), 4.09 (3H, s).

30

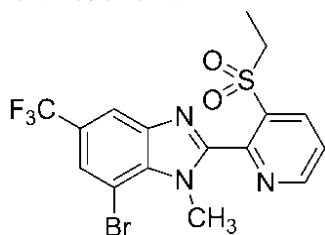
【0378】

製造例 40

2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンに代えて2-(3-エチルスルファニル-ピリジン-2-イル)-7-ブロモ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾールを用い、製造例5記載の方法に準じて、2-(3-エチルスルホニル-ピリジン-2-イル)-7-ブロモ-1-メチル-5-トリフルオロメチル-1H-ベンズイミダゾール(以下、本発明化合物46と記す。)を得た。

本発明化合物 46

40



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.99 (1H, dd), 8.51 (1H, dd), 8.00 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 4.03 (3H, s), 3.73 (2H, q), 1.33 (3H, t).

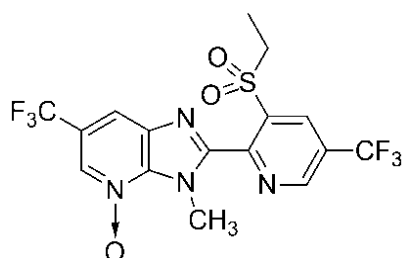
50

【0379】

製造例 41、42

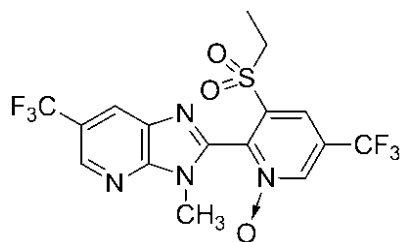
2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 1.0 g、m-クロロ過安息香酸（純度 65%以上）2.72 g 及びクロロホルム 5 ml の混合物を 8 時間還流し、m-クロロ過安息香酸（純度 65%以上）2.0 g を添加した後、さらに 5 時間還流した。放冷した反応混合物に 10% チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧下濃縮し、2-(3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン 4-オキシド（以下、本発明化合物 47 と記す。）362 mg、及び 2-(3-エチルスルホニル-1-オキシ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 51 と記す。）45 mg を得た。

本発明化合物 47



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.27 (1H, d), 8.76 (1H, d), 8.49 (1H, d), 7.94 (1H, d), 4.33 (3H, s), 3.80 (2H, q), 1.40 (3H, t).

本発明化合物 51



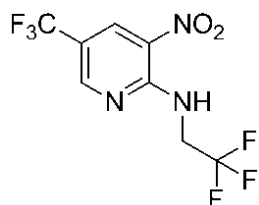
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75 (1H, s), 8.50 (1H, s), 8.12 (1H, s), 7.94 (1H, s), 4.28 (3H, s), 3.75-3.65 (1H, m), 3.55-3.44 (1H, m), 1.38 (3H, t).

【0380】

製造例 43 (1)

2-クロロ-3-ニトロ-5-トリフルオロメチルピリジン 2.60 g、2,2,2-トリフルオロエチルアミン 0.79 g、N,N-ジイソプロピルエチルアミン 1.04 g および N-メチル-2-ピロリドン 5 ml の混合物を、室温で 10 時間攪拌した。反応混合物に 10% クエン酸水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、(3-ニトロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミン 1.83 g を得た。

(3-ニトロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミン



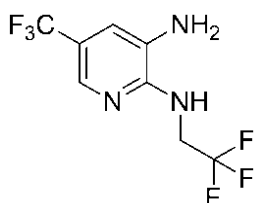
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.72 (1H, d), 8.68 (1H, d), 8.59 (1H, brs), 4.54–4.41 (2H, m).

【0381】

製造例43(2)

鉄粉2.12g、エタノール6ml、水4mlおよび酢酸0.1mlの混合物に、(3-ニトロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミン1.83gおよびエタノール10mlの混合物を70℃で滴下した後、70℃で1時間攪拌した。放冷した反応混合物をろ過した後、濾液に酢酸エチルおよび水を加えて抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、 N^2 -(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン1.59gを得た。

N^2 -(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン



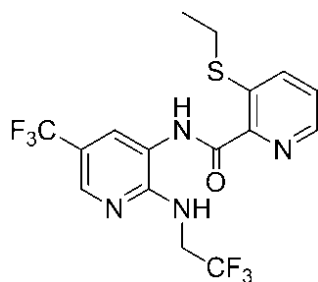
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.04–8.02 (1H, m), 7.10–7.07 (1H, m), 4.81 (1H, brs), 4.31–4.20 (2H, m), 3.34 (2H, brs).

【0382】

製造例43(3)

N^2 -(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン0.52g、3-エチルスルファニルピリジン-2-カルボン酸0.37g、WSC0.46g、HOBt27mg及びピリジン2mlの混合物を、室温で3時間攪拌した。反応混合物に10%クエン酸水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3-エチルスルファニルピリジン-2-カルボン酸[2-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル]アミド(以下、中間体化合物(M3-43)と記す。)0.75gを得た。

中間体化合物(M3-43)



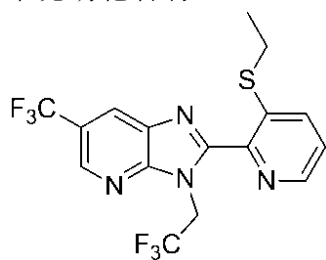
【0383】

製造例43(4)

中間体化合物(M3-43)0.75g及び酢酸5mlの混合物を、加熱還流下、2日間

攪拌した。室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニルピリジン-2-イル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物65と記す。)0.53gを得た。

本発明化合物65



10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.77-8.74 (1H, m), 8.48 (1H, dd), 8.45-8.42 (1H, m), 7.82 (1H, dd), 7.40 (1H, dd), 5.64 (2H, q), 2.99 (2H, q), 1.35 (3H, t).

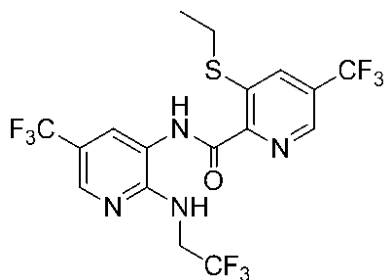
【0384】

製造例44(1)

N^2 -(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-トリフルオロメチルピリジン-2,3-ジアミン0.52g、3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸0.50g、WSC0.46g、HOBt 27mg及びピリジン2mlの混合物を、室温で3時間攪拌した。反応混合物に10%クエン酸水溶液を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮し、3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-カルボン酸[2-(2,2,2-トリフルオロエチル)アミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル]アミド(以下、中間体化合物(M3-44)と記す。)0.89gを得た。

20

中間体化合物(M3-44)



30

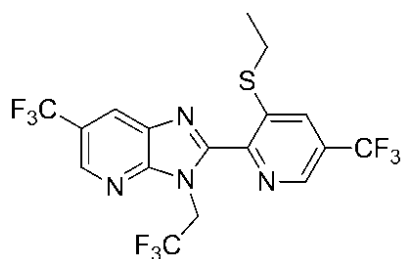
【0385】

製造例44(2)

中間体化合物(M3-44)0.89g、p-トルエンスルホン酸・一水和物1.14g、N-メチル-2-ピロリドン10mlおよびキシレン10mlの混合物を、ディーン・スターク装置を用いて脱水しながら8時間加熱還流した。反応混合物を放冷した後、反応混合物に水を注加し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-(3-エチルスルファニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-3-(2,2,2-トリフルオロエチル)-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン(以下、本発明化合物66と記す。)0.76gを得た。

40

本発明化合物66



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.80 (1H, d), 8.70 (1H, d), 8.48 (1H, d), 7.96 (1H, d), 5.67 (2H, q), 3.04 (2H, q), 1.40 (3H, t).

10

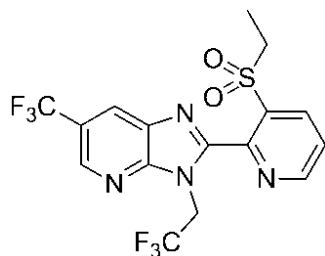
【0386】

製造例 4 5

本発明化合物 6 5 を 0.32 g 及びクロロホルム 2 ml の混合物に、氷冷下、*m*-クロロ過安息香酸（純度 65% 以上）0.36 g を添加した後、室温まで昇温し、1 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-（3-エチルスルホニルピリジン-2-イル）-3-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 6 7 と記す。）0.32 g を得た。

20

本発明化合物 6 7



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.98 (1H, dd), 8.80 (1H, d), 8.59 (1H, dd), 8.37 (1H, d), 7.75 (1H, dd), 5.31 (2H, q), 3.95 (2H, q), 1.40 (3H, t).

30

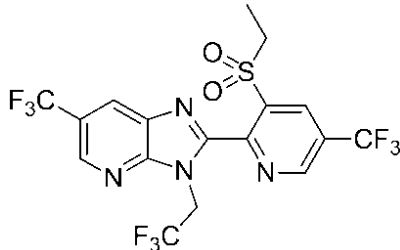
【0387】

製造例 4 6

本発明化合物 6 6 を 0.32 g 及びクロロホルム 2 ml の混合物に、氷冷下、*m*-クロロ過安息香酸（純度 65% 以上）0.31 g を添加した後、室温まで昇温し、1 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を水洗し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下濃縮した。得られた粗生成物をヘキサンで洗浄し、2-（3-エチルスルホニル-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル）-3-（2, 2, 2-トリフルオロエチル）-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 6 8 と記す。）0.28 g を得た。

40

本発明化合物 6 8



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.22 (1H, d), 8.83-8.83 (2H, m)

50

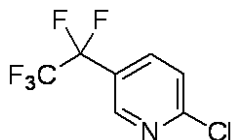
, 8.40 (1H, d), 5.36 (2H, q), 4.05 (2H, q), 1.45 (3H, t).

【0388】

製造例47(1)

2-クロロ-5-ヨードピリジン20.0g、ペンタフルオロプロピオン酸ナトリウム77.8g、ヨウ化銅(I)31.8g、キシレン84ml及びN-メチルピロリドン84mlの混合物を160℃まで昇温し、加熱還流下、6時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、水を注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮し、2-クロロ-5-ペンタフルオロエチルピリジンを得た。

2-クロロ-5-ペンタフルオロエチルピリジン



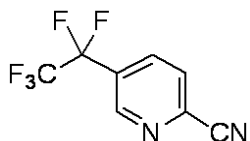
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.65–8.62 (1H, m), 7.85–7.81 (1H, m), 7.48–7.44 (1H, m)

【0389】

製造例47(2)

製造例47(1)で得られた2-クロロ-5-ペンタフルオロエチルピリジンの半量、シアン化亜鉛(II)14.4g、テトラキストリフェニルフォスフィンパラジウム2.42g及びN-メチルピロリドン84mlの混合物を80℃まで昇温し、2.5時間加熱攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、水及びメチル-tert-ブチルエーテルを注加し、沈殿物をセライト(登録商標)でろ過し、残渣をメチル-tert-ブチルエーテルで洗浄した。ろ液をメチル-tert-ブチルエーテルで抽出し、有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-シアノ-5-ペンタフルオロエチルピリジン4.19gを得た。

2-シアノ-5-ペンタフルオロエチルピリジン



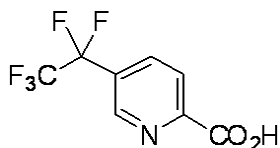
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.97–8.96 (1H, m), 8.12–8.09 (1H, m), 7.90–7.87 (1H, m)

【0390】

製造例47(3)

水17mlと濃硫酸17mlの混合物を100℃まで昇温し、加熱下、2-シアノ-5-ペンタフルオロエチルピリジン3.81gを滴下した後、100℃で2.5時間攪拌した。室温まで冷却した後、反応混合物を氷水に注加した。析出した固体をろ過した後、水で洗浄した。得られた個体を減圧下乾燥し、5-ペンタフルオロピリジン-2-カルボン酸3.52gを得た。

5-ペンタフルオロピリジン-2-カルボン酸



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.92–8.88 (1H, m), 8.44–8.39 (1H, m), 8.25–8.20 (1H, m)

【0391】

製造例47(4)

10

20

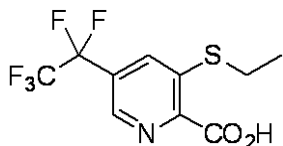
30

40

50

テトラメチルピペリジン 5. 5 ml 及び THF 58 ml の混合物を -78°C まで冷却した後、1. 6 M n-ブチルリチウムヘキサン溶液を滴下し、室温まで昇温した後、10 分間攪拌した。再び -78°C まで冷却し、5-ペンタフルオロピリジン-2-カルボン酸 3. 52 g の THF 溶液を滴下し、 -78°C で 1 時間攪拌した。 -78°C でジエチルジスルフィド 4. 0 ml を滴下した後、室温まで昇温し、1 時間攪拌した。反応混合物に 1 N 塩酸を注加した後、5 N 水酸化ナトリウム水溶液を注加し、水層をメチル-tert-ブチルエーテルで洗浄した。水層に 12 N 塩酸を注加し、析出した固体をろ過した後、メチル-tert-ブチルエーテルに溶解させた。硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮し、3-エチルスルファニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-カルボン酸（以下、中間体化合物（M2-7）と記す）1. 99 g を得た。

中間体化合物（M2-7）



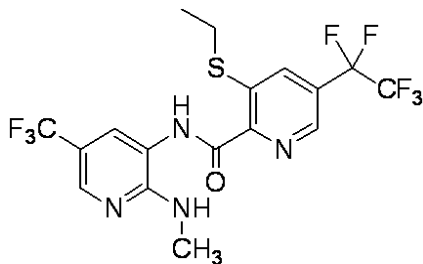
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.51–8.50 (1H, m), 7.89–7.87 (1H, m), 3.01 (2H, q), 1.46 (3H, t)

【0392】

製造例 47 (5)

N^2 -メチル-5-トリフルオロメチルピリジン-2, 3-ジアミン 0. 50 g、中間体化合物（M2-7）0. 79 g、WSC 0. 37 g、HOBt 35 mg 及びピリジン 5 ml の混合物を、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮し、3-エチルスルファニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-カルボン酸（2-メチルアミノ-5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル）アミド（以下、中間体化合物（M3-45）と記す。）を得た。

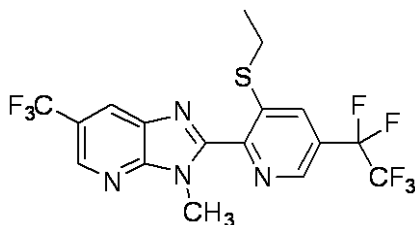
中間体化合物（M3-45）



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.57 (1H, brs), 8.54–8.52 (1H, m), 8.37–8.35 (1H, m), 7.94–7.92 (1H, m), 7.89–7.87 (1H, m), 4.97 (1H, brs), 3.08 (3H, d), 2.99 (2H, q), 1.45 (3H, t)

得られた中間体化合物（M3-45）の全量及び酢酸 5 ml の混合物を 120°C まで昇温し、加熱還流下、3 時間攪拌した。室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-（3-エチルスルファニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-イル）-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン（以下、本発明化合物 71 と記す。）0. 77 g を得た。

本発明化合物 71



10

20

30

40

50

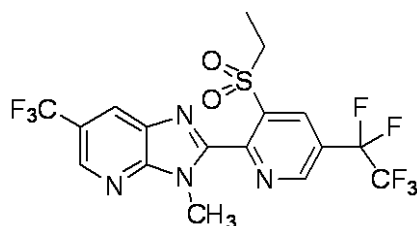
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.78–8.76 (1H, m), 8.71–8.69 (1H, m), 8.44–8.42 (1H, m), 7.91–7.89 (1H, m), 4.13 (3H, s), 3.02 (2H, q), 1.39 (3H, t)

【0393】

製造例 48

本発明化合物 71 を 0.47 g 及びクロロホルム 10 ml の混合物に、氷冷下 m -クロロ過安息香酸（純度 65% 以上）0.57 g を添加した後、室温まで昇温し、1 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-（3-エチルスルホニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-イル）-3-メチル-6-トリフルオロメチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 72 と記す。）0.39 g を得た。

本発明化合物 72



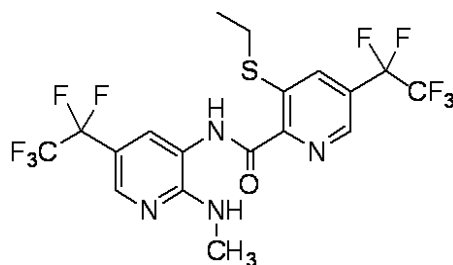
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.21–9.19 (1H, m), 8.81–8.79 (1H, m), 8.76–8.75 (1H, m), 8.35–8.33 (1H, m), 3.99–3.93 (5H, m), 1.41 (3H, t)

【0394】

製造例 49

N^2 -メチル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2, 3-ジアミン 0.50 g、中間体化合物 (M2-7) 0.62 g、WSC 0.29 g、HOBt 28 mg 及びピリジン 4 ml の混合物を、室温で 3 時間攪拌した。反応混合物に水を注加し、メチル-tert-ブチルエーテルで抽出した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させた後、減圧下濃縮し、3-エチルスルファニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-カルボン酸（2-メチルアミノ-5-ペンタフルオロエチルピリジン-3-イル）アミド（以下、中間体化合物 (M3-46) と記す。）を得た。

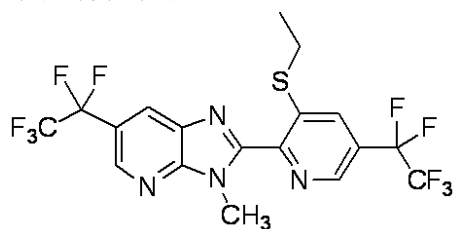
中間体化合物 (M3-46)



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.59 (1H, brs), 8.54–8.52 (1H, m), 8.32–8.30 (1H, m), 7.89–7.87 (1H, m), 7.85–7.83 (1H, m), 5.04 (1H, brs), 3.09 (3H, d), 2.99 (2H, q), 1.45 (3H, t)

得られた中間体化合物 (M3-46) の全量及び酢酸 4 ml の混合物を 120 °C まで昇温し、加熱還流下、3 時間攪拌した。室温まで冷却した後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-（3-エチルスルファニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-イル）-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン（以下、本発明化合物 73 と記す。）0.84 g を得た。

本発明化合物 7 3



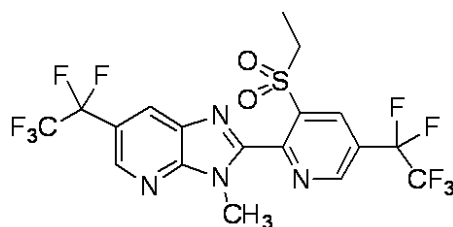
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.72–8.69 (2H, m), 8.42–8.41 (1H, m), 7.90–7.89 (1H, m), 4.15–4.12 (3H, m), 3.02 (2H, q), 1.40 (3H, t)

【0395】

製造例 5 0

本発明化合物 7 3 を 0.54 g 及びクロロホルム 11 ml の混合物に、氷冷下 m -クロロ過安息香酸（純度 65% 以上）0.59 g を添加した後、室温まで昇温し、1 時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液を注加し、クロロホルムで抽出した。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させた後、減圧下濃縮した。粗生成物をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、2-（3-エチルスルホニル-5-ペンタフルオロエチルピリジン-2-イル）-3-メチル-6-ペンタフルオロエチル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン（以下、本発明化合物 7 4 と記す。）0.34 g を得た。

本発明化合物 7 4



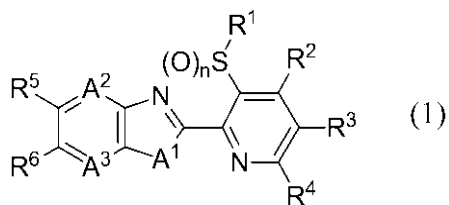
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.21–9.20 (1H, m), 8.77–8.74 (2H, m), 8.32–8.31 (1H, m), 4.00–3.94 (5H, m), 1.41 (3H, t)

【0396】

前記の製造例に記載の化合物及び前記の製造例に記載の方法に準じた製造方法により製造される化合物を表に示す。

【0397】

式 (1) で表される化合物。



式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び n は、下記の〔表 3 6〕～〔表 5 8〕に記載の組み合わせを表す。

【0398】

10

20

30

40

【表 3 6】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
1	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
2	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
3	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
4	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
5	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
6	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
7	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
8	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
9	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	N	0
10	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	N	0
11	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	N	2
12	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N	2
13	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	0
14	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	1
15	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
16	Et	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
17	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
18	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
19	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
20	Et	H	H	H	SOCF ₃	H	NMe	CH	N	2
21	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	CH	0
22*	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N	2
23	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	0
24	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	2
25	Et	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2

10

20

30

【 0 3 9 9 】

【表 3 7】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
26	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
27	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
28	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	0
29	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	1
30	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
31	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
32	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
33	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
34	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
35	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
36*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
37*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
38	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
39	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
40	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
41	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N	0
42	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N	0
43	Et	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	CH	N	0
44	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
45	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	CH	0
46	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr	2
47*	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
48*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
49	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	CH	0
50	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	CH	2

10

20

30

【 0 4 0 0 】

【表 3 8】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
51*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
52	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	CH	0
53	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	CH	2
54	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	CH	0
55	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	CH	2
56	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	CH	CH	2
57	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
58	Et	H	H	H	C(OH) ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
59	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	CH	N	0
60	Et	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
61	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	CH	0
62	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	CH	1
63	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	CH	2
64	Et	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
65	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	CH	N	0
66	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	CH	N	0
67	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	CH	N	2
68	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CF ₃	CH	N	2
69	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	CH	N	2
70*	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ Me	H	NMe	CH	N	2
71	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
72	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
73	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
74	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
75	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr	0

10

20

30

【 0 4 0 1 】

【表 3 9】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
76	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	N	0
77	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	N	2
78	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	CH	N	0
79	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	CH	N	2
80	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	N	0
81	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	N	2
82	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	N	0
83	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	N	2
84	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	CH	0
85	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	CH	2
86	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	CH	0
87	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	O	CH	CH	2
88	Et	H	H	H	CF ₃	Cl	NMe	CH	N	2
89	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	NMe	CH	N	2
90	Et	H	H	H	CF ₃	SEt	NMe	CH	N	2
91	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	SEt	NMe	CH	N	2
92	Et	H	H	H	CF ₃	OH	NMe	CH	N	2
93	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OH	NMe	CH	N	2
94	Et	H	H	H	CF ₃	OMe	NMe	CH	N	2
95	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	OMe	NMe	CH	N	2
96	Et	H	H	H	CF ₃	SMe	NMe	CH	N	2
97	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	SMe	NMe	CH	N	2
98	Et	H	H	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	CH	N	2
99	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	NMe ₂	NMe	CH	N	2
100	Et	H	H	H	CF ₃	Ph	NMe	CH	N	2

10

20

30

【 0 4 0 2 】

【表 4 0】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
101	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	Ph	NMe	CH	N	2
102	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
103	CH ₂ CycPr	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
104	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
105	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
106	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
107	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
108	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
109	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
110	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
111	Et	H	2-pyridyl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
112	Et	H	2-pyrimidinyl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
113	Et	H	3-chloro-2-pyridyl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
114	Et	H	3-chloro-5-trifluoromethyl-2-pyridyl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
115	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
116	Et	H	SCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
117	Et	H	SOCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
118	Et	H	SO ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
119	Et	H	CF(CF ₃) ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
120	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
121	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
122	Et	H	I	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
123	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
124	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
125	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	2

10

20

30

【 0 4 0 3 】

【表 4 1】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
126	Et	H	CF ₃	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	2
127	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	N	2
128	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
129	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
130	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
131	Et	H	CF ₃	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
132	Et	H	H	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
133	Et	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
134	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	CH	N	2
135	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	CH	N	2
136	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ C≡CH	CH	N	2
137	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ C≡CH	CH	N	2
138	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCN	2
139	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCN	2
140	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CF	2
141	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CF	2
142	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	cMe	2
143	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	cMe	2
144	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	COMe	2
145	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	COMe	2
146	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSCH ₂ CH ₃	2
147	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSCH ₂ CH ₃	2
148	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSO ₂ CH ₂ CH ₃	2
149	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSO ₂ CH ₂ CH ₃	2
150	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0

【 0 4 0 4 】

10

20

30

40

【表 4 2】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
151	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
152	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
153	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
154	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
155	Pr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
156	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
157	CH ₂ CH=CH ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
158	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
159	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
160	iPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
161	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
162	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
163	tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
164	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
165	CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
166	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	CH	N	0
167	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	CH	N	1
168	Et	H	H	H	CF ₃	H	NEt	CH	N	2
169	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	CH	N	0
170	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	CH	N	1
171	Et	H	H	H	CF ₃	H	NPr	CH	N	2
172	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	CH	N	0
173	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	CH	N	1
174	Et	H	H	H	CF ₃	H	NiPr	CH	N	2
175	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 0 5 】

【表 4 3】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
176	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	CH	N	1
177	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCycPr	CH	N	2
178	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	N	0
179	Et	H	H	H	H	CF ₃	NCH ₂ OEt	N	CH	0
180	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	N	1
181	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	N	2
182	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OMe	CH	N	0
183	Et	H	H	H	Me	H	NMe	CH	N	0
184	Et	H	H	H	Me	H	NMe	CH	N	1
185	Et	H	H	H	Me	H	NMe	CH	N	2
186	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CH	N	0
187	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CH	N	1
188	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CH	N	2
189	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	N	1
190	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	N	2
191	Et	H	H	H	CN	H	NMe	CH	N	0
192	Et	H	H	H	CN	H	NMe	CH	N	1
193	Et	H	H	H	CN	H	NMe	CH	N	2
194	Et	H	H	H	CHO	H	NMe	CH	N	0
195	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	CH	N	0
196	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	CH	N	1
197	Et	H	H	H	CF ₂ H	H	NMe	CH	N	2
198	Et	H	H	H	Ph	H	NMe	CH	N	0
199	Et	H	H	H	Ph	H	NMe	CH	N	2
200	Et	H	H	H	2-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 0 6 】

【表 4 4】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
201	Et	H	H	H	2-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	1
202	Et	H	H	H	2-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	2
203	Et	H	H	H	3-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
204	Et	H	H	H	3-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	1
205	Et	H	H	H	3-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	2
206	Et	H	H	H	4-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
207	Et	H	H	H	4-fluoro-phenyl	H	NMe	CH	N	2
208	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	N	CH	0
209	Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
210	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCl	0
211	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCl	1
212	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCl	2
213	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr	1
214	Me	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	CH	0
215	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	CH	1
216	Et	H	H	H	CF ₃	H	O	CH	N	1
217	Me	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	CH	0
218	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	CH	1
219	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
220	Et	Cl	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
221	Et	H	H	H	COCF ₃	H	NMe	CH	N	0
222	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	CH	N	0
223	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	CH	N	1
224	Et	H	H	H	Cl	H	NMe	CH	N	2
225	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CCHO	N	0

10

20

30

【 0 4 0 7 】

【表 4 5】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
226	Et	H	H	SEt	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
227	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	CH	0
228	Et	H	H	H	H	CF ₃	NCH ₂ OEt	N	CH	0
229	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	CH	N	0
230	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Et	CH	N	0
231	Et	H	H	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₂ OMe	CH	N	0
232	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCH ₂ SMe	CH	N	0
233	Et	H	H	H	CF ₃	H	N(CH ₂) ₂ SMe	CH	N	0
234	Et	H	H	H	CF ₃	H	NBu	CH	N	0
235	Et	H	H	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	CH	N	0
236	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	CH	N	0
237	Et	H	H	H	CHFCF ₃	H	NMe	CH	N	0
238	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
239	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
240	Et	H	F	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
241	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
242	Et	OMe	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
243	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
244	Et	H	OMe	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
245	Et	H	OH	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
246	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	CH	N	0
247	Et	H	H	H	CHFCF ₃	H	NMe	CH	N	1
248	Et	H	H	H	CHFCF ₃	H	NMe	CH	N	2
249	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
250	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1

10

20

30

【 0 4 0 8 】

【表 4 6】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
251	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
252	Et	Cl	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
253	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
254	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
255	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
256	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
257	Et	H	H	Cl	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
258	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
259	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
260	Et	H	H	OMe	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
261	Et	H	H	H	SH	H	NMe	CH	N	0
262	Et	H	H	H	Et	H	NMe	CH	N	0
263	Et	H	H	H	iPr	H	NMe	CH	N	0
264	Et	H	H	H	NHEt	H	NMe	CH	N	0
265	Et	H	H	H	NEt ₂	H	NMe	CH	N	0
266	Et	H	H	H	tBu	H	NMe	CH	N	0
267	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	N	0
268	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
269	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
270	Et	F	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
271	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	N	1
272	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CH	N	2
273	Et	H	H	H	NMe ₂	H	NMe	CH	N	0
274	Et	H	H	H	pyrrolidin-1-yl	H	NMe	CH	N	0
275	Et	H	H	H	NHCOMe	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 0 9 】

【表 4 7】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
276	Et	H	H	H	CH ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
277	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	CH	0
278	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	CH	1
279	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	N	CH	2
280	Et	H	H	H	NMeCOMe	H	NMe	CH	N	0
281	Et	H	H	H	NH ₂	H	NMe	CH	N	1
282	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
283	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	CH	N	0
284	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	CH	N	1
285	Et	H	H	H	NHCOCF ₃	H	NMe	CH	N	2
286	Et	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	0
287	Et	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	0
288	Et	H	H	H	4-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	0
289	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N	1
290	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
291	CH ₂ CF ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
292	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
293	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
294	Et	Me	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
295	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
296	Et	H	Me	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
297	Et	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	1
298	Et	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	2
299	Et	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	1
300	Et	H	H	H	3-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	2

10

20

30

【 0 4 1 0 】

【表 4 8】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
301	Et	H	H	H	4-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	1
302	Et	H	H	H	4-CF ₃ -Ph	H	NMe	CH	N	2
303	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
304	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
305	Et	H	H	CF ₃	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
306	Et	H	H	H	2-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
307	Et	H	H	H	3-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
308	Et	H	H	H	4-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
309	Et	H	H	H	6-chloro-3-pyridyl	H	NMe	CH	N	0
310	Et	H	H	H	5-fluoro-3-pyridyl	H	NMe	CH	N	0
311	Et	H	H	H	3-pyridyl	H	NMe	CH	N	0
312	Et	H	H	H	4-pyridyl	H	NMe	CH	N	0
313	Et	H	H	H	4-chloro-1-pyrazolyl	H	NMe	CH	N	0
314	Et	H	H	H	2-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	1
315	Et	H	H	H	2-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	2
316	Et	H	H	H	3-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	1
317	Et	H	H	H	3-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	2
318	Et	H	H	H	4-chloro-phenyl	H	NMe	CH	N	2
319	Et	H	H	H	4-pyridyl	H	NMe	CH	N	1
320	Et	H	H	H	4-pyridyl	H	NMe	CH	N	2
321	Et	H	H	H	6-chloro-3-pyridyl	H	NMe	CH	N	2
322	Et	H	H	H	5-fluoro-3-pyridyl	H	NMe	CH	N	1
323	Et	H	H	H	5-fluoro-3-pyridyl	H	NMe	CH	N	2
324	Et	H	H	H	4-chloro-1-pyrazolyl	H	NMe	CH	N	2
325	Et	H	H	H	3-chloro-1-triazolyl	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 1 1 】

【表 4 9】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
326	Et	H	H	H	4-CF ₃ -imidazole	H	NMe	CH	N	0
327	Et	H	H	H	2-nitro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
328	Et	H	H	H	3-nitro-phenyl	H	NMe	CH	N	0
329	Et	H	H	H	2-cyano-phenyl	H	NMe	CH	N	0
330	Et	H	H	H	3-cyano-phenyl	H	NMe	CH	N	0
331	Et	H	H	H	4-cyano-phenyl	H	NMe	CH	N	0
332	Et	H	H	H	3-CF ₃ -triazolyl	H	NMe	CH	N	0
333	Et	H	H	H	3-CF ₃ -5-Me-triazolyl	H	NMe	CH	N	0
334	Et	H	H	H	3-chloro-1-triazolyl	H	NMe	CH	N	2
335	Et	H	H	H	4-CF ₃ -imidazolyl	H	NMe	CH	N	1
336	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
337	Et	H	Br	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
338	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
339	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
340	Et	H	CN	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
341	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
342	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
343	Et	H	Ph	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
344	Et	H	H	H	SMe	H	NMe	CH	N	0
345	Et	H	H	H	SO ₂ Me	H	NMe	CH	N	2
346	Et	H	H	H	SEt	H	NMe	CH	N	0
347	Et	H	H	H	SO ₂ Et	H	NMe	CH	N	2
348	Et	H	H	H	SiPr	H	NMe	CH	N	0
349	Et	H	H	H	SO ₂ iPr	H	NMe	CH	N	2
350	Et	H	H	H	SCH ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 1 2 】

【表 5 0】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
351	Et	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
352	Et	H	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂	H	NMe	CH	N	0
353	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
354	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
355	Et	H	H	H	SCF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	0
356	Et	H	H	H	CH(OH)CF ₃	H	NMe	CH	N	0
357	Et	H	H	H	CH(Cl)CF ₃	H	NMe	CH	N	0
358	Et	H	H	H	OH	H	NMe	CH	N	0
359	Et	H	H	H	OH	H	NMe	CH	N	2
360	Et	H	H	H	OCF ₂ Br	H	NMe	CH	N	2
361	Et	H	H	H	OCF ₃	H	NMe	CH	N	2
362	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
363	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
364	Et	H	H	H	SCF ₂ CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
365	Et	H	H	H	StBu	H	NMe	CH	N	0
366	Et	H	H	H	SO ₂ tBu	H	NMe	CH	N	2
367	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	CH	N	0
368	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	CH	N	1
369	Et	H	CF ₃	H	Br	H	NMe	CH	N	2
370	Et	H	H	H	SCH=C=CH ₂	H	NMe	CH	N	0
371	Et	H	H	H	SO ₂ CH=C=CH ₂	H	NMe	CH	N	2
372	Et	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe	CH	N	2
373	Et	H	I	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
374	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
375	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1

10

20

30

【 0 4 1 3 】

【表 5 1】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
376	Et	H	NO ₂	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
377	Et	H	I	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
378	Et	H	I	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
379	Et	H	Br	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
380	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	CH	N	0
381	Et	H	Cl	H	CF ₃	H	S	CH	N	2
382	Et	H	H	H	C(OH)(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	0
383	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	0
384	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	1
385	Et	H	H	H	C(Cl)(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	N	2
386	Et	H	Cl	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
387	Et	H	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	NMe	CH	CH	0
388	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NMe	CH	CH	0
389	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N	2
390	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
391	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	1
392	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	0
393	Et	H	CF ₃	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	1
394	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
395	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
396	Et	H	Me	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
397	Et	H	H	H	I	H	S	CH	N	0
398	Et	H	CF ₃	H	I	H	S	CH	N	0
399	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	CH	N	0
400	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 1 4 】

【表 5 2】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
401	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	S	CH	N	2
402	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	S	CH	N	2
403	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	CH	0
404	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	N	CH	2
405	Et	H	CH=C H ₂	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
406	Et	H	Et	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
407	Et	H	H	H	SO ₂ NMe ₂	H	NMe	CH	N	1
408	Et	H	H	H	SO ₂ NMe ₂	H	NMe	CH	N	2
409	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CNH ₂	0
410	Et	H	Br	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
411	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CNMe ₂	0
412	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CNH ₂	0
413	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CNMe ₂	0
414	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
415	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
416	Et	H	SF ₅	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
417	Et	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	H	NH	CH	CH	0
418	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CCF ₂ H	N	0
419	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CCF ₂ H	N	1
420	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CCF ₂ H	N	2
421	Et	H	H	H	Br	H	NMe	CiPr	N	0
422	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	N	1
423	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	CH	0
424	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NEt	CH	N	2
425	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CH= CH ₂	CH	N	2

10

20

30

【 0 4 1 5 】

【表 5 3】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
426	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CN	CH	N	2
427	Et	H	CF ₃	H	H	CF ₃	NCH ₂ CN	N	CH	2
428	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ OEt	CH	N	2
429	Et	H	CF ₃	H	H	CF ₃	NCH ₂ OEt	N	CH	2
430	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ SMe	CH	N	2
431	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NPr	CH	N	2
432	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NBu	CH	N	2
433	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CO ₂ Me	CH	N	2
434	Et	H	CF ₃	H	H	CF ₃	NCH ₂ CO ₂ Me	N	CH	2
435	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCH ₂ CH=CCl ₂	CH	N	2
436	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ tBu	CH	N	2
437	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCO ₂ Me	CH	N	2
438	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NCOMe	CH	N	2
439	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
440	Et	H	OCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
441	Et	H	CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
442	Et	H	NH ₂	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
443	Et	H	NHCOCF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
444	Et	H	iPr	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
445	Et	H	CHO	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
446	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
447	CH ₂ CO ₂ Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
448	CH ₂ CH=CC I ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
449	CH ₂ C≡CC H ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
450	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 1 6 】

【表 5 4】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
451	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
452	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
453	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
454	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
455	Et	H	CF ₂ H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
456	Et	H	CH ₂ OH	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
457	Bu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
458	CH ₂ CO ₂ Me	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
459	CH ₂ CH=CCl ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
460	CH ₂ C≡CCH ₃	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
461	CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
462	CH ₂ tBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
463	CH ₂ CH ₂ CN	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
464	CH ₂ CycBu	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
465	CF ₂ Br	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
466	Et	H	CH ₂ F	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
467	CH=CH ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
468	CH=CH ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
469	CH=CH ₂	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
470	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	CH	N	0
471	Et	H	H	H	H	CF ₃	S	CH	N	2
472	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
473	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
474	Et	H	OCF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
475	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CMe	0

10

20

30

【 0 4 1 7 】

【表 5 5】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
476	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CMe	1
477	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CF	0
478	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CF	1
479	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
480	CH ₂ CycPr	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
481	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr	0
482	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSCH ₂ C H ₃	0
483	CH ₂ C≡CH	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
484	CH ₂ C≡CH	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
485	Et	H	C≡CH	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
486	Et	H	4-trifluoro methyl-2-pyridyl	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
487	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	0
488	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	1
489	Et	H	OCF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
490	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr	1
491	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr	2
492	Et	H	H	H	2-pyridyl	H	NMe	CH	N	0
493	Et	H	H	H	2-pyridyl	H	NMe	CH	N	2
494	Et	H	H	H	2-furyl	H	NMe	CH	N	0
495	Et	H	H	H	2-furyl	H	NMe	CH	N	2
496	Et	H	H	H	2-thienyl	H	NMe	CH	N	0
497	Et	H	H	H	2-thienyl	H	NMe	CH	N	2
498	Et	H	H	H	CH=CH ₂	H	NMe	CH	N	0
499	Et	H	H	H	CH=CH ₂	H	NMe	CH	N	2
500	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 1 8 】

【表 5 6】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
501	Et	H	H	H	COMe	H	NMe	CH	N	2
502	Et	H	H	H	CH ₂ CH=CH ₂	H	NMe	CH	N	0
503	Et	H	H	H	CF ₃	H	N-(6-Chloro-pyridin-3-ylmethyl)	CH	N	2
504	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N-(6-Chloro-pyridin-3-ylmethyl)	CH	N	2
505	Et	H	H	H	CF ₃	H	N-(2-Chloro-thiazol-5-ylmethyl)	CH	N	2
506	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N-(2-Chloro-thiazol-5-ylmethyl)	CH	N	2
507	Et	H	H	H	CF ₃	CN	NMe	CH	N	2
508	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CN	NMe	CH	N	2
509	Et	H	H	H	CF ₃	H	N-(2-Chloro-thiazol-5-ylmethyl)	CH	N	0
510	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N-(2-Chloro-thiazol-5-ylmethyl)	CH	N	0
511*	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
512*	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
513	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	COMe	0
514	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSMe	0
515	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSO ₂ Me	2
516	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSPH	0
517	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSO ₂ Ph	2
518	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CSO ₂ CH ₂ CF ₃	2
519	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCN	0
520	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CNMe ₂	N	2
521	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CO ₂ H	NMe	CH	N	2
522	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	CONH ₂	NMe	CH	N	2
523*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
524*	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
525	Et	H	CF ₃	H	CO ₂ H	H	NMe	CH	N	0

【表 5 7】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
526	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCN	1
527	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	CCF ₃	0
528	Et	H	C(OMe) ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
529	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CCF ₃	CH	0
530	Et	H	H	H	H	CF ₃	NMe	CCF ₃	CH	2
531	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCF ₃	2
532	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
533	Me	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
534	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
535	Pr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
536	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
537	iPr	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
538	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
539	Bu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
540	CH(CH ₃)CH CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
541	CH(CH ₃)CH CH ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
542	CH ₂ CH(CH ₃)) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
543	CH ₂ CH(CH ₃)) ₂	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
544	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
545	tBu	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
546	CycPen	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
547	CycPen	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
548	CycHex	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
549	CycHex	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
550	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0

10

20

30

【0 4 2 0】

【表 5 8】

本発明 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
551	CH ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
552	Et	H	CF ₃	H	CN	H	NMe	CH	N	0
553	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCF ₃	0
554	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	N-(4-methox y-benzyl)	CH	N	0
555	Et	H	CF ₃	H	H	CF ₂ CF ₃	N-(4-methox y-benzyl)	N	CH	0

40

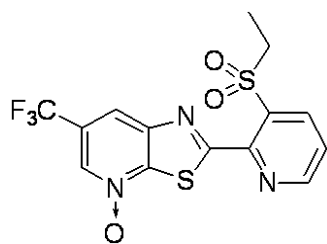
【0 4 2 1】

ここで上記の表〔表 3 6〕～〔表 5 8〕の本発明化合物における「*」の記載は、N-オ

50

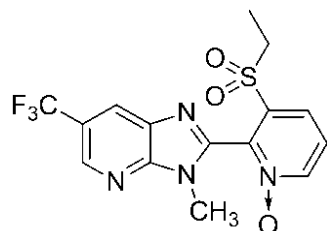
キシドであることを意味する。具体的には下記の化合物である。

本発明化合物 2 2

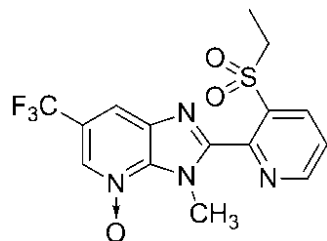


10

本発明化合物 3 6

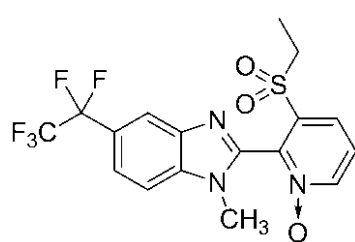


本発明化合物 3 7



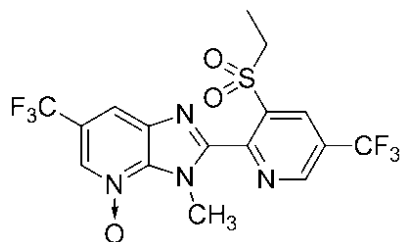
20

本発明化合物 4 7



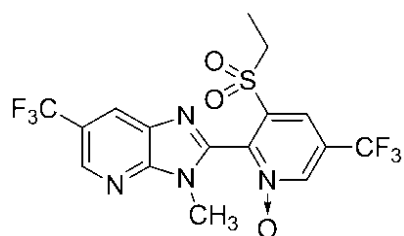
30

本発明化合物 4 8



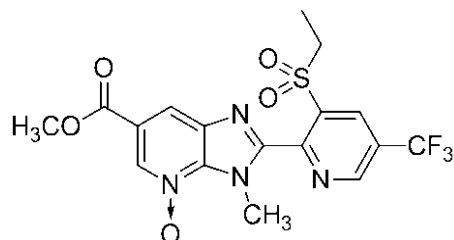
40

本発明化合物 5 1



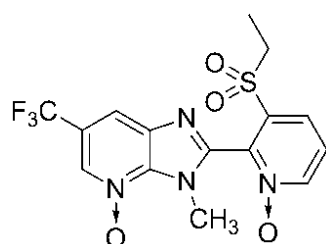
本発明化合物 7 0

10



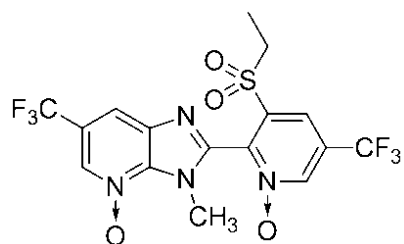
本発明化合物 5 1 1

20



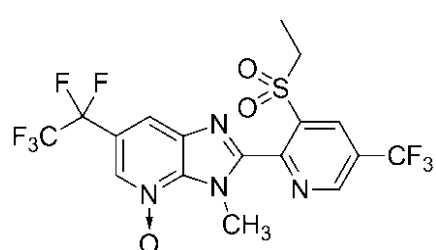
本発明化合物 5 1 2

30

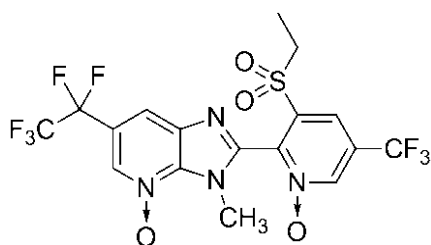


本発明化合物 5 2 3

40



本発明化合物 5 2 4



【0422】

(上記の〔表36〕～〔表58〕において、Meはメチル基を表し、Etはエチル基を表し、Prはプロピル基を表し、iPrはイソプロピル基を表し、Buはブチル基を表し、tBuはtert-ブチル基を表し、CycPrはシクロプロピル基を表し、CycBuはシクロブチル基を表し、CycPenはシクロペンチル基を表し、CycHexはシクロヘキシル基を表し、Phはフェニル基を表し、2-CF₃-Phは2-トリフルオロメチルフェニル基を表し、3-CF₃-Phは3-トリフルオロメチルフェニル基を表し、4-CF₃-Phは4-トリフルオロメチルフェニル基を表し、3-CF₃-triazolylは3-トリフルオロメチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル基を表し、3-CF₃-5-Me-triazolylは3-トリフルオロメチル-5-メチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル基を表し、4-CF₃-imidazolylは4-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル基を表す。)

【0423】

〔表36〕～〔表58〕に記載した本発明化合物の¹H-NMRデータを以下に示す。

本発明化合物47

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.53 (1H, dd), 8.07 (1H, s), 7.98 (1H, dd), 7.65 (1H, dd), 7.62-7.56 (2H, m), 3.90-3.77 (1H, m), 3.75 (3H, s), 3.52-3.42 (1H, m), 1.33 (3H, t).

本発明化合物49

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.61-7.00 (6H, m), 3.90 (3H, s), 2.94 (2H, q), 1.33 (3H, t).

本発明化合物50

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.93 (1H, dd), 8.49 (1H, dd), 7.68-7.62 (2H, m), 7.43 (1H, d), 7.25 (1H, d), 3.84 (2H, q), 3.73 (3H, s), 1.31 (3H, q).

本発明化合物52

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.48-8.44 (2H, m), 8.05 (1H, d), 7.74 (1H, dd), 7.65 (1H, dd), 7.35 (1H, dd), 3.05 (2H, q), 1.49 (3H, t).

本発明化合物53

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.92 (1H, dd), 8.65 (1H, dd), 8.37 (1H, s), 8.11 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 7.66 (1H, dd), 4.19 (2H, q), 1.45 (3H, t).

本発明化合物54

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.66 (1H, s), 8.50 (1H, s), 8.08 (1H, d), 7.90 (1H, s), 7.69 (1H, dd), 3.08 (2H, q), 1.52 (3H, t).

本発明化合物55

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 9.15 (1H, d), 8.88 (1H, d), 8.40 (1H, s), 8.14 (1H, d), 7.76 (1H, dd), 4.24 (2H, q), 1.49 (3H, t).

本発明化合物56

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.95 (1H, dd), 8.49 (1H, dd), 8.00 (1H, s), 7.66 (1H, dd), 6.96 (1H, s), 3.97 (3H, s), 3.84 (2H, q), 3.73 (3H, s), 1.34 (3H, t).

本発明化合物 57

$^1\text{H-NMR}$ (DMSO-D_6) δ : 8.67 (1H, d), 8.56 (1H, dd), 8.23 (1H, d), 8.05 (1H, d), 7.91 (2H, s), 7.59 (1H, dd), 3.86 (3H, s), 3.00 (2H, q), 1.21 (3H, t).

本発明化合物 58

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.20 (1H, d), 9.01 (1H, dd), 8.74 (1H, d), 8.54 (1H, dd), 7.76 (1H, dd), 3.89 (3H, s), 3.86–3.76 (2H, m), 1.37 (3H, t).

10

本発明化合物 59

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.18 (1H, d), 8.82 (1H, d), 8.74 (1H, s), 7.92 (1H, s), 4.10 (3H, s), 4.00 (3H, s), 3.02 (2H, q), 1.40 (3H, t).

本発明化合物 60

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.26 (1H, s), 8.82–8.78 (2H, m), 8.61 (1H, s), 3.99–3.91 (5H, m), 1.42 (3H, t).

本発明化合物 61

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.50 (1H, dd), 8.22 (1H, d), 7.77 (1H, dd), 7.63 (1H, dd), 7.46 (1H, d), 7.39–7.34 (1H, m), 3.92 (3H, s), 2.95 (2H, q), 1.34 (3H, t).

20

本発明化合物 62

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.79 (1H, d), 8.63 (1H, d), 8.13 (1H, s), 7.66–7.60 (2H, m), 7.49 (1H, d), 4.23 (3H, s), 3.74–3.64 (1H, m), 3.13–3.03 (1H, m), 1.47 (3H, t).

本発明化合物 63

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.95 (1H, dd), 8.50 (1H, dd), 8.12 (1H, d), 7.69–7.61 (2H, m), 7.48 (1H, d), 3.86–3.80 (2H, m), 3.75 (3H, s), 1.34 (3H, t).

30

本発明化合物 64

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.91 (1H, dd), 8.46–8.40 (2H, m), 7.91 (1H, d), 7.69–7.61 (2H, m), 3.75–3.68 (5H, m), 1.25 (3H, t).

本発明化合物 69

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.25 (1H, d), 9.20 (1H, d), 8.78 (1H, d), 8.73 (1H, d), 4.02–3.95 (5H, m), 3.94 (3H, s), 1.41 (3H, t).

40

本発明化合物 70

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.26 (1H, d), 8.86 (1H, d), 8.76 (1H, d), 8.36 (1H, d), 4.34 (3H, s), 4.01 (3H, s), 3.81 (2H, q), 1.40 (3H, t).

【0424】

本発明化合物 76

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75 (1H, s), 8.48 (2H, dd), 7.77 (1H, dd), 7.38 (1H, dd), 3.07 (2H, q), 1.50 (3H, t).

本発明化合物 77

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 12.11 (1H, s), 8.98 (1H, dd), 8.80 (1H, s), 8.70 (1H, dd), 8.45 (1H, s), 7.70 (1H, dd), 4.30 (2H, q), 1.43 (3H, t).

本発明化合物 78

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75–8.70 (2H, m), 8.34 (1H, s), 7.96 (1H, d), 3.14–3.07 (2H, m), 1.48 (3H, t).

本発明化合物 79

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 11.63 (1H, br s), 9.19 (1H, d), 8.93 (1H, d), 8.83 (1H, d), 8.48 (1H, d), 4.35 (2H, q), 1.47 (3H, t).

10

本発明化合物 80

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75 (1H, dd), 8.62 (1H, dd), 8.46 (1H, d), 7.81 (1H, dd), 7.45 (1H, dd), 3.07 (2H, q), 1.46 (3H, t).

本発明化合物 81

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.06 (1H, dd), 8.79 (1H, d), 8.58 (1H, dd), 8.43 (1H, d), 7.78 (1H, dd), 3.88 (2H, q), 1.44 (3H, t).

本発明化合物 82

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.82 (1H, s), 8.79 (1H, s), 8.50 (1H, s), 7.96 (1H, s), 3.11 (2H, q), 1.50 (3H, t).

20

本発明化合物 83

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.29 (1H, s), 8.84 (1H, s), 8.81 (1H, d), 8.47 (1H, d), 3.96 (2H, q), 1.48 (3H, t).

本発明化合物 84

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.59 (1H, dd), 8.24–8.21 (1H, m), 7.81–7.76 (2H, m), 7.69 (1H, dd), 7.42 (1H, dd), 3.06 (2H, q), 1.47 (3H, t).

本発明化合物 85

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.03 (1H, dd), 8.60 (1H, dd), 8.16–8.13 (1H, m), 7.82–7.71 (3H, m), 4.01 (2H, q), 1.43 (3H, t).

30

本発明化合物 86

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.79 (1H, dd), 8.26 (1H, dd), 7.94 (1H, d), 7.81 (1H, dd), 7.76–7.72 (1H, m), 3.11 (2H, q), 1.50 (3H, t).

本発明化合物 87

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.25 (1H, d), 8.83 (1H, d), 8.18 (1H, s), 7.85–7.76 (2H, m), 4.08 (2H, q), 1.47 (3H, t).

40

本発明化合物 89

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.25 (1H, d), 8.78 (1H, d), 8.43 (1H, s), 3.97–3.87 (5H, m), 1.41 (3H, t).

【0425】

本発明化合物 99

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.20 (1H, d), 8.76 (1H, d), 8.26 (1H, s), 4.02 (2H, q), 3.84 (3H, s), 3.04 (6H, s), 1.41 (3H, t).

本発明化合物 130

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.01 (1H, dd), 8.68 (1H, d), 8.5

50

5 (1H, dd), 8.37 (1H, d), 7.74 (1H, dd), 3.87 (3H, s), 3.83 (2H, q), 1.37 (3H, t)

本発明化合物 138

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 9.02 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 8.28 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.77 (1H, dd), 4.06 (3H, s), 3.74 (2H, q), 1.35 (3H, t).

本発明化合物 144

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 9.00–8.95 (1H, m), 8.54–8.47 (1H, m), 7.71–7.64 (2H, m), 6.94 (1H, s), 4.00 (3H, s), 3.96 (3H, s), 3.81–3.70 (2H, m), 1.37–1.29 (3H, m).

本発明化合物 190

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.99 (1H, dd), 8.65 (1H, d), 8.53 (1H, dd), 8.38 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 3.83–3.80 (5H, m), 1.35 (3H, t).

本発明化合物 255

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.78 (1H, d), 8.73–8.71 (1H, m), 8.65 (1H, d), 8.31–8.30 (1H, m), 4.35 (3H, s), 3.73–3.63 (1H, m), 3.16–3.06 (1H, m), 1.48 (3H, t)

本発明化合物 386

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.95 (1H, d), 8.72–8.71 (1H, m), 8.53 (1H, d), 8.30–8.28 (1H, m), 3.94–3.87 (5H, m), 1.40 (3H, t)

本発明化合物 505

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 9.05 (1H, dd), 8.79 (1H, t), 8.60 (1H, dd), 8.33 (1H, d), 7.78 (1H, dd), 7.58 (1H, s), 5.66 (2H, s), 3.98 (2H, q), 1.40 (3H, t).

本発明化合物 506

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 9.30 (1H, d), 8.84 (1H, d), 8.82 (1H, d), 8.36 (1H, d), 7.64 (1H, s), 5.70 (2H, s), 4.09 (2H, q), 1.45 (3H, t).

本発明化合物 508

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 9.28 (1H, d), 8.79 (1H, d), 8.48 (1H, s), 3.96 (3H, s), 3.89 (2H, q), 1.42 (3H, t).

【0426】

本発明化合物 509

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.75 (1H, d), 8.58 (1H, dd), 8.42 (1H, d), 7.82 (1H, dd), 7.66 (1H, s), 7.44 (1H, dd), 5.96 (2H, s), 2.98 (2H, q), 1.37 (3H, t).

本発明化合物 510

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.80 (2H, dd), 8.46 (1H, d), 7.97 (1H, d), 7.71 (1H, s), 5.99 (2H, s), 3.04 (2H, q), 1.42 (3H, t).

本発明化合物 511

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl₃) δ : 8.53 (1H, dd), 8.48 (1H, d), 7.98 (1H, dd), 7.93 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 4.27 (3H, s), 3.73–3.63 (1H, m), 3.47–3.37 (1H, m), 1.35 (3H, t).

本発明化合物 512

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75 (1H, d), 8.49 (1H, d), 8.12 (1H, d), 7.94 (1H, d), 4.28 (3H, s), 3.75–3.65 (1H, m), 3.55–3.45 (1H, m), 1.38 (3H, t).

本発明化合物 513

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.49 (1H, d), 7.76–7.74 (2H, m), 7.35 (1H, dd), 6.91 (1H, s), 4.05 (3H, s), 3.99 (3H, s), 2.95–2.85 (2H, m), 1.34–1.24 (3H, m).

本発明化合物 514

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.51 (1H, d), 7.97 (1H, s), 7.77 (1H, d), 7.42 (1H, s), 7.37 (1H, dd), 4.18 (3H, s), 2.91 (2H, q), 2.59 (3H, s), 1.30 (3H, t). 10

本発明化合物 515

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.08–8.97 (1H, m), 8.58–8.46 (1H, m), 8.41–8.26 (2H, m), 7.84–7.70 (1H, m), 4.12 (3H, s), 3.72–3.59 (2H, m), 3.33 (3H, s), 1.39–1.22 (3H, m).

本発明化合物 516

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.49 (1H, dd), 8.18 (1H, d), 7.75 (1H, dd), 7.71 (1H, d), 7.50–7.48 (1H, m), 7.36 (1H, dd), 7.30–7.09 (4H, m), 4.02 (3H, s), 2.90 (2H, q), 1.28 (3H, t). 20

本発明化合物 517

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.97 (1H, dd), 8.49 (1H, dd), 8.31 (1H, d), 8.17 (1H, d), 7.89 (2H, d), 7.72 (1H, dd), 7.69–7.64 (1H, m), 7.61–7.55 (2H, m), 3.87 (3H, s), 3.67 (2H, q), 1.32 (3H, t).

本発明化合物 518

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.02–8.97 (1H, m), 8.54–8.49 (1H, m), 8.33 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.80–7.71 (1H, m), 4.03–3.88 (3H, m), 3.75–3.63 (4H, m), 1.36–1.30 (3H, m). 30

本発明化合物 519

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.55 (1H, dd), 8.37–8.35 (1H, m), 7.93–7.92 (1H, m), 7.81 (1H, dd), 7.43 (1H, dd), 4.19 (3H, s), 2.96 (2H, q), 1.33 (3H, t).

本発明化合物 520

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.22 (1H, t), 8.77 (1H, d), 8.53 (1H, s), 3.95 (2H, q), 3.84 (3H, s), 3.33 (6H, s), 1.41 (3H, t).

【0427】

本発明化合物 521

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.28 (1H, d), 8.80 (1H, d), 8.62 (1H, s), 3.97 (3H, s), 3.89 (2H, q), 1.42 (3H, t).

本発明化合物 522

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.27 (1H, d), 8.79 (1H, d), 8.56 (1H, s), 7.24 (1H, brs), 5.76 (1H, brs), 4.00–3.86 (5H, m), 1.42 (3H, t).

本発明化合物 523

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.27 (1H, d), 8.77 (1H, d), 8.45 (1H, s), 7.92 (1H, s), 4.34 (3H, s), 3.81 (2H, q), 1.42 (3H, t). 50

1. 40 (3H, t).

本発明化合物 524

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.80 (1H, s), 8.46 (1H, s), 8.13 (1H, s), 7.93 (1H, s), 4.27 (3H, s), 3.76–3.66 (1H, m), 3.55–3.45 (1H, m), 1.38 (3H, t).

本発明化合物 525

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-D_6$) δ : 9.06 (1H, d), 8.95 (1H, s), 8.63 (1H, d), 8.31 (1H, s), 3.95 (3H, s), 3.15 (2H, q), 1.23 (3H, t).

本発明化合物 526

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.87 (1H, dd), 8.67 (1H, dd), 8.29 (1H, d), 7.96 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 4.57 (3H, s), 3.73–3.62 (1H, m), 3.17–3.07 (1H, m), 1.48 (3H, t).

本発明化合物 527

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 10.95 (1H, s), 8.46–8.42 (2H, m), 7.82 (1H, s), 7.76 (1H, dd), 7.38 (1H, dd), 3.07 (2H, q), 1.50 (3H, t).

本発明化合物 528

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.16 (1H, d), 8.74 (1H, d), 8.70 (1H, d), 8.31 (1H, d), 3.93 (3H, s), 3.88 (2H, q), 3.28 (9H, s), 1.38 (3H, t).

本発明化合物 529

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.51–8.46 (1H, m), 7.94 (1H, s), 7.86 (1H, s), 7.80–7.76 (1H, m), 7.40–7.35 (1H, m), 3.96 (3H, s), 2.96–2.90 (2H, m), 1.31–1.25 (3H, m).

本発明化合物 530

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.99 (1H, dd), 8.54 (1H, dd), 7.97 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.72 (1H, dd), 3.95–3.88 (5H, m), 1.37 (3H, t).

本発明化合物 531

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.93 (1H, dd), 8.45 (1H, dd), 8.19 (1H, s), 7.87 (1H, s), 7.66 (1H, dd), 3.77–3.75 (3H, m), 3.63 (2H, q), 1.26 (3H, t).

本発明化合物 532

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.75 (1H, s), 8.72 (1H, s), 8.41 (1H, s), 7.90 (1H, s), 4.15 (3H, s), 2.54 (3H, s)

本発明化合物 533

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.25 (1H, s), 8.85 (1H, s), 8.75 (1H, s), 8.32 (1H, s), 3.96 (3H, s), 3.73 (3H, s)

本発明化合物 534

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.41 (1H, s), 7.93 (1H, s), 4.10 (3H, s), 2.97 (2H, t), 1.82–1.71 (2H, m), 1.08 (3H, t)

本発明化合物 535

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.24 (1H, s), 8.79 (1H, s), 8.74 (1H, s), 8.31 (1H, s), 3.95–3.88 (5H, m), 1.92–1.81 (2H, m), 1.13 (3H, t)

【0428】

10

20

30

40

50

本発明化合物 5 3 6

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.76 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.41 (1H, s), 8.01 (1H, s), 4.07 (3H, s), 3.64–3.53 (1H, m), 1.38 (6H, d)

本発明化合物 5 3 7

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.24 (1H, s), 8.75 (2H, d), 8.31 (1H, s), 4.71–4.60 (1H, m), 3.93 (3H, s), 1.39 (6H, d)

本発明化合物 5 3 8

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.41 (1H, s), 7.94 (1H, s), 4.10 (3H, s), 2.98 (2H, t), 1.76–1.67 (2H, m), 1.55–1.44 (2H, m), 0.95 (3H, t) 10

本発明化合物 5 3 9

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.24 (1H, s), 8.79 (1H, s), 8.74 (1H, s), 8.29 (1H, s), 3.97–3.91 (5H, m), 1.85–1.77 (2H, m), 1.59–1.48 (2H, m), 0.99 (3H, t)

本発明化合物 5 4 0

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.76 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.00 (1H, s), 4.05 (3H, s), 3.40–3.30 (1H, m), 1.80–1.55 (2H, m), 1.35 (3H, d), 1.02 (3H, t) 20

本発明化合物 5 4 1

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.23 (1H, s), 8.75 (2H, s), 8.28 (1H, s), 4.54–4.44 (1H, m), 3.92 (3H, s), 2.02–1.91 (1H, m), 1.71–1.57 (1H, m), 1.37 (3H, d), 1.07 (3H, t)

本発明化合物 5 4 2

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.74–8.73 (1H, m), 8.72–8.71 (1H, m), 8.41 (1H, d), 7.92 (1H, d), 4.09 (3H, s), 2.86 (2H, d), 2.03–1.91 (1H, m), 1.08 (6H, d) 30

本発明化合物 5 4 3

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.24 (1H, s), 8.81 (1H, s), 8.75 (1H, s), 8.28 (1H, s), 3.93 (3H, s), 3.87 (2H, d), 2.42–2.30 (1H, m), 1.15 (6H, d)

本発明化合物 5 4 4

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.98 (1H, dd), 8.71 (1H, d), 8.37 (1H, d), 8.35–8.32 (1H, m), 3.88 (3H, s), 1.26 (9H, s)

本発明化合物 5 4 5

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.26 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.66 (1H, s), 8.29 (1H, s), 3.71 (3H, s), 1.41 (9H, s) 40

本発明化合物 5 4 6

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.73 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.41 (1H, s), 8.02 (1H, s), 4.10 (3H, s), 3.72–3.64 (1H, m), 2.27–2.16 (2H, m), 1.85–1.62 (6H, m)

本発明化合物 5 4 7

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.23 (1H, s), 8.76 (1H, s), 8.74 (1H, s), 8.31 (1H, s), 4.88–4.79 (1H, m), 3.90 (3H, s), 2.14–1.83 (6H, m), 1.80–1.69 (2H, m) 50

本発明化合物 5 4 8

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.76–8.74 (1H, m), 8.71–8.70 (1H, m), 8.41–8.39 (1H, m), 8.01–7.99 (1H, m), 4.05 (3H, s), 3.36–3.27 (1H, m), 2.07–1.22 (10H, m)

本発明化合物 5 4 9

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.23 (1H, s), 8.74 (1H, s), 8.72 (1H, s), 8.28 (1H, s), 4.43–4.34 (1H, m), 3.92 (3H, s), 2.03–1.20 (10H, m)

本発明化合物 5 5 0

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.90 (1H, s), 8.74 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.18 (1H, s), 4.13 (3H, s), 3.68 (2H, q)

本発明化合物 5 5 1

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 9.30–9.28 (1H, m), 8.87–8.85 (1H, m), 8.78–8.76 (1H, m), 8.36–8.34 (1H, m), 5.16 (2H, q), 4.04 (3H, s)

本発明化合物 5 5 2

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.66 (1H, d), 8.63 (1H, d), 8.36 (1H, d), 7.87 (1H, d), 4.00 (3H, s), 2.95 (2H, q), 1.30 (3H, t).

本発明化合物 5 5 3

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.55 (1H, dd), 8.35 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.81 (1H, dd), 7.43 (1H, dd), 3.95–3.93 (3H, m), 2.95 (2H, q), 1.32 (3H, t).

本発明化合物 5 5 4

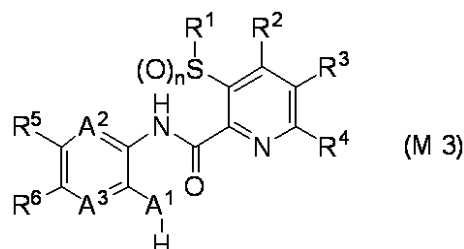
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.72 (2H, d), 8.41 (1H, d), 7.83 (1H, d), 6.98 (2H, d), 6.68 (2H, d), 5.81 (2H, s), 3.71 (3H, s), 2.89 (2H, q), 1.27 (3H, t).

本発明化合物 5 5 5

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.83 (1H, d), 8.71 (1H, s), 7.90 (1H, s), 7.84 (1H, d), 7.05 (2H, d), 6.78 (2H, d), 5.65 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.97 (2H, q), 1.32 (3H, t).

【0429】

式 (M3) で表される化合物。



式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 、 A^3 及び n は、下記の〔表59〕～〔表61〕に記載の組み合わせを表す。式 (M3) で表される中間体化合物 (M3) は、製造法2又は製造法7に記載の方法に準じて合成することができる。

【0430】

10

20

30

40

【表 5 9】

中間体 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
M3-1	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-2	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	1
M3-3	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-4	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-5	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-6	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-7	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
M3-8	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-9	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	N	0
M3-10	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	N	0
M3-11	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	N	2
M3-12	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N	2
M3-13	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-14	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	1
M3-15	Et	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-16	Et	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-17	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-18	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	1
M3-19	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-20	Et	H	H	H	SOCF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-21	Et	H	H	H	I	H	NMe	CH	CH	0
M3-22	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	0
M3-23	Et	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH	2
M3-24	Et	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	2

10

20

30

【 0 4 3 1 】

【表 6 0】

中間体 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
M3-25	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
M3-26	Et	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
M3-27	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-28	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	1
M3-29	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
M3-30	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
M3-31	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
M3-32	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
M3-33	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
M3-34	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
M3-35	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
M3-36	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	1
M3-37	Et	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH	2
M3-38	Et	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N	0
M3-39	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N	0
M3-40	Et	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N	2
M3-41	Et	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	CH	0
M3-42	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH	0
M3-43	Et	H	H	H	CF ₃	H	N(CH ₂ CF ₃)	CH	N	0
M3-44	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N(CH ₂ CF ₃)	CH	N	0
M3-45	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-46	Et	H	CF ₂ CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N	0
M3-47	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	N	0
M3-48	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NH	CH	N	0
M3-49	Et	H	H	H	CF ₃	H	OH	CH	N	0
M3-50	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	OH	CH	N	0

10

20

30

【 0 4 3 2】

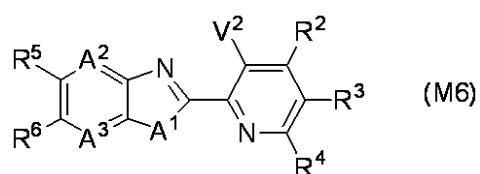
【表 6 1】

中間体 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
M3-51	Et	H	H	H	CF ₃	H	OH	CH	CH	0
M3-52	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	OH	CH	CH	0
M3-53	Et	H	H	H	CF ₃	H	N-(2-Chloro-thiazol-5-ylmethyl)	CH	N	0
M3-54	Et	H	CF ₃	H	CF ₃	H	N-(2-Chloro-thiazol-5-ylmethyl)	CH	N	0
M3-55	Et	H	H	H	CF ₃	H	NH	CH	CCF ₃	0
M3-56	Et	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CCN	0

40

【 0 4 3 3】

式 (M 6) で表される化合物。



式中の V^2 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 A^1 、 A^2 及び A^3 は、下記の〔表 6 2〕～〔表 6 3〕に記載の組み合わせを表す。式 (M 6) で表される中間体 (M 6) は、製造法 6 に記載の方法に準じて合成することができる。

【 0 4 3 4 】

【表 6 2】

中間体 化合物	V	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	A^1	A^2	A^3
M6-1	Cl	H	H	H	CF_3	H	NMe	CH	N
M6-2	F	H	H	H	CF_3	H	NMe	CH	N
M6-3	Cl	H	CF_3	H	CF_3	H	NMe	CH	N
M6-4	F	H	CF_3	H	CF_3	H	NMe	CH	N
M6-5	Cl	H	H	H	CF_2CF_3	H	NMe	CH	N
M6-6	F	H	H	H	CF_2CF_3	H	NMe	CH	N
M6-7	Cl	H	H	H	I	H	NMe	CH	N
M6-8	F	H	H	H	I	H	NMe	CH	N
M6-9	Cl	H	CF_3	H	CF_3	H	S	CH	N
M6-10	F	H	CF_3	H	CF_3	H	S	CH	N
M6-11	Cl	H	H	H	CF_3	H	S	CH	N
M6-12	F	H	H	H	CF_3	H	S	CH	N
M6-13	Cl	H	H	H	SCF_3	H	NMe	CH	N
M6-14	F	H	H	H	SCF_3	H	NMe	CH	N
M6-15	Cl	H	H	H	SO_2CF_3	H	NMe	CH	N
M6-16	F	H	H	H	SO_2CF_3	H	NMe	CH	N
M6-17	Cl	H	CF_3	H	CF_2CF_3	H	NMe	CH	N
M6-18	F	H	CF_3	H	CF_2CF_3	H	NMe	CH	N
M6-19	Cl	H	H	H	$SOCF_3$	H	NMe	CH	N
M6-20	F	H	H	H	$SOCF_3$	H	NMe	CH	N
M6-21	Cl	H	H	H	I	H	NMe	CH	CH
M6-22	F	H	H	H	I	H	NMe	CH	CH
M6-23	Cl	H	H	H	SF_5	H	NMe	CH	CH
M6-24	F	H	H	H	SF_5	H	NMe	CH	CH

【 0 4 3 5 】

【表 6 3】

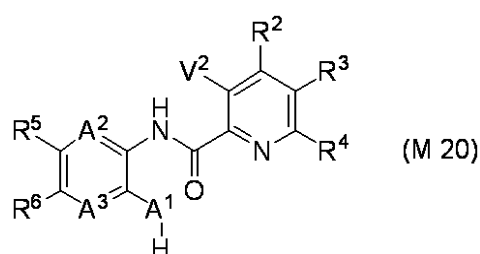
中間体 化合物	V	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³
M6-25	Cl	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M6-26	F	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M6-27	Cl	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-28	F	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-29	Cl	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-30	F	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-31	Cl	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-32	F	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-33	Cl	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-34	F	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-35	Cl	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N
M6-36	F	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N
M6-37	Cl	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	CH	N
M6-38	F	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	CH	N
M6-39	Cl	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N
M6-40	F	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N
M6-41	Cl	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	CH
M6-42	F	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	CH
M6-43	Cl	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr
M6-44	Cl	H	H	H	CF ₃	OCH ₃	NMe	CH	CH
M6-45	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	CH
M6-46	Cl	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	CH

10

20

【0 4 3 6】

式 (M 2 0) で表される化合物。



30

式中の V²、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、A¹、A²及び A³は、下記の〔表 6 4〕～〔表 6 5〕に記載の組み合わせを表す。式 (M 2 0) で表される中間体化合物 (M 2 0) は、製造法 6 に記載の方法に準じて合成することができる。

40

【0 4 3 7】

【表 6 4】

中間体 化合物	V	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³
M20-1	Cl	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-2	F	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-3	Cl	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-4	F	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-5	Cl	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-6	F	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-7	Cl	H	H	H	I	H	NMe	CH	N
M20-8	F	H	H	H	I	H	NMe	CH	N
M20-9	Cl	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	N
M20-10	F	H	CF ₃	H	CF ₃	H	S	CH	N
M20-11	Cl	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N
M20-12	F	H	H	H	CF ₃	H	S	CH	N
M20-13	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N
M20-14	F	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N
M20-15	Cl	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-16	F	H	H	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-17	Cl	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-18	F	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-19	Cl	H	H	H	SOCF ₃	H	NMe	CH	N
M20-20	F	H	H	H	SOCF ₃	H	NMe	CH	N
M20-21	Cl	H	H	H	I	H	NMe	CH	CH
M20-22	F	H	H	H	I	H	NMe	CH	CH
M20-23	Cl	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH
M20-24	F	H	H	H	SF ₅	H	NMe	CH	CH

10

20

30

【 0 4 3 8 】

【表 6 5】

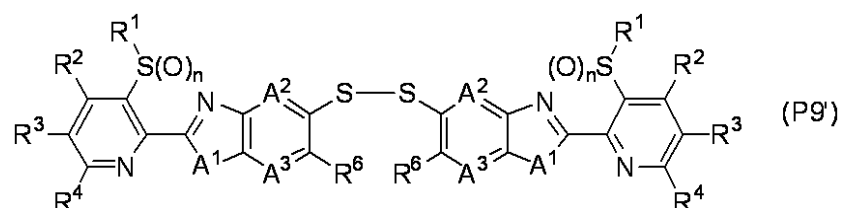
中間体 化合物	V	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A ¹	A ²	A ³
M20-25	Cl	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-26	F	H	CF ₃	H	SO ₂ CF ₃	H	NMe	CH	N
M20-27	Cl	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-28	F	H	H	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-29	Cl	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-30	F	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-31	Cl	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-32	F	H	CF ₃	H	CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-33	Cl	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-34	F	H	CF ₃	H	CF ₂ CF ₃	H	NMe	CH	CH
M20-35	Cl	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N
M20-36	F	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	N
M20-37	Cl	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	CH	N
M20-38	F	H	CF ₃	H	SH	H	NMe	CH	N
M20-39	Cl	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N
M20-40	F	H	CF ₃	H	SCF ₃	H	NMe	CH	N
M20-41	Cl	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	CH
M20-42	F	H	CF ₃	H	I	H	NMe	CH	CH
M20-43	Cl	H	H	H	CF ₃	H	NMe	CH	CBr
M20-44	Cl	H	H	H	SCF ₃	H	NMe	CH	CH

10

20

【0 4 3 9】

式（P 9'）で表される化合物。



30

式中の R¹、R²、R³、R⁴、R⁶、A¹、A²、A³及び n は、下記の〔表 6 6〕に記載の組み合わせを表す。式（P 9'）で表される中間体化合物（P 9'）は、製造法 2 0 に記載の方法に準じて合成することができる。

【0 4 4 0】

【表 6 6】

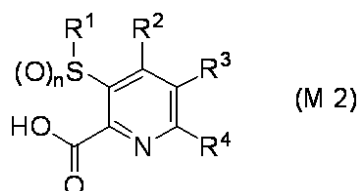
中間体 化合物	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	A ¹	A ²	A ³	n
P9'-1	Et	H	H	H	H	NMe	CH	N	0
P9'-2	Et	H	H	H	H	NMe	CH	N	1
P9'-3	Et	H	H	H	H	NMe	CH	N	2
P9'-4	Et	H	CF ₃	H	H	NMe	CH	N	0
P9'-5	Et	H	CF ₃	H	H	NMe	CH	N	1
P9'-6	Et	H	CF ₃	H	H	NMe	CH	N	2

40

【0 4 4 1】

式（M 2）で表される化合物。

50



式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び n は、下記の〔表 6 7〕に記載の組み合わせを表す。式 (M 2) で表される中間体化合物 (M 2) は、製造法 1 2 又は製造法 1 4 に記載の方法に準じて合成することができる。

【0 4 4 2】

10

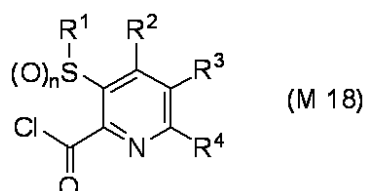
【表 6 7】

中間体 化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n
M2-1	Et	H	H	H	0
M2-2	Et	H	H	H	1
M2-3	Et	H	H	H	2
M2-4	Et	H	CF_3	H	0
M2-5	Et	H	CF_3	H	1
M2-6	Et	H	CF_3	H	2
M2-7	Et	H	CF_2CF_3	H	2

20

【0 4 4 3】

式 (M 1 8) で表される化合物。



30

式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び n は、下記の〔表 6 8〕に記載の組み合わせを表す。式 (M 1 8) で表される中間体化合物 (M 1 8) は、製造法 1 3 に記載の方法に準じて合成することができる。

【0 4 4 4】

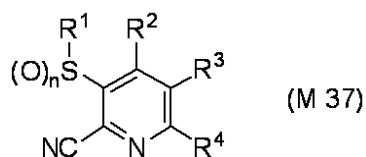
【表 6 8】

中間体 化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n
M18-1	Et	H	H	H	0
M18-2	Et	H	H	H	1
M18-3	Et	H	H	H	2
M18-4	Et	H	CF_3	H	0
M18-5	Et	H	CF_3	H	1
M18-6	Et	H	CF_3	H	2

40

【0 4 4 5】

式 (M 3 7) で表される化合物。



式中の R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び n は、下記の〔表 6 9〕に記載の組み合わせを表す。式 (M 3 7) で表される中間体化合物 (M 3 7) は、製造法 1 4 に記載の方法に準じて合成することができる。

【 0 4 4 6 】

【表 6 9】

10

中間体 化合物	R^1	R^2	R^3	R^4	n
M37-1	Et	H	H	H	0
M37-2	Et	H	H	H	1
M37-3	Et	H	H	H	2
M37-4	Et	H	CF ₃	H	0
M37-5	Et	H	CF ₃	H	1
M37-6	Et	H	CF ₃	H	2

【 0 4 4 7 】

20

中間体化合物 M 3 - 3 3、M 3 - 4 7、M 3 - 4 8、M 3 - 4 9、M 3 - 5 0、M 3 - 5 1、M 3 - 5 2、M 3 - 5 3、M 3 - 5 4、M 3 - 5 5、M 3 - 5 6、M 6 - 1、M 6 - 1 7、M 6 - 4 4、M 6 - 4 5、M 6 - 4 6、M 2 - 1、M 2 - 4、M 1 8 - 1、M 2 0 - 4 4、M 3 7 - 1 及び M 3 7 - 4 の NMR データを下記の〔表 7 0〕～〔表 7 1〕に示す。

【 0 4 4 8 】

【表 7 0】

中間体 化合物	物性値
M3-33	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.61(1H, s), 8.96(2H, d), 7.72(1H, s), 7.49(1H, d), 6.83(1H, d), 4.21(1H, s), 3.38(1H, brs), 2.94–2.94(4H, brm), 1.36–1.23(3H, m).
M3-47	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.87(1H, brs), 8.33(1H, dd), 8.25(1H, d), 8.14(1H, d), 7.75(1H, dd), 7.44(1H, dd), 5.01(2H, brs), 2.96(2H, q), 1.44(3H, t).
M3-48	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.73(1H, s), 8.56(1H, dd), 8.28(1H, dd), 8.12(1H, d), 7.91(1H, d), 4.99(2H, s), 3.00(2H, q), 1.46(3H, t).
M3-49	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 12.34(1H, s), 10.99(1H, s), 8.75(1H, d), 8.39(1H, dd), 7.76(1H, dd), 7.45(1H, dd), 7.38(1H, d), 2.98(2H, q), 1.44(3H, t).
M3-50	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 11.36(1H, s), 10.93(1H, s), 8.90(1H, d), 8.67–8.64(1H, m), 7.92–7.89(1H, m), 7.54–7.50(1H, m), 3.01(2H, q), 1.48(3H, t).
M3-51	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10.45(1H, s), 9.57(1H, s), 8.36(1H, dd), 7.75(1H, dd), 7.52(1H, d), 7.45(1H, dd), 7.40–7.36(1H, m), 7.11(1H, d), 2.96(2H, q), 1.44(3H, t).
M3-52	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 10.34(1H, s), 8.84(1H, s), 8.58(1H, d), 7.92(1H, d), 7.67(1H, d), 7.40(1H, dd), 7.12(1H, d), 3.00(2H, q), 1.47(3H, t).
M3-53	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.78(1H, s), 8.38(1H, d), 8.33(1H, dd), 7.96(1H, d), 7.74(1H, dd), 7.47–7.43(2H, m), 5.66(1H, s), 4.81(2H, d), 2.95(2H, q), 1.43(3H, t).
M3-54	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.65(1H, s), 8.56(1H, s), 8.41(1H, s), 7.95(1H, d), 7.91(1H, s), 7.47(1H, s), 5.54(1H, t), 4.81(2H, d), 2.99(2H, q), 1.46(3H, t).
M3-55	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.88(1H, s), 8.33(1H, dd), 7.99(1H, s), 7.74(1H, dd), 7.62(1H, s), 7.44(1H, dd), 4.71(2H, s), 2.95(2H, q), 1.43(3H, t).
M3-56	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 9.94(1H, s), 8.35(1H, dd), 8.14(1H, d), 7.75(1H, dd), 7.60(1H, d), 7.45(1H, dd), 4.63(1H, d), 3.24(3H, d), 2.96(2H, q), 1.44(3H, t).

10

20

30

【 0 4 4 9 】

【表 7 1】

中間体 化合物	物性値
M6-1	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.76(1\text{H}, \text{d}), 8.71(1\text{H}, \text{dd}), 8.39(1\text{H}, \text{d}), 7.97(1\text{H}, \text{dd}), 7.48(1\text{H}, \text{dd}), 3.97(3\text{H}, \text{s})$.
M6-17	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.97-8.95(1\text{H}, \text{m}), 8.74-8.72(1\text{H}, \text{m}), 8.41-8.39(1\text{H}, \text{m}), 8.23-8.21(1\text{H}, \text{m}), 4.03(3\text{H}, \text{s})$
M6-44	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.65(1\text{H}, \text{dd}), 8.09(1\text{H}, \text{s}), 7.91(1\text{H}, \text{dd}), 7.40(1\text{H}, \text{dd}), 6.94(1\text{H}, \text{s}), 3.98(3\text{H}, \text{s}), 3.81(3\text{H}, \text{s})$.
M6-45	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.69(1\text{H}, \text{d}), 8.21(1\text{H}, \text{s}), 7.94(1\text{H}, \text{d}), 7.65(1\text{H}, \text{d}), 7.53-7.41(2\text{H}, \text{m}), 3.85(3\text{H}, \text{s})$.
M6-46	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.65(1\text{H}, \text{dd}), 8.47(1\text{H}, \text{s}), 8.08(1\text{H}, \text{d}), 7.93(1\text{H}, \text{dd}), 7.68(1\text{H}, \text{d}), 7.38(1\text{H}, \text{dd})$.
M2-1	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.31(1\text{H}, \text{d}), 7.75(1\text{H}, \text{d}), 7.49(1\text{H}, \text{dd}), 2.97(2\text{H}, \text{q}), 1.44(3\text{H}, \text{t})$.
M2-4	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.55(1\text{H}, \text{s}), 7.92(1\text{H}, \text{s}), 3.02(2\text{H}, \text{q}), 1.47(3\text{H}, \text{t})$.
M18-1	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.56(1\text{H}, \text{d}), 7.74(1\text{H}, \text{d}), 7.47(1\text{H}, \text{dd}), 2.99(2\text{H}, \text{q}), 1.42(3\text{H}, \text{t})$.
M20-44	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 9.53(1\text{H}, \text{brs}), 8.54(1\text{H}, \text{d}), 7.90(1\text{H}, \text{d}), 7.70-7.46(3\text{H}, \text{m}), 6.76(1\text{H}, \text{d}), 4.48(1\text{H}, \text{brs}), 2.91(3\text{H}, \text{d})$.
M37-1	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.49(1\text{H}, \text{dd}), 7.75(1\text{H}, \text{dd}), 7.43(1\text{H}, \text{dd}), 3.06(2\text{H}, \text{q}), 1.38(3\text{H}, \text{t})$.
M37-4	$^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta: 8.68(1\text{H}, \text{s}), 7.88(1\text{H}, \text{s}), 3.13(2\text{H}, \text{q}), 1.44(3\text{H}, \text{t})$.

10

20

【0 4 5 0】

次に本発明化合物の製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

【0 4 5 1】

製剤例 1

本発明化合物 1～555 のいずれか 1 種 10 部を、キシレン 35 部と N, N-ジメチルホルムアミド 35 部との混合物に溶解し、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 14 部及びドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、混合して各々の乳剤を得る。

30

【0 4 5 2】

製剤例 2

ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部及び珪藻土 54 部を混合し、更に本発明化合物 1～555 のいずれか 1 種 20 部を加え、混合して各々の水和剤を得る。

【0 4 5 3】

製剤例 3

本発明化合物 1～555 のいずれか 1 種 2 部に、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、ベントナイト 30 部及びカオリンクレー 65 部を加え混合する。ついで、この混合物に適量の水を加え、さらに攪拌し、造粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

40

【0 4 5 4】

製剤例 4

本発明化合物 1～555 のいずれか 1 種 1 部を適量のアセトンに溶解し、これに合成含水酸化珪素微粉末 5 部、PAP0. 3 部及びフバサミクレー 93. 7 部を加え、充分攪拌混合し、アセトンを蒸発除去して各々の粉剤を得る。

50

【0455】

製剤例 5

ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩及びホワイトカーボンの混合物（重量比1：1）35部と、本発明化合物1～555のいずれか1種 10部と、水55部とを混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより、各々のフロアブル剤を得る。

【0456】

製剤例 6

本発明化合物1～555のいずれか1種 0.1部をキシレン5部及びトリクロロエタン5部に溶解し、これを脱臭灯油89.9部に混合して各々の油剤を得る。

10

【0457】

製剤例 7

本発明化合物1～555のいずれか1種 10mgをアセトン0.5mlに溶解し、この溶液を、動物用固形飼料粉末（飼育繁殖用固形飼料粉末CE-2、日本クレア株式会社商品）5gに処理し、均一に混合する。ついでアセトンを蒸発乾燥させて各々の毒餌剤を得る。

【0458】

製剤例 8

本発明化合物1～555のいずれか1種 0.1部、ネオチオゾール（中央化成株式会社）49.9部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、ジメチルエーテル25部、LPG25部を充填し振とうを加え、アクチュエータを装着することで油剤エアゾールを得る。

20

【0459】

製剤例 9

本発明化合物1～555のいずれか1種 0.6部、BHT（2,6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）0.01部、キシレン5部、脱臭灯油3.39部及び乳化剤〔アトモス300（アトモスケミカル社登録商標名）〕1部を混合溶解したものと、蒸留水50部とをエアゾール容器に充填し、バルブを装着した後、該バルブを通じて噴射剤（LPG）40部を加圧充填して水性エアゾールを得る。

【0460】

製剤例 10

本発明化合物1～555のいずれか0.1gを、プロピレングリコール2mlに溶解させ、4.0×4.0cm、厚さ1.2cmの多孔セラミック板に含浸させて、加熱式くん煙剤を得る。

30

【0461】

製剤例 11

本発明化合物1～555のいずれか5部とエチレン-メタクリル酸メチル共重合体（共重合体中のメタクリル酸メチルの割合：10重量%、アクリフトWD301、住友化学製）95部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で溶融混練し、得られた混練物を押出し成型機から成型ダイスを介して押出し、長さ15cm、直径3mmの棒状成型体を得る。

40

【0462】

製剤例 12

本発明化合物1～555のいずれか5部と軟質塩化ビニル樹脂95部を密閉式加圧ニーダー（森山製作所製）で溶融混練し、得られた混練物を押出し成型機から成型ダイスを介して押出し、長さ15cm、直径3mmの棒状成型体を得る。

【0463】

製剤例 13

本発明化合物1～555のいずれか100mg、ラクトース68.75mg、トウモロコシデンプン237.5mg、微結晶性セルロース43.75mg、ポリビニルピロリドン18.75mg、ナトリウムカルボキシメチルデンプン28.75mg、及びステアリン

50

酸マグネシウム 2.5 mg を混合し、得られた混合物を適切な大きさに圧縮して、錠剤を得る。

【0464】

製剤例 14

本発明化合物 1～555 のいずれか 25 mg、ラクトース 60 mg、トウモロコシデンプン 25 mg、カルメロースカルシウム 6 mg、及び 5% ヒドロキシプロピルメチルセルロース適量を混合し、得られた混合物をハードシェルゼラチンカプセル又はヒドロキシプロピルメチルセルロースカプセルに充填し、カプセル剤を得る。

【0465】

製剤例 15

本発明化合物 1～555 のいずれか 1000 mg、フマル酸 500 mg、塩化ナトリウム 2000 mg、メチルパラベン 150 mg、プロピルパラベン 50 mg、顆粒糖 2500 mg、ソルビトール（70% 溶液）13000 mg、V e e g u m K（V a n d e r b i l t C o.）100 mg、香料 35 mg、及び着色料 500 mg に、最終容量が 100 ml となるよう蒸留水を加え、混合して、経口投与用サスペンションを得る。

【0466】

製剤例 16

本発明化合物 1～555 のいずれか 5 重量%を、ポリソルベート 85 5 重量%、ベンジルアルコール 3 重量%、及びプロピレングリコール 30 重量%に溶解し、この溶液の pH が 6.0～6.5 となるようにリン酸塩緩衝液を加えた後、最終容量となるまで水を加えて、経口投与用液剤を得る。

【0467】

製剤例 17

分留ヤシ油 57 重量%およびポリソルベート 85 3 重量%中にジステアリン酸アルミニウム 5 重量%を加熱により分散させる。これを室温に冷却し、その油状ビヒクル中のサッカリン 25 重量%を分散させる。これに本発明化合物 1～555 のいずれか 10 重量%を配分し、経口投与用ペースト状製剤を得る。

【0468】

製剤例 18

本発明化合物 1～555 のいずれか 5 重量%を石灰石粉 95 重量%と混合し、湿潤顆粒形成法を使用して経口投与用粒剤を得る。

【0469】

製剤例 19

本発明化合物 1～555 のいずれか 5 部をジエチレングリコールモノエチルエーテル 80 部に溶解し、これに炭酸プロピレン 15 部を混合して、スポットオン液剤を得る。

【0470】

製剤例 20

本発明化合物 1～555 のいずれか 10 部をジエチレングリコールモノエチルエーテル 70 部に溶解し、これに 2-オクチルドデカノール 20 部を混合して、ポアオン液剤を得る。

【0471】

製剤例 21

本発明化合物 1～555 のいずれか 0.5 部に、ニッコール T E A L S - 42（日光ケミカルズ・ラウリル硫酸トリエタノールアミンの 42% 水溶液）60 部、プロピレングリコール 20 部を添加し、均一溶液になるまで充分攪拌混合した後、水 19.5 部を加えてさらに充分攪拌混合し、均一溶液のシャンプー剤を得る。

【0472】

製剤例 22

本発明化合物 1～555 のいずれか 0.15 重量%、動物飼料 95 重量%、並びに、第 2 リン酸カルシウム、珪藻土、A e r o s i l、及びカーボネート（又はチョーク）からな

10

20

30

40

50

る混合物 4. 85 重量%を十分攪拌混合し、動物用飼料プレミックスを得る。

【0473】

製剤例 23

本発明化合物 1～555 のいずれか 7. 2 g、及びホスコ S-55（丸石製薬株式会社製）92. 8 g を 100℃で溶解混和し、坐剤形に注いで、冷却固化して、坐剤を得る。

【0474】

次に、本発明化合物の有害生物防除効力を試験例により示す。

【0475】

試験例 1

製剤例 5 により得られた本発明化合物 1～9、12～16、18～20、22～28、30～32、36～37、40、44、46～48、50～51、56、60、62～65、69～70、72、74、76、79～81、84～85、89、99、138、144、190、508、511～515、517～524、526 及び 528～529 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたキュウリ幼苗（第 1 本葉展開期）にワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）（全ステージ）約 30 頭を接種し、1 日間放置した。この幼苗に、前記試験用薬液 20 ml を散布した。

散布 6 日後に該キュウリの葉上に寄生したワタアブラムシ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b ：無処理区の処理前の虫数

C_{ai} ：無処理区の観察時の虫数

T_b ：処理区の処理前の虫数

T_{ai} ：処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 1～9、12～16、18～20、22～28、30～32、36～37、40、44、46～48、50～51、56、60、62～65、69～70、72、74、76、79～81、84～85、89、99、138、144、190、508、511～515、517～524、526 及び 528～529 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90% 以上を示した。

【0476】

試験例 2

製剤例 5 により得られた本発明化合物 1～3、5～8、13～16、19～20、25、27、30、32、36～37、44、47～48、50～51、60、62～64、72、81、85、99、138、144、511～512、515、518、522～524 及び 528 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたキュウリ幼苗（第 2 本葉展開期）に、前記試験用薬液 5 ml を株元灌注し、7 日間 25℃温室内に保った。ワタアブラムシ（*Aphis gossypii*）（全ステージ）約 30 頭をキュウリ葉面に接種し、更に 6 日該温室内に保った後に、該キュウリの葉上に寄生したワタアブラムシ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (C_b \times T_{ai}) / (C_{ai} \times T_b)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

C_b ：無処理区の処理前の虫数

C_{ai} ：無処理区の観察時の虫数

T_b ：処理区の処理前の虫数

T_{ai} ：処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 1～3、5～8、13～16、19～20、25、27、30、32、36～37、44、47～48、50～51、60、62～64、72、81、85、99、138、144、511～512、515、518、522～524 及び 528 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90% 以上を示した。

【0477】

試験例 3

製剤例 5 により得られた本発明化合物 1～3、5～9、12～20、22、24～30、32、36～37、44、50、60、62～64、72、74、81、84～85、89、99、138、144、511、515、518～519、521、523～524 及び 529 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

ポリエチレンカップに植えた第 2 葉展開期のイネ幼苗に、前記試験用薬液 10 ml を散布した。風乾後、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) の 3～4 齢幼虫を 20 頭放して、25℃の温室内に保管した。6 日後イネに寄生したトビイロウンカの数进行调查し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

Cb: 無処理区の処理前の虫数

Cai: 無処理区の観察時の虫数

Tb: 処理区の処理前の虫数

Tai: 処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 1～3、5～9、12～20、22、24～30、32、36～37、44、50、60、62～64、72、74、81、84～85、89、99、138、144、511、515、518～519、521、523～524 及び 529 の試験用薬液を用いた処理区は、防除価 90% 以上を示した。

【0478】

試験例 4

製剤例 5 により得られた本発明化合物 1～3、5～6、8、12～16、18～19、22、24～27、29、32、36～37、44、48、50、60、62～64、72、74、81、85、89、99、138、144、508、512、515、518～519 及び 521～524 の製剤を、有効成分濃度が 500 ppm となるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、プラスチックカップに植えたイネ幼苗（播種 2 週間後、第 2 葉展開期）に、前記試験用薬液 5 ml を株元灌注し、7 日間 25℃温室内に保った。トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) の 3～4 齢幼虫を 20 頭放して、更に 6 日該温室内に保った後に、該イネの葉上に寄生したトビイロウンカ生存虫数を調査し、以下の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価 (\%)} = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

Cb: 無処理区の処理前の虫数

Cai: 無処理区の観察時の虫数

Tb: 処理区の処理前の虫数

Tai: 処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例 5 において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物 1～3、5～6、8、12～16、18～19、22、24～

27、29、32、36～37、44、48、50、60、62～64、72、74、81、85、89、99、138、144、508、512、515、518～519及び521～524の試験用薬液を用いた処理区は、防除価90%以上を示した。

【0479】

試験例5

製剤例5により得られた本発明化合物3、5～6、8、13～16、18～20、24～27、29、36～37、44、47、60、63～64、72、74、89、99、511、515、518、521、523～524及び528の製剤を、有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップに植えたトマト幼苗（第3本葉展開期）に、タバココナジラミ（*Bemisia tabaci*）成虫を放ち、約72時間産卵させた。該トマト苗を8日間温室内に保持し、産下された卵から幼虫が孵化してきたところへ前記試験用薬液を20ml／カップの割合で散布し、25℃で温室内に保持した。7日後トマト葉上の生存幼虫数の調査を行い、次の式により防除価を求めた。

$$\text{防除価}(\%) = \{1 - (Cb \times Tai) / (Cai \times Tb)\} \times 100$$

なお、式中の文字は以下の意味を表す。

Cb：無処理区の処理前の虫数

Cai：無処理区の観察時の虫数

Tb：処理区の処理前の虫数

Tai：処理区の観察時の虫数

ここで無処理区とは、製剤例5において本発明化合物を含まない製剤を、処理区と同量の水で希釈した試験用薬液を散布した区を意味する。

その結果、本発明化合物3、5～6、8、13～16、18～20、24～27、29、36～37、44、47、60、63～64、72、74、89、99、511、515、518、521、523～524及び528の試験用薬液を用いた処理区は、防除価90%以上を示した。

【0480】

試験例6

製剤例5により得られた本発明化合物1～5、8～9、11～12、15～16、19～20、22～25、27～33、35～37、40、44、46～51、53、58～65、69、71～74、76～78、80～85、87、89、99、138、144、190、505～506、508、511～515、518、520～523及び527～530の製剤を、有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップに植えた3葉期キャベツに、前記試験用薬液を20mL／カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、茎葉部を切り取って50mLカップに収容し、コナガ（*Plutella xylostella*）2令幼虫5頭を放ち、蓋をした。25℃で保管し、5日後に生存虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

$$\text{死虫率}(\%) = (\text{死亡虫数} / \text{供試虫数}) \times 100$$

その結果、本発明化合物1～5、8～9、11～12、15～16、19～20、22～25、27～33、35～37、40、44、46～51、53、58～65、69、71～74、76～78、80～85、87、89、99、138、144、190、505～506、508、511～515、518、520～523及び527～530の試験用薬液を用いた処理区は、死虫率80%以上を示した。

【0481】

試験例7

製剤例5により得られた本発明化合物1～9、11～20、22～35、38～40、44、46～48、50、53、58、60、62～64、71～72、74、77～85、87、89、99、138、144、505～506、508、511～512、514～515、518～520、523～526及び528～530の製剤を有効成分濃

10

20

30

40

50

度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用散布液を調製した。

一方、プラスチックカップにリンゴを植え、第7本葉ないしは第8本葉が展開するまで生育させた。そのリンゴに上記試験用薬液を20mL／カップの割合で散布した。薬液が乾いた後、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*) 初齢幼虫60頭を放ち、底面をくりぬき、ろ紙を貼ったプラスチックカップを逆さにして被せた。7日後に生存虫数を数え、次式より死虫率を求めた。

$$\text{死虫率}(\%) = (\text{死亡虫数} / \text{供試虫数}) \times 100$$

その結果、本発明化合物1～9、11～20、22～35、38～40、44、46～48、50、53、58、60、62～64、71～72、74、77～85、87、89、99、138、144、505～506、508、511～512、514～515、518～520、523～526及び528～530の試験用薬液の処理区は、死虫率90%以上を示した。

【0482】

試験例8

製剤例5により得られた本発明化合物1、3～5、8、15～16、19～20、23、27、29、37、40、44、48、60～61、64、72、74、518、523及び528の各々の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

直径5.5cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mlを濾紙上に滴下し、餌としてショ糖30mgを均一に入れた。該ポリエチレンカップ内にイエバエ (*Musca domestica*) 雌成虫10頭を放ち、蓋をした。24時間後にイエバエの生死を調査し死虫率を求めた。

その結果、本発明化合物1、3～5、8、15～16、19～20、23、27、29、37、40、44、48、60～61、64、72、74、518、523及び528の処理においては死虫率100%を示した。

【0483】

試験例9

製剤例5により得られた本発明化合物4～5、19～20、28～29、40、44、48、60、71～74、89、523及び528の各々の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

直径5.5cmのポリエチレンカップの底に同大の濾紙を敷き、上記試験用薬液0.7mlを濾紙上に滴下し、餌としてショ糖30mgを均一に入れた。該ポリエチレンカップ内にチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 雄成虫2頭を放ち、蓋をした。6日後にチャバネゴキブリの生死を調査し死虫率を求めた。

その結果、本発明化合物4～5、19～20、28～29、40、44、48、60、71～74、89、523及び528の処理においては死虫率100%を示した。

【0484】

試験例10

製剤例5により得られた本発明化合物1、3～5、8、15～16、19～20、22～25、27～28、31～33、35、37、40、44、48～49、51、59～64、71～74、80～81、84～85、89、99、138、144、505～506、508、514～515、518、520、522～523及び528の各々の製剤を有効成分濃度が500ppmとなるように水で希釈し、試験用薬液を調製した。

上記試験用薬液0.7mlをイオン交換水100mlに加えた(有効成分濃度3.5ppm)。該液中にアカイエカ (*Culex pipiens pallens*) 終令幼虫20頭を放ち、1日後にその生死を調査し死虫率を求めた。

その結果、本発明化合物1、3～5、8、15～16、19～20、22～25、27～28、31～33、35、37、40、44、48～49、51、59～64、71～74、80～81、84～85、89、99、138、144、505～506、508、514～515、518、520、522～523及び528の処理においては死虫

10

20

30

40

50

率 95%以上を示した。

【0485】

試験例 11

本発明化合物 1、5、8、15～16、19、23、25～27、30、37、40、49、61、63、99 及び 516 の各々 2 mg をスクリー管（マルエム No. 5；27×55 mm）に量り取りアセトン 0.2 mL を加えて蓋をし溶解した。スクリー管を回転・反転させ内壁全体に均一になるよう薬液をコーティングした。蓋を取り約 2 時間風乾させた後、フタトゲチマダニ（*Haemaphysalis longicornis*）未吸血若ダニ 1 群 5 頭を放し蓋をした。2 日後に致死数を調査し、以下の計算式で死虫率を算出した。

$$\text{死虫率（\%）} = 100 \times (\text{死亡マダニ数} / \text{供試マダニ数})$$

その結果、本発明化合物 1、5、8、15～16、19、23、25～27、30、37、40、49、61、63、99 及び 516 の処理においては死虫率 100%を示した。

【産業上の利用可能性】

【0486】

本発明化合物は、有害生物に対して防除効力を有し、有害生物防除剤の有効成分として有用である。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 513/04	(2006.01)	A 0 1 P 7/04	
A 6 1 K 31/444	(2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 7 Z
A 6 1 K 31/4439	(2006.01)	C 0 7 D 513/04	3 4 3
A 6 1 P 33/14	(2006.01)	A 6 1 K 31/444	
		A 6 1 K 31/4439	
		A 6 1 P 33/14	

(72)発明者 伊藤 舞衣
兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号 住友化学株式会社内

(72)発明者 岩田 淳
東京都中央区新川二丁目 2 7 番 1 号 住友化学株式会社内

(72)発明者 野倉 吉彦
兵庫県宝塚市高司四丁目 2 番 1 号 住友化学株式会社内

F ターム (参考) 4C063 AA01 BB01 CC26 DD12 EE01 EE03
4C065 AA04 BB06 CC01 DD03 EE02 HH03 JJ01 JJ02 JJ09 KK09
KK10 LL01 PP12
4C072 AA01 BB02 CC02 CC16 EE13 FF07 GG01 GG10 HH07 UU01
UU02
4C086 AA01 AA02 AA03 BC39 CB05 CB27 GA07 GA08 MA01 MA04
NA14 ZB37
4H011 AC01 AC04 BA01 BB08 BB10 BC01 BC02 BC03 BC06 BC19
BC20 DA02 DA10 DA15 DA16 DA21 DC05 DC06 DD03 DH02