

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2017-512191

(P2017-512191A)

(43) 公表日 平成29年5月18日 (2017.5.18)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z	4 C 0 5 5
C 0 7 D 498/04 (2006.01)	C 0 7 D 498/04 1 0 5	4 C 0 6 5
A 6 1 K 31/519 (2006.01)	A 6 1 K 31/519	4 C 0 7 2
A 6 1 K 31/444 (2006.01)	A 6 1 K 31/444	4 C 0 8 6
A 6 1 P 33/00 (2006.01)	A 6 1 P 33/00	4 H 0 1 1
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 150 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2016-552278 (P2016-552278)
 (86) (22) 出願日 平成27年2月5日 (2015.2.5)
 (85) 翻訳文提出日 平成28年10月12日 (2016.10.12)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2015/052351
 (87) 国際公開番号 W02015/121136
 (87) 国際公開日 平成27年8月20日 (2015.8.20)
 (31) 優先権主張番号 14155372.7
 (32) 優先日 平成26年2月17日 (2014.2.17)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(71) 出願人 507203353
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ
 ンゲゼルシャフト
 ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム・アム
 ・ライン、アルフレート・ノベール・シュト
 ラーセ・5 0
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢敦
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝

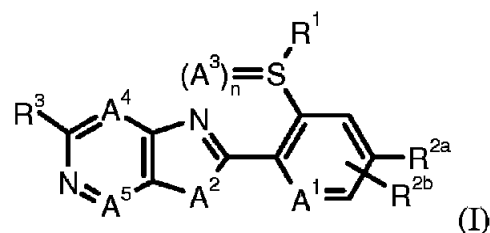
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての2- (ヘタ) アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体

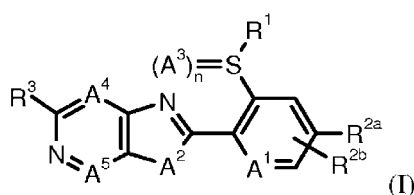
(57) 【要約】

本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、本明細書中において示されている意味を有する] で表される新規化合物、害虫を防除するための殺ダニ剤及び／又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを製造するための方法及び中間体生成物に関する。

【化1】



(I)



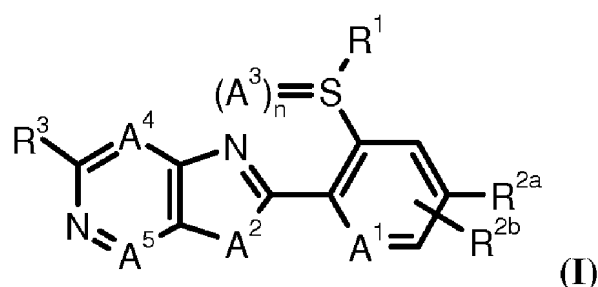
(I)

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

〔式中、

A¹ は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；A² は、-N-R⁵、酸素又は硫黄であり；A³ は、酸素であり；A⁴ は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；A⁵ は、=C-Hであり；

20

R¹ は、(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキル、(C₁-C₆) シアノアルキル、(C₂-C₆) ヒドロキシアルキル、(C₁-C₆) アルコキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルコキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルケニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルケニル、(C₂-C₆) シアノアルケニル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルキニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルキニル、(C₂-C₆) シアノアルキニル、(C₃-C₈) シクロアルキル、(C₃-C₈) シクロアルキル-(C₃-C₈) シクロアルキル、(C₁-C₆) アルキル-(C₃-C₈) シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈) シクロアルキル、アミノ、(C₁-C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆) アルキルアミノ、(C₃-C₈) シクロアルキルアミノ、(C₁-C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁-C₆) アルキルチオ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキルチオ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルスルフィニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキルスルフィニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルスルホニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキルスルホニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルコキシ-(C₁-C₆) アルキルチオ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルコキシ-(C₁-C₆) アルキルスルフィニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルコキシ-(C₁-C₆) アルキルスルホニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルカルボニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキルカルボニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルコキシカルボニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルアミノスルホニル-(C₁-C₆) アルキル、ジ(C₁-C₆) アルキルアミノスルホニル-(C₁-C₆) アルキルであり；又は、

30

40

(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₃-C₈) シクロアルキル〔ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されており、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ独立し

50

て、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィミノー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィミノー $(C_2 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノー $(C_2 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_3 - C_6)$ トリアルキルシリル又はベンジルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよい]であり；又は、

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシリル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィミノー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィミノー $(C_2 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノー $(C_2 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_3 - C_6)$ トリアルキルシリル、 $(=O)$ (ヘテロシリルの場合のみ) 又は $(=O)_2$ (ヘテロシリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は多置換されている] であり；

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、 SCN 、トリー $(C_1 - C_6)$ アルキルシリル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルー $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルー $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_8)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニルー $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニルー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルキニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニルー $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシー $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルー $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルー $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシー $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシー $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニルー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシー $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルー $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル

アミノチオカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、($C_2 - C_6$) アルケニルアミノカルボニル、ジ ($C_2 - C_6$) -アルケニルアミノカルボニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ、 $NHCO - (C_1 - C_6)$ アルキル ($(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニルアミノ) であり；

アリール又はヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されており、その際、(ヘタリールの場合には) 少なくとも 1 のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、 SCN 、トリ- ($C_1 - C_6$) アルキルシリル、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) シアノアルキル、($C_1 - C_6$) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル- ($C_1 - C_6$) -アルコキシ、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) アルケニル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) シアノアルキニル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_6$) シアノアルコキシ、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_1 - C_6$) アルキルヒドロキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキル- ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) ハロアルキル- ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、($C_1 - C_6$) アルキルチオ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルオキシ、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、($C_2 - C_6$) アルケニルアミノカルボニル、ジ ($C_2 - C_6$) -アルケニルアミノカルボニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ] であり；

R^5 は、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキル、($C_1 - C_6$) シアノアルキル、($C_1 - C_6$) ヒドロキシアルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) アルケニル、($C_2 - C_6$) アルケニルオキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニルオキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_2 - C_6$) アルキニルオキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニルオキシ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) シアノアルキニル、($C_2 - C_6$)

10

20

30

40

50

$C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル- ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキル- ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、ハロ ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキルチオ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキルチオ- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ- ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、アミノカルボニル- ($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ- ($C_1 - C_6$) アルキル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ- ($C_1 - C_6$) アルキル又は ($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ- ($C_1 - C_6$) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 である]

で表される化合物。

【請求項 2】

A¹ が、窒素、=N⁺-O⁻ 又は =C-R⁴ であり；

A² が、-N-R⁵、酸素又は硫黄であり；

A³ が、酸素であり；

A⁴ が、窒素、=N⁺-O⁻ 又は =C-R⁴ であり；

A⁵ が、=C-H であり；

R¹ が、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ヒドロキシアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) シアノアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) アルケニルオキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニルオキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニル、($C_2 - C_4$) シアノアルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_2 - C_4$) アルキニルオキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニルオキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニル、($C_2 - C_4$) シアノアルキニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルキル- ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、ハロ ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、ジ ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、($C_3 - C_6$) シクロアルキルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルカルボニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルアミノであり；又は、

($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように 1 置換又は 2 置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_3 - C_4$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル

10

20

30

40

50

ノで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり;又は、

R¹が、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、(C₁-C₄)アルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)-アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィミノ、(C₁-C₄)アルキルスルホキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₃-C₄)トリアルキルシリル、(=O)(ヘテロシクリルの場合のみ)又は(=O)₂(ヘテロシクリルの場合のみ)で同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり;

R^{2a}、R^{2b}、R³及びR⁴が、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ-(C₁-C₄)アルキルシリル、(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₃-C₆)シクロアルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル-(C₃-C₆)シクロアルキル、ハロ(C₃-C₆)シクロアルキル、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルオキシ、(C₁-C₄)アルキルカルボニル、(C₁-C₄)ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノカルボニル、(C₁-C₄)アルキルスルホニルアミノ、(C₁-C₄)アルキルアミノ、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁-C₄)アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、NHCO-(C₁-C₄)アルキル((C₁-C₄)アルキルカルボニルアミノ)であり;

フェニル又はヘタリール[ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように1置換又は2置換されており、その際、(ヘタリールの場合には)少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである:シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)ハロアルキル、(C₁-C₄)シアノアルキル、(C₁-C₄)ヒドロキシアルキル、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルキル、(C₂-C₄)アルケニル、(C₂-C₄)ハロアルケニル、(C₂-C₄)シアノアルケニル、(C₂-C₄)アルキニル、(C₂-C₄)ハロアルキニル、(C₂-C₄)シアノアルキニル、(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)ハロアルコキシ、(C₁-C₄)シアノアルコキシ、(C₁-C₄)アルコキシ-(C₁-C₄)アルコキシ、(C₁-C₄)アルキルヒドロキシイミノ、(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)ハロアルキル-(C₁-C₄)アルコキシイミノ、(C₁-C₄)アルキルチオ、(C₁-C₄)ハロアルキルチオ、(C₁-C₄)アルキルチオ-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルフィニル、(C₁-C₄)アルキルスルフィニル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキルスルホニル、(C₁-C₄)ハロアルキルスルホ

10

20

30

40

50

ニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル] であり；

R^5 が、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニルオキシ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニルオキシ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニルオキシ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル— $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル— $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ— $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル— $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

n が、0、1 又は 2 である；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 3】

A^1 が、窒素又は $=C-R^4$ であり；

A^2 が、 $-N-R^5$ 又は酸素であり；

A^3 が、酸素であり；

A^4 が、窒素又は $=C-R^4$ であり；

A^5 が、 $=C-H$ であり；

R^1 が、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル— $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル— $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；又は、

$(C_1 - C_4)$ アルキル [ここで、該アルキルは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルで 1 置換されていてもよく、その際、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルは、それぞれ、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル又は $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルで同じように又は異なるように 1 置換又は 2 置換されていてもよい] であり；又は、

R^1 が、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル又は $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルで同じように又は異なるように 1 置換又は 2 置換されていてもよい] であり；

R^{2a} が、水素、シアノ、アミノカルボニル、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $($

$C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル又は($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニルであり；

R^{2b} が、水素、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、 $NHCO - (C_1 - C_4)$ アルキル又はハロゲンであり；

R^3 が、水素、ハロゲン、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニルであるか、又は、フェニル、ピラゾリル若しくはイミダゾリル[ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで1置換されている]であり；

R^4 が、水素、ハロゲン、シアノ又は($C_1 - C_3$) アルキルであり；

R^5 が、($C_1 - C_4$) アルキル又は($C_1 - C_4$) アルコキシ- ($C_1 - C_4$) アルキルであり；

n が、0、1又は2である；

請求項1に記載の式(I)で表される化合物。

【請求項4】

A^1 が、窒素又は $=C - R^4$ であり；

A^2 が、 $-N - R^5$ 又は酸素であり；

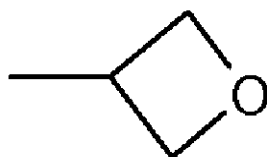
A^3 が、酸素であり；

A^4 が、窒素又は $=C - H$ であり；

A^5 が、 $=C - H$ であり；

R^1 が、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、シクロプロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、 $tert$ -ブチル、シクロブチル、ヒドロキシエチル($-CH_2 - CH_2 - OH$)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、 $-(CH_2)_2 - S - C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2 - SO_2 - C_2H_5$ 又は

【化2】



であり；

R^{2a} が、水素、シアノ、アミノカルボニル($CONH_2$)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} が、水素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、メチルカルボニルアミノ($NHCO$ -メチル)、フッ素又は塩素であり；

R^3 が、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであるか、又は、フェニル、ピラゾール-1-イル若しくはイミダゾール

－1－イル [ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで 1 置換されていてもよい] であり；

R^4 が、水素、フッ素、塩素、臭素又はシアノであり；

R^5 が、メチル、エチル、*i*－プロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

n が、0、1 又は 2 である；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 5】

A^1 が、窒素 (N) 又は $=C-H$ であり；

A^2 が、 $-N-CH_3$ 又は酸素 (O) であり；

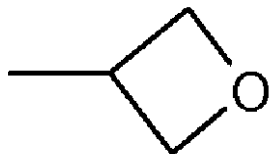
A^3 が、酸素であり；

A^4 が、窒素 (N) 又は $=C-H$ であり；

A^5 が、 $=C-H$ であり；

R^1 が、メチル、エチル、*n*－プロピル、*i*－プロピル、シクロプロピル、*n*－ブチル、*i*－ブチル、*tert*－ブチル、シクロブチル、ヒドロキシエチル ($-CH_2-CH_2-OH$)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 又は

【化 3】



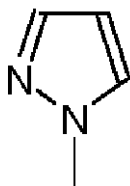
(オキセタン－3－イル) であり；

R^{2a} が、水素、シアノ、アミノカルボニル ($CONH_2$)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} が、水素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、メチルカルボニルアミノ ($NHCO$ －メチル)、フッ素又は塩素であり；

R^3 が、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであるか、又は、フェニル、

【化 4】



(ピラゾール－1－イル) 若しくは

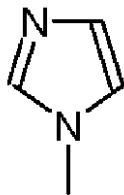
10

20

30

40

【化 5】



(イミダゾール-1-イル) [ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで 1 置換されていてもよい] であり； 10

n が、0、1 又は 2 である；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 6】

A¹ が、窒素 (N) 又は =C-H であり；

A² が、-N-CH₃ 又は酸素 (O) であり；

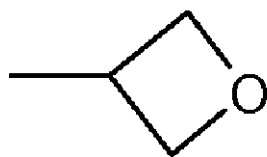
A³ が、酸素であり；

A⁴ が、窒素 (N) 又は =C-H であり；

A⁵ が、C-H であり；

R¹ が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、トリフルオロメチル、-CH₂-CH₂-F、-CH₂-CH₂-OH、-(CH₂)₂-S-C₂H₅、-(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅ 又は 20

【化 6】



30

であり；

R^{2a} が、水素、トリフルオロメチル、シアノ、CONH₂、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} が、水素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ又はNHCOCH₃であり；

R³ が、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチル、塩素、4-CF₃ (C₆H₄)、4-(CF₃)ピラゾール-1-イル、3-(CF₃)ピラゾール-1-イル又は4-(CF₃)イミダゾール-1-イルであり；

n が、0、1 又は 2 である；

請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 7】

40

R¹、R^{2a}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵ 及び n が、それぞれ、請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかで定義されている通りであり；及び、

R^{2b} が、アセチル、アミノ、SCN、トリ- (C₁-C₆) アルキルシリル、(C₃-C₈) シクロアルキル、(C₃-C₈) シクロアルキル- (C₃-C₈) シクロアルキル、(C₁-C₆) アルキル (C₃-C₈) シクロアルキル、ハロ (C₃-C₈) シクロアルキル、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) ハロアルケニル、(C₂-C₆) シアノアルケニル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) ハロアルキニル、(C₂-C₆) シアノアルキニル、(C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) ハロアルコキシ、(C₁-C₆) アルコキシカルボニル- (C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルコキシ- (C₁-C₆) アルコキシ、(C₁-C₆) アルキルヒドロキシイミノ、(C 50

C_1-C_6 ）アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルコキシイ
 ノ、 (C_1-C_6) ハロアルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) ア
 ルキルチオ、 (C_1-C_6) ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6)
 C_6 ）アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) ハロアルキル
 スルフィニル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6)
 C_6 ）アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6)
 C_6 ）アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル
 オキシ、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルチオカルボニル、
 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルオキシ、
 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) ハロアルコキシカルボニル、アミノ
 カルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノ
 チオカルボニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6) ア
 ルキルアミノチオカルボニル、 (C_2-C_6) アルケニルアミノカルボニル、ジ- $(C_2-$
 $C_6)$ -アルケニルアミノカルボニル、 (C_3-C_8) シクロアルキルアミノカルボニ
 ル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- $(C_1-$
 $C_6)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノスルホ
 ニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホキ
 シイミノ、アミノチオカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、ジ-
 (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、 (C_3-C_8) シクロアルキルアミノ、
 $NHCO-(C_1-C_6)$ アルキル (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノ）であり
 ;

いずれの場合にも同じように又は異なるように1回又は複数回置換されていてもよいヘ
 タリアル[ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可
 能な置換基はいずれの場合にも以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニ
 トロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_6) アルキルシリル
 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキル、 (C_1-C_6) シアノアルキ
 (C_1-C_6) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル- (C_1-C_6) -アル
 コキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6)
 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) ハ
 ロアルケニル、 (C_2-C_6) シアノアルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、 $(C_2-$
 $C_6)$ ハロアルキニル、 (C_2-C_6) シアノアルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、
 (C_1-C_6) ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) シアノアルコキシ、 (C_1-C_6) アル
 コキシカルボニル- (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6)
 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルヒドロキシイミノ、 (C_1-C_6) アルコキシ
 イミノ、 (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) ハ
 ロアルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 $(C_1-$
 $C_6)$ ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルチオ、
 (C_1-C_6) アルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルフィ
 ニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルコキシ- $(C_1-$
 $C_6)$ アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) ア
 ルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルホニル、
 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキ
 ルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルオキシ、
 (C_1-C_6) アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル、 (C_1-C_6)
 (C_1-C_6) アルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6)
 ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニ
 ル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、 (C_2-C_6) アルケニルアミノカ
 ルボニル、ジ- (C_2-C_6) -アルケニルアミノカルボニル、 (C_3-C_8) シクロア
 ルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_6) ア
 ルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_6)

アルキルアミノスルホニル、ジ- ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシミノ、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、ジ- ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ] である；

請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかに記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 8】

R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n が、それぞれ、請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかで定義されている通りであり；及び、

R^{2b} が、アセチル、アミノ、SCN、トリ- ($C_1 - C_4$) アルキルシリル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル- ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルキル ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、ハロ ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニル、($C_2 - C_4$) シアノアルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニル、($C_2 - C_4$) シアノアルキニル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルコキシ- ($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルヒドロキシミノ、($C_1 - C_4$) アルコキシミノ、($C_1 - C_4$) アルキル- ($C_1 - C_4$) アルコキシミノ、($C_1 - C_4$) ハロアルキル- ($C_1 - C_4$) アルコキシミノ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノカルボニル、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノスルホニル、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、 $NHCO - (C_1 - C_4)$ アルキル ($(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルアミノ) であり；

いずれの場合にも同じように又は異なるように 1 回又は 2 回置換されているヘタリール [ここで、少なくとも 1 のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基はいずれの場合にも以下のものである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) シアノアルキル、($C_1 - C_4$) ヒドロシアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニル、($C_2 - C_4$) シアノアルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニル、($C_2 - C_4$) シアノアルキニル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ、($C_1 - C_4$) シアノアルコキシ、($C_1 - C_4$) アルコキシ- ($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_1 - C_4$) アルキルヒドロキシミノ、($C_1 - C_4$) アルコキシミノ、($C_1 - C_4$) アルキル- ($C_1 - C_4$) アルコキシミノ、($C_1 - C_4$) ハロアルキル- ($C_1 - C_4$) アルコキシミノ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル- ($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルオキシ、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノカルボニル、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノカルボニル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、アミノスルホニル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノスルホニル、ジ- ($C_1 - C_4$) アルキルアミノスルホニル] である；

請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかに記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 9】

R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n が、それぞれ、請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかで定義されている通りであり；及び、

R^{2b} が、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ又は $NHCO - (C_1 - C_4)$ アルキルである；
請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかに記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 10】

R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n が、それぞれ、請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかで定義されている通りであり；及び、

R^{2b} が、メトキシ、エトキシ又は $NHCO - \text{メチル}$ である；

請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかに記載の式 (I) で表される化合物。

10

【請求項 11】

R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n が、それぞれ、請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかで定義されている通りであり；及び、

R^{2b} が、メトキシ又は $NHCOCH_3$ である；

請求項 1、2、3、4、5 又は 6 のいずれかに記載の式 (I) で表される化合物。

【請求項 12】

組成物であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物並びに慣習的な増量剤及び／又は界面活性剤を含んでいることを特徴とする、前記組成物。

【請求項 13】

有害生物を防除する方法であって、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 12 に記載の組成物を該有害生物及び／又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とする、前記方法。

20

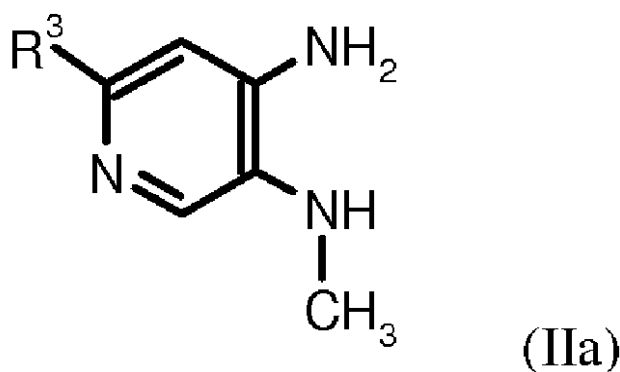
【請求項 14】

有害生物を防除するための、請求項 1 に記載の式 (I) で表される化合物又は請求項 12 に記載の組成物の使用。

【請求項 15】

式 (IIa)

【化 7】



30

〔式中、

R^3 は、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル又は $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニルであり、その際、 R^3 は、 CF_3 又は CHF_2 ではない〕
で表される化合物。

【請求項 16】

R^3 が、 CH_2F 、 C_2H_4F 、 $C_2H_3F_2$ 、 $C_2H_2F_3$ 、 C_2HF_4 、 C_2F_5 、 $n-C_3F_7$ 、 $i-C_3F_7$ 、 OCH_2F 、 SCH_2F 、 $SOCH_2F$ 、 SO_2CH_2F 、 $OCHF_2$ 、 $SCHF_2$ 、 $SOCHF_2$ 、 SO_2CHF_2 、 OCF_3 、 OCF_2Cl

50

、 OCFCI_2 、 SCF_3 、 SO CF_3 、 SO_2CF_3 、 $\text{OC}_2\text{H}_4\text{F}$ 、 $\text{SC}_2\text{H}_4\text{F}$ 、 $\text{SOC}_2\text{H}_4\text{F}$ 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_4\text{F}$ 、 $\text{OC}_2\text{H}_3\text{F}_2$ 、 $\text{SC}_2\text{H}_3\text{F}_2$ 、 $\text{SOC}_2\text{H}_3\text{F}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_3\text{F}_2$ 、 $\text{OC}_2\text{H}_2\text{F}_3$ 、 $\text{SC}_2\text{H}_2\text{F}_3$ 、 $\text{SOC}_2\text{H}_2\text{F}_3$ 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_2\text{F}_3$ 、 OC_2HF_4 、 SC_2HF_4 、 SOC_2HF_4 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{HF}_4$ 、 OC_2F_5 、 SC_2F_5 、 SOC_2F_5 、 $\text{SO}_2\text{C}_2\text{F}_5$ 、 $n\text{-OC}_3\text{F}_7$ 、 $n\text{-SC}_3\text{F}_7$ 、 $n\text{-SOC}_3\text{F}_7$ 、 $n\text{-SO}_2\text{C}_3\text{F}_7$ 、 $i\text{-OC}_3\text{F}_7$ 、 $i\text{-SC}_3\text{F}_7$ 、 $i\text{-SOC}_3\text{F}_7$ 又は $i\text{-SO}_2\text{C}_3\text{F}_7$ である；

請求項15に記載の式(I I a)で表される化合物。

【請求項17】

R^3 が、 CH_2F 、 OCF_3 、 $\text{C}_2\text{H}_4\text{F}$ 、 $\text{C}_2\text{H}_3\text{F}_2$ 、 $\text{C}_2\text{H}_2\text{F}_3$ 、 C_2HF_4 、 C_2F_5 、 SCF_3 、 SO CF_3 又は SO_2CF_3 である；

請求項15に記載の式(I I a)で表される化合物。

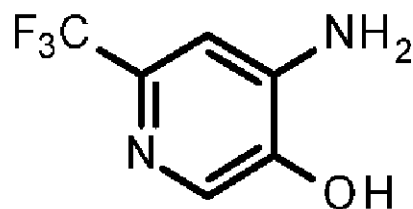
【請求項18】

R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、実施例I-1～実施例I-77において定義されているとおりである、請求項1に記載の式(I)で表される化合物。

【請求項19】

式(I I-02)

【化8】



で表される化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式(I)で表される新規2-(ヘタ)アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体、害虫(animal pest)を防除するための、特に、節足動物(とりわけ、昆虫類及びクモ形類動物)を防除するための、殺ダニ剤及び／又は殺虫剤としてのそれらの使用、並びに、それらを調製するための調製方法及び中間体に関する。

【0002】

殺虫特性を有している2-(ヘタ)アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体は、文献中に、例えば、WO 2010/125985、WO 2012/074135、WO 2012/086848、WO 2013/018928、WO 2014/142292及びWO 2014/148451、並びに、さらに、WO 2015/000715などの中に、既に記載されている。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】国際特許出願公開第2010/125985号

【特許文献2】国際特許出願公開第2012/074135号

【特許文献3】国際特許出願公開第2012/086848号

【特許文献4】国際特許出願公開第2013/018928号

【特許文献 5】国際特許出願公開第 2014/142292 号

【特許文献 6】国際特許出願公開第 2014/148451 号

【特許文献 7】国際特許出願公開第 2015/000715 号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

しかしながら、上記で引用されてい文献によって既に知られている活性成分は、狭い適用範囲しか示さないという理由で、又は、十分な殺虫活性若しくは殺ダニ活性を有していないという理由で、施用において幾つか不利点を有している。

【課題を解決するための手段】

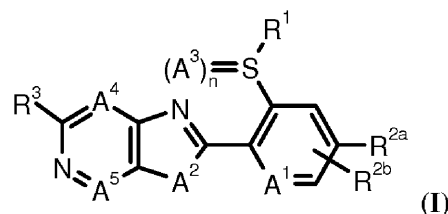
【0005】

新規 2-（ヘタ）アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体が見いだされ、そして、これらは、既に知られている化合物よりも有利点を有している。そのような有利点の例は、より良好な生物学的特性又は環境に関する特性、より広い範囲の施用方法、向上した殺虫活性又は殺ダニ活性、及び、さらに、作物植物との良好な適合性である。該 2-（ヘタ）アリール置換縮合二環式ヘテロ環誘導体は、効力（特に、防除が困難な昆虫類に対する効力）を向上させるための別の作用剤と組合せて使用することが可能である。

【0006】

従って、本発明は、式（I）

【化 1】



【0007】

〔式中、

A¹ は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

A² は、-N-R⁵、酸素又は硫黄であり；

A³ は、酸素、=N-H又は=N-CNであり；

A⁴ は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

A⁵ は、窒素、=N⁺-O⁻又は=C-R⁴であり；

R¹ は、(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキル、(C₁-C₆) シアノアルキル、(C₁-C₆) ヒドロキシアルキル、(C₁-C₆) アルコキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルコキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) アルケニル、(C₂-C₆) アルケニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルケニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルケニル、(C₂-C₆) シアノアルケニル、(C₂-C₆) アルキニル、(C₂-C₆) アルキニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルキニルオキシ-(C₁-C₆) アルキル、(C₂-C₆) ハロアルキニル、(C₂-C₆) シアノアルキニル、(C₃-C₈) シクロアルキル、(C₃-C₈) シクロアルキル-(C₃-C₈) シクロアルキル、(C₁-C₆) アルキル-(C₃-C₈) シクロアルキル、ハロ(C₃-C₈) シクロアルキル、アミノ、(C₁-C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁-C₆) アルキルアミノ、(C₃-C₈) シクロアルキルアミノ、(C₁-C₆) アルキルカルボニルアミノ、(C₁-C₆) アルキルチオ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキルチオ-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) アルキルスルフィニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁-C₆) ハロアルキルスルフィニル-(C₁-C₆) アルキル、(C₁

$-C_6$) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) ハロアルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル- (C_1-C_6) アルキルであり；又は、

(C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルコキシ、(C_2-C_6) アルケニル、(C_2-C_6) アルキニル、(C_3-C_8) シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されており、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、(C_1-C_6) アルキル、(C_3-C_6) シクロアルキル、(C_1-C_6) アルコキシ、(C_1-C_6) ハロアルキル、(C_1-C_6) ハロアルコキシ、(C_1-C_6) アルキルチオ、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) アルキルスルホニル、(C_1-C_6) アルキルスルフィミノ、(C_1-C_6) アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルフィミノ- (C_2-C_6) アルキルカルボニル、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6) アルキルカルボニル、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル、(C_1-C_6) アルキルカルボニル、(C_3-C_6) トリアルキルシリル又はベンジルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されている] であり；又は、

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C_1-C_6) アルキル、(C_3-C_8) シクロアルキル、(C_1-C_6) -アルコキシ、(C_1-C_6) ハロアルキル、(C_1-C_6) ハロアルコキシ、(C_1-C_6) アルキルチオ、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) アルキルスルホニル、(C_1-C_6) アルキルスルフィミノ、(C_1-C_6) アルキルスルフィミノ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルフィミノ- (C_2-C_6) アルキルカルボニル、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ- (C_2-C_6) アルキルカルボニル、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル、(C_1-C_6) アルキルカルボニル、(C_3-C_6) トリアルキルシリル、($=O$) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は ($=O$)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は多置換されている] であり；

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_6) アルキルシリル、(C_3-C_8) シクロアルキル、(C_3-C_8) シクロアルキル- (C_3-C_8) シクロアルキル、(C_1-C_6) アルキル- (C_3-C_8) シクロアルキル、ハロ (C_3-C_8) シクロアルキル、(C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) ハロアルキル、(C_1-C_6) シアノアルキル、(C_1-C_6) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル- (C_1-C_6) -アルコキシ、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、(C_2-C_6) アルケニル、(C_2-C_6) ハロアルケニル、(C_2-C_6) シアノアルケニル、(C_2-C_6) アルキニル、(C_2-C_6) ハロアルキニル、(C_2-C_6) シアノアルキニル、(C_1-C_6) アルコキシ、(C_1-C_6) ハロアルコキシ、(C_1-C_6) シアノアルコキシ、(

$C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルコキシ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルコキシ、 ($C_1 - C_6$) アルキルヒドロキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキル - ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、 ($C_1 - C_6$) アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルオキシ、 ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルチオカルボニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルオキシ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル、 アミノカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、 ($C_2 - C_6$) アルケニルアミノカルボニル、ジ ($C_2 - C_6$) - アルケニルアミノカルボニル、 ($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルアミノ、 ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ、アミノスルホニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノスルホニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノチオカルボニル、 ($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノであり；

アリール又はヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されており、その際、(ヘタリールの場合には) 少なくとも 1 のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ - ($C_1 - C_6$) アルキルシリル、 ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキル、 ($C_1 - C_6$) シアノアルキル、 ($C_1 - C_6$) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) - アルコキシ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_2 - C_6$) アルケニル、 ($C_2 - C_6$) ハロアルケニル、 ($C_2 - C_6$) シアノアルケニル、 ($C_2 - C_6$) アルキニル、 ($C_2 - C_6$) ハロアルキニル、 ($C_2 - C_6$) シアノアルキニル、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ、 ($C_1 - C_6$) ハロアルコキシ、 ($C_1 - C_6$) シアノアルコキシ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル - ($C_1 - C_6$) アルコキシ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルコキシ、 ($C_1 - C_6$) アルキルヒドロキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) アルキル - ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキル - ($C_1 - C_6$) アルコキシイミノ、 ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルチオ、 ($C_1 - C_6$) アルキルチオ - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル、 ($C_1 - C_6$) アルコキシ - ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル - ($C_1 - C_6$) アルキル、 ($C_1 - C_6$) アルキルスルホニルオキシ、 ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルカルボニルオキシ、 ($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル、 ($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、ジ ($C_1 - C_6$) アルキルアミノカルボニル、 ($C_2 - C_6$) アルケニルアミノカルボニル、ジ ($C_2 - C_6$) - アルケニ

10

20

30

40

50

ルアミノカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニルアミノ、(C₁ - C₆) アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノスルホニル、(C₁ - C₆) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノチオカルボニル、(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノ] であり；

R⁵ は、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキル、(C₁ - C₆) シアノアルキル、(C₁ - C₆) ヒドロキシアルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルコキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) アルケニル、(C₂ - C₆) アルケニルオキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) ハロアルケニルオキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) ハロアルケニル、(C₂ - C₆) シアノアルケニル、(C₂ - C₆) アルキニル、(C₂ - C₆) アルキニルオキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) ハロアルキニルオキシ(C₁ - C₆) アルキル、(C₂ - C₆) ハロアルキニル、(C₂ - C₆) シアノアルキニル、(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₃ - C₈) シクロアルキル(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキル(C₃ - C₈) シクロアルキル、ハロ(C₃ - C₈) シクロアルキル、(C₁ - C₆) アルキルチオ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキルチオ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルフィニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルスルホニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキルスルホニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキルチオ(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキルスルフィニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ(C₁ - C₆) アルキルスルホニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルカルボニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルキルカルボニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) ハロアルコキシカルボニル(C₁ - C₆) アルキル、アミノカルボニル(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル、ジ(C₁ - C₆) アルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキル又は(C₃ - C₈) シクロアルキルアミノ(C₁ - C₆) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 であり；

ここで、n = 2 である場合、A³ の意味は、同一でも又は異なってもよい] で表される新規化合物を提供する。

【0008】

さらに、式 (I) で表される化合物が、殺有害生物剤として、好ましくは、殺虫剤及び／又は殺ダニ剤として、極めて優れた効力を有していて、及び、さらに、概して、植物との極めて良好な適合性、特に、作物植物に関して、植物との極めて良好な適合性を示すということが、見いだされた。

【発明を実施するための形態】

【0009】

本発明の化合物は、式 (I) によって概括的に定義される。上記及び下記に記載されている式の中で与えられている好ましい置換基又はラジカルの好ましい範囲について、以下で説明する。

【0010】

A¹ は、好ましくは、窒素、=N⁺ - O⁻ 又は =C - R⁴ であり；

A² は、好ましくは、-N - R⁵、酸素又は硫黄であり；

A³ は、好ましくは、酸素、=N - H 又は =N - CN であり；

A⁴ は、好ましくは、窒素、=N⁺ - O⁻ 又は =C - R⁴ であり；

A⁵ は、好ましくは、窒素、=N⁺ - O⁻ 又は =C - R⁴ であり；

R¹ は、好ましくは、(C₁ - C₄) アルキル、(C₁ - C₄) ハロアルキル、(C₁

10

20

30

40

50

$(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノであり；又は、

$(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル [ここで、これらは、それぞれ、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィミノで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい] であり；又は、

R^1 は、好ましくは、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_3 - C_6)$ トリアルキルシリル、 $(=O)$ (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は $(=O)_2$ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい] であり；

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 及び R^4 は、好ましくは、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- $(C_1 - C_4)$ アルキルシリル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルキニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフ

ィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニルであり；

フェニル又はヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように 1 置換又は 2 置換されており、その際、(ヘタリールの場合には) 少なくとも 1 のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルキニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル] であり；

R^5 は、好ましくは、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

n は、好ましくは、0、1 又は 2 であり；

ここで、 $n = 2$ である場合、 A^3 の意味は、同一でも又は異なってもよい。

【0011】

A¹ は、さらに好ましくは、窒素又は=C-R⁴であり；

A² は、さらに好ましくは、-N-R⁵又は酸素であり；

A³ は、さらに好ましくは、酸素又は=N-Hであり；

A⁴ は、さらに好ましくは、窒素又は=C-R⁴であり；

A⁵ は、さらに好ましくは、窒素又は=C-R⁴であり；

R¹ は、さらに好ましくは、(C₁-C₄) アルキル、(C₁-C₄) ハロアルキル、(C₂-C₄) アルケニル、(C₂-C₄) ハロアルケニル、(C₂-C₄) アルキニル、(C₂-C₄) ハロアルキニル、(C₃-C₆) シクロアルキル、(C₁-C₄) アルキルチオ-(C₁-C₄) アルキル、(C₁-C₄) アルキルスルフィニル-(C₁-C₄) アルキル、(C₁-C₄) アルキルスルホニル-(C₁-C₄) アルキルであり；又は、

(C₁-C₄) アルキル [ここで、該アルキルは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルで

1 置換されていてもよく、その際、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルは、それぞれ、ハロゲン、(C₁-C₄) アルキル又は(C₁-C₄) ハロアルキルで同じように又は異なるように1 置換又は2 置換されていてもよい] であり；又は、

R¹ は、さらに好ましくは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、(C₁-C₄) アルキル又は(C₁-C₄) ハロアルキルで同じように又は異なるように1 置換又は2 置換されていてもよい] であり；

R^{2a} は、さらに好ましくは、水素、ハロゲン、(C₁-C₄) アルキル (C₁-C₄) ハロアルキル、(C₁-C₄) アルキルチオ、(C₁-C₄) アルキルスルフィニル、(C₁-C₄) アルキルスルホニル、(C₁-C₄) ハロアルキルチオ、(C₁-C₄) ハロアルキルスルフィニル又は(C₁-C₄) ハロアルキルスルホニルであり；

R^{2b} は、さらに好ましくは、水素又はハロゲンであり；

R³ は、さらに好ましくは、水素、(C₁-C₄) アルキル (C₁-C₄) ハロアルキル、(C₁-C₄) アルキルチオ、(C₁-C₄) アルキルスルフィニル、(C₁-C₄) アルキルスルホニル、(C₁-C₄) ハロアルキルチオ、(C₁-C₄) ハロアルキルスルフィニル又は(C₁-C₄) ハロアルキルスルホニルであり；

R⁴ は、さらに好ましくは、水素、ハロゲン、シアノ又は(C₁-C₃) アルキルであり；

R⁵ は、さらに好ましくは、(C₁-C₄) アルキル又は(C₁-C₄) アルコキシ-(C₁-C₄) アルキルであり；

n は、さらに好ましくは、0、1又は2であり；

ここで、n=2である場合、A³ の意味は、同一でも又は異なってもよい。

【0012】

A¹ は、一層さらに好ましくは、窒素又は=C-R⁴であり；

A² は、一層さらに好ましくは、-N-R⁵又は酸素であり；

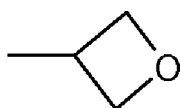
A³ は、一層さらに好ましくは、酸素であり；

A⁴ は、一層さらに好ましくは、窒素又は=C-Hであり；

A⁵ は、一層さらに好ましくは、窒素又は=C-Hであり；

R¹ は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、シクロプロピル、n-ブチル、i-ブチル、tert-ブチル、シクロブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、-(CH₂)₂-S-C

C_2H_5 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{SO}_2-\text{C}_2\text{H}_5$ 又は
【化 2】



,

【0013】

であり；

R^{2a} は、一層さらに好ましくは、水素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

10

R^{2b} は、一層さらに好ましくは、水素、フッ素又は塩素であり；

R^3 は、一層さらに好ましくは、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル又はトリフルオロメチルスルフィニルであり；

R^4 は、一層さらに好ましくは、水素、フッ素、塩素、臭素又はシアノであり；

R^5 は、一層さらに好ましくは、メチル、エチル、*i*-プロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

20

n は、一層さらに好ましくは、0、1 又は 2 である。

【0014】

A^1 は、特に、窒素 (N) 又は $=\text{C}-\text{H}$ であり；

A^2 は、特に、 $-\text{N}-\text{CH}_3$ 又は酸素 (O) であり；

A^3 は、特に、酸素 (O) であり；

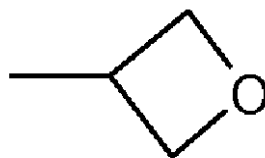
A^4 は、特に、窒素 (N) 又は $=\text{C}-\text{H}$ であり；

A^5 は、特に、 $=\text{C}-\text{H}$ であり；

R^1 は、特に、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、トリフルオロメチル、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{C}_2\text{H}_5$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{SO}_2-\text{C}_2\text{H}_5$ 又は

30

【化 3】



,

【0015】

であり；

40

R^{2a} は、特に、水素、トリフルオロメチル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、特に、水素又は塩素であり；

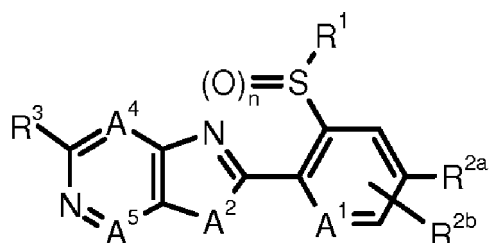
R^3 は、特に、トリフルオロメチルであり；

n は、特に、0、1 又は 2 である。

【0016】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I-A)

【化 4】



【 0 0 1 7 】

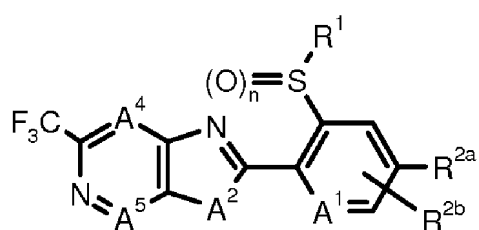
10

で表される化合物に関する。

【 0 0 1 8 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - B)

【化 5】



20

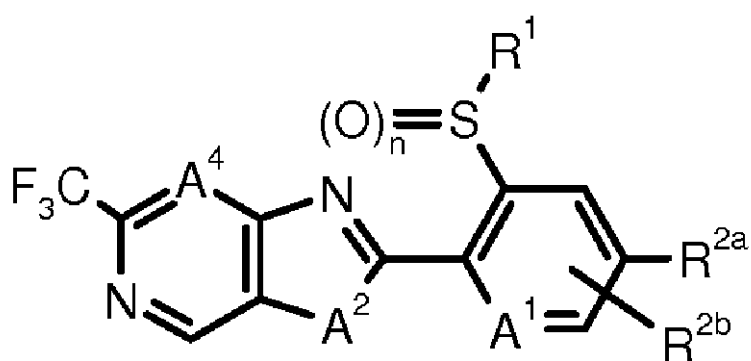
【 0 0 1 9 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 2 0 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - C)

【化 6】



30

【 0 0 2 1 】

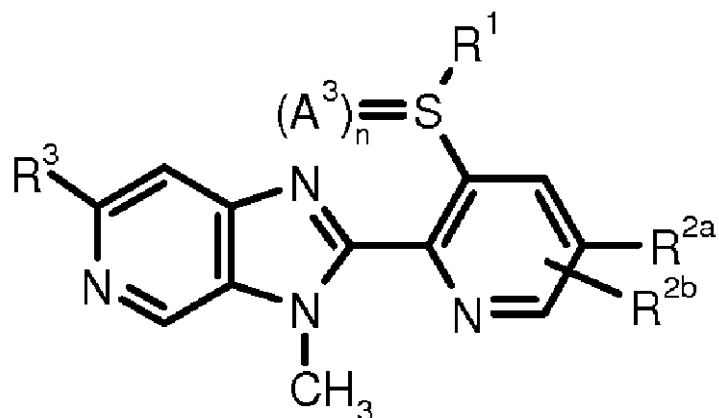
で表される化合物に関する。

40

【 0 0 2 2 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - D)

【化 7】



10

【0023】

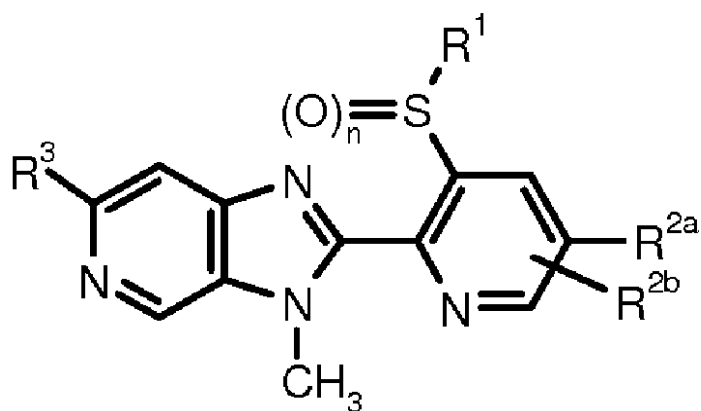
で表される化合物に関する。

【0024】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I-E)

【化 8】

20



30

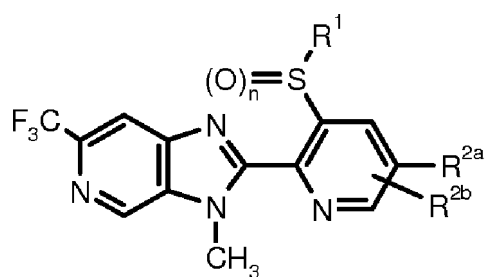
【0025】

で表される化合物に関する。

【0026】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I-F)

【化 9】



40

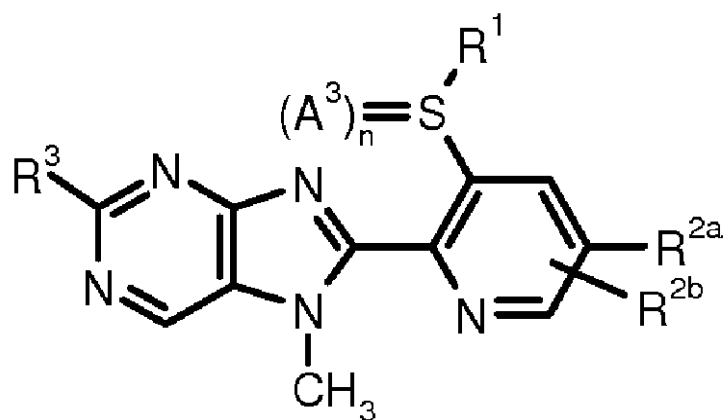
【0027】

で表される化合物に関する。

【0028】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I-G)

【化 1 0】



10

【 0 0 2 9】

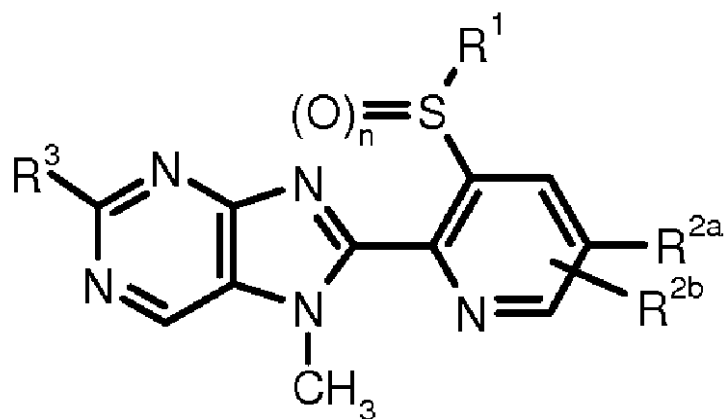
で表される化合物に関する。

【 0 0 3 0】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-H）

【化 1 1】

20



30

【 0 0 3 1】

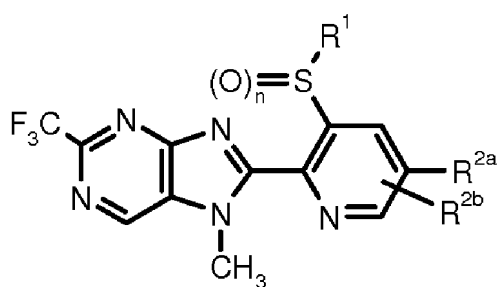
で表される化合物に関する。

【 0 0 3 2】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-I）

【化 1 2】

40



【 0 0 3 3】

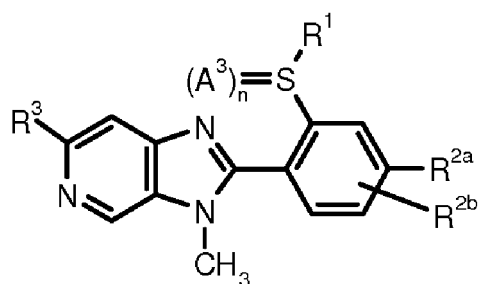
で表される化合物に関する。

【 0 0 3 4】

50

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-J）

【化13】



10

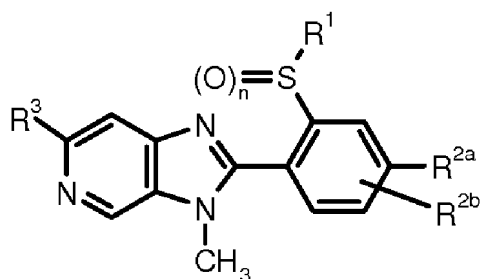
【0035】

で表される化合物に関する。

【0036】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-K）

【化14】



20

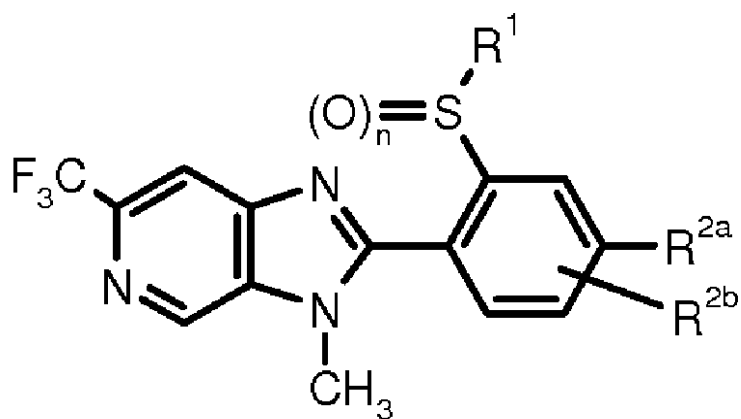
【0037】

で表される化合物に関する。

【0038】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-L）

【化15】



30

40

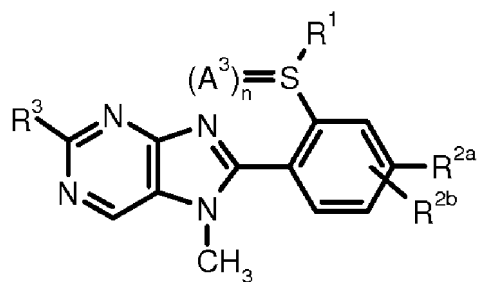
【0039】

で表される化合物に関する。

【0040】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-M）

【化 1 6】



10

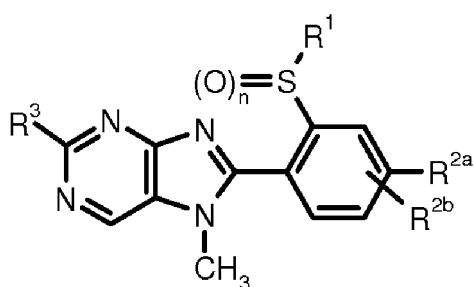
【 0 0 4 1】

で表される化合物に関する。

【 0 0 4 2】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-N）

【化 1 7】



20

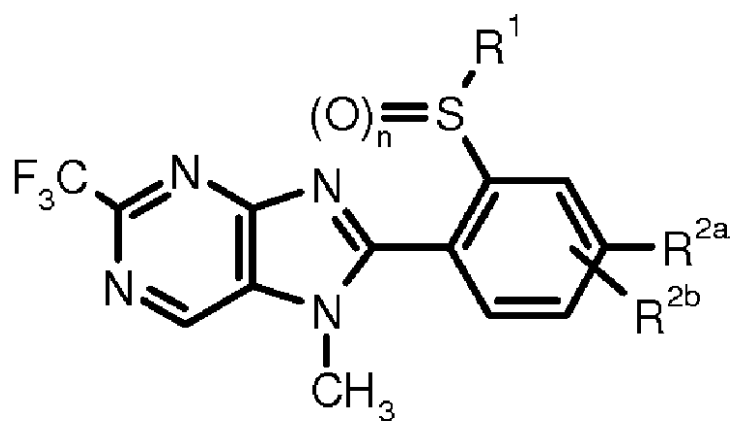
【 0 0 4 3】

で表される化合物に関する。

【 0 0 4 4】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-O）

【化 1 8】



30

40

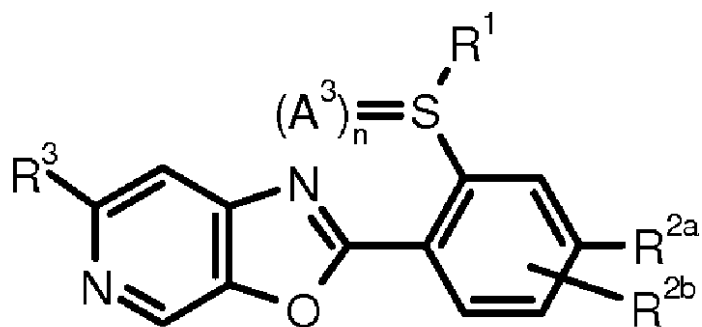
【 0 0 4 5】

で表される化合物に関する。

【 0 0 4 6】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-P）

【化 1 9】



10

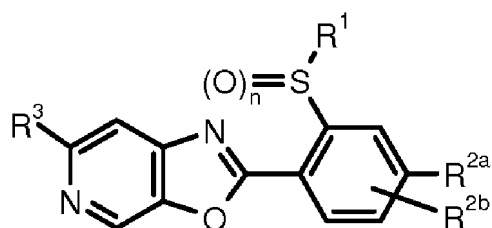
【 0 0 4 7 】

表される化合物に関する。

【 0 0 4 8 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（ I - Q ）

【化 2 0】



20

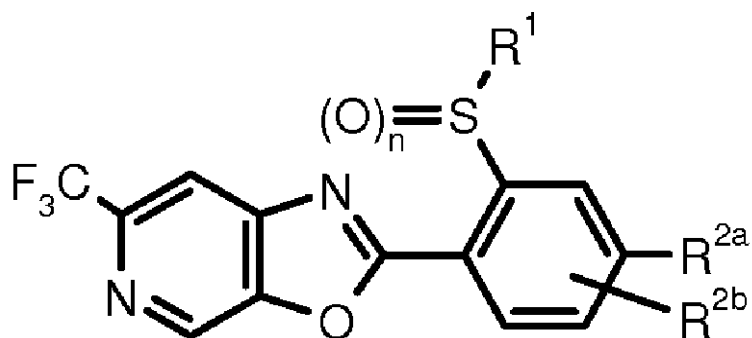
【 0 0 4 9 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 5 0 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（ I - R ）

【化 2 1】



40

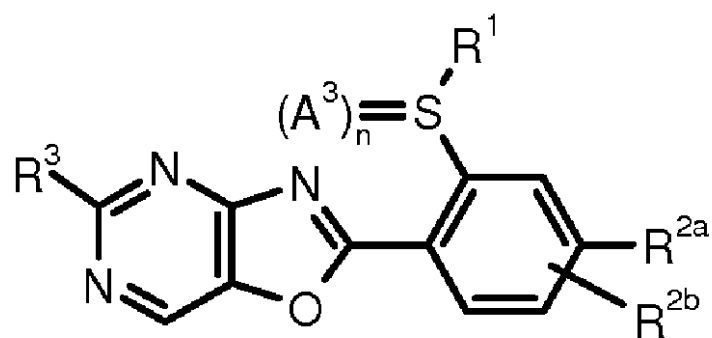
【 0 0 5 1 】

で表される化合物に関する。

【 0 0 5 2 】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（ I - S ）

【化 2 2】



10

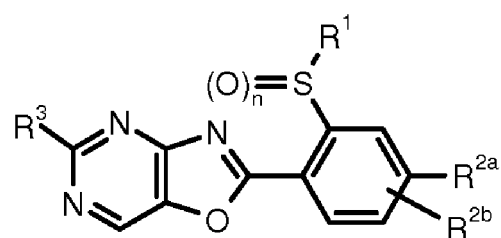
【0053】

で表される化合物に関する。

【0054】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-T）

【化 2 3】



20

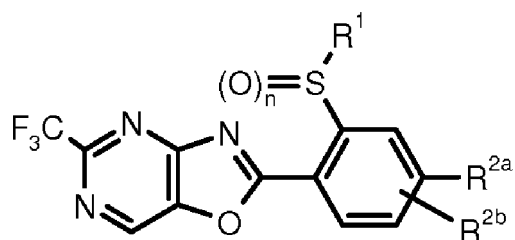
【0055】

で表される化合物に関する。

【0056】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-U）

【化 2 4】



40

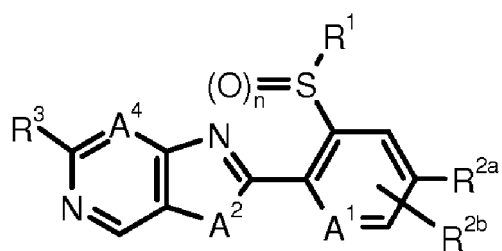
【0057】

で表される化合物に関する。

【0058】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-V）

【化 2 5】



10

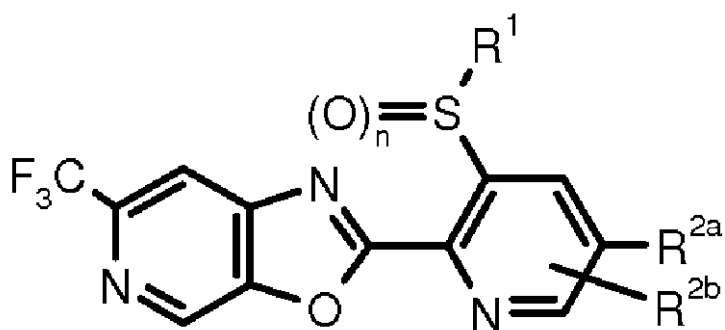
【0059】

で表される化合物に関する。

【0060】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-W）

【化 2 6】



20

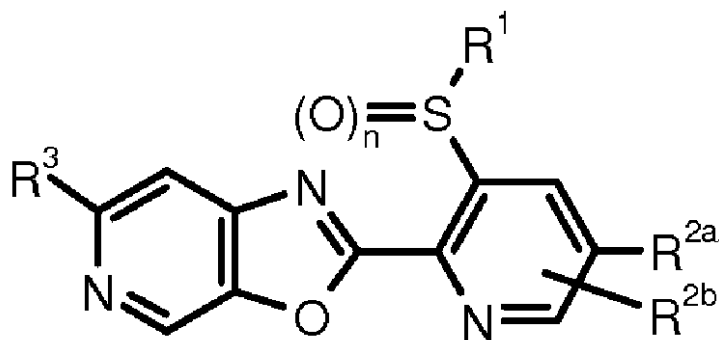
【0061】

で表される化合物に関する。

【0062】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式（I-X）

【化 2 7】



40

【0063】

で表される化合物に関する。

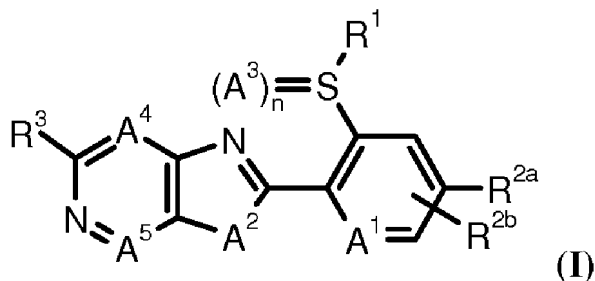
50

【0064】

式（I-A）～式（I-X）において、 R^1 ラジカル、 R^{2a} ラジカル、 R^{2b} ラジカル、 R^3 ラジカル、 A^1 ラジカル、 A^2 ラジカル、 A^3 ラジカル、 A^4 ラジカル、 A^5 ラジカル及び n ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【0065】

さらなる実施形態（構成1）では、本発明は、式（I）
【化28】



10

【0066】

〔式中、

20

A^1 は、窒素、 $=N^+-O^-$ 又は $=C-R^4$ であり；

A^2 は、 $-N-R^5$ 、酸素又は硫黄であり；

A^3 は、酸素であり；

A^4 は、窒素、 $=N^+-O^-$ 又は $=C-R^4$ であり；

A^5 は、 $=C-H$ であり；

R^1 は、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキル、 (C_1-C_6) シアノアルキル、 (C_1-C_6) ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) アルケニルオキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) ハロアルケニルオキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) ハロアルケニル、 (C_2-C_6) シアノアルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、 (C_2-C_6) アルキニルオキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) ハロアルキニルオキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) ハロアルキニル、 (C_2-C_6) シアノアルキニル、 (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_3-C_8) シクロアルキル- (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_1-C_6) アルキル- (C_3-C_8) シクロアルキル、ハロ (C_3-C_8) シクロアルキル、アミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノ、 (C_3-C_8) シクロアルキルアミノ、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノ、 (C_1-C_6) アルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルフィニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルアミノ、アミノスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、ジ (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル- $(C_1$

30

40

50

—C₆) アルキルであり；又は、

いずれの場合にもアリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよい(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルコキシ、(C₂—C₆) アルケニル、(C₂—C₆) アルキニル、(C₃—C₈) シクロアルキル[ここで、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、アミノスルホニル、(C₁—C₆) アルキル、(C₃—C₆) シクロアルキル、(C₁—C₆) アルコキシ、(C₁—C₆) ハロアルキル、(C₁—C₆) ハロアルコキシ、(C₁—C₆) アルキルチオ、(C₁—C₆) アルキルスルフィニル、(C₁—C₆) アルキルスルホニル、(C₁—C₆) アルキルスルフィミノ、(C₁—C₆) アルキルスルフィミノー(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルキルスルフィミノー(C₂—C₆) アルキルカルボニル、(C₁—C₆) アルキルスルホキシイミノ、(C₁—C₆) アルキルスルホキシイミノー(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルキルスルホキシイミノー(C₂—C₆) アルキルカルボニル、(C₁—C₆) アルコキシカルボニル、(C₁—C₆) アルキルカルボニル、(C₃—C₆) トリアルキルシリル又はベンジルで同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよい]であり；又は、

R¹ は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル[ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、カルボキシル、カルバモイル、(C₁—C₆) アルキル、(C₃—C₈) シクロアルキル、(C₁—C₆) —アルコキシ、(C₁—C₆) ハロアルキル、(C₁—C₆) ハロアルコキシ、(C₁—C₆) アルキルチオ、(C₁—C₆) アルキルスルフィニル、(C₁—C₆) アルキルスルホニル、(C₁—C₆) アルキルスルフィミノ、(C₁—C₆) アルキルスルフィミノー(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルキルスルフィミノー(C₂—C₆) アルキルカルボニル、(C₁—C₆) アルキルスルホキシイミノ、(C₁—C₆) アルキルスルホキシイミノー(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルキルスルホキシイミノー(C₂—C₆) アルキルカルボニル、(C₁—C₆) アルコキシカルボニル、(C₁—C₆) アルキルカルボニル、(C₃—C₆) トリアルキルシリル、(=O) (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は(=O)₂ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は多置換されていてもよい]であり；

R^{2a}、R^{2b}、R³ 及び R⁴ は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ—(C₁—C₆) アルキルシリル、(C₃—C₈) シクロアルキル、(C₃—C₈) シクロアルキル—(C₃—C₈) シクロアルキル、(C₁—C₆) アルキル—(C₃—C₈) シクロアルキル、ハロ(C₃—C₈) シクロアルキル、(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) ハロアルキル、(C₁—C₆) シアノアルキル、(C₁—C₆) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル—(C₁—C₆) —アルコキシ、(C₁—C₆) アルコキシカルボニル—(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルコキシ—(C₁—C₆) アルキル、(C₂—C₆) アルケニル、(C₂—C₆) ハロアルケニル、(C₂—C₆) シアノアルケニル、(C₂—C₆) アルキニル、(C₂—C₆) ハロアルキニル、(C₂—C₆) シアノアルキニル、(C₁—C₆) アルコキシ、(C₁—C₆) ハロアルコキシ、(C₁—C₆) シアノアルコキシ、(C₁—C₆) アルコキシカルボニル—(C₁—C₆) アルコキシ、(C₁—C₆) アルコキシ—(C₁—C₆) アルコキシ、(C₁—C₆) アルキルヒドロキシイミノ、(C₁—C₆) アルコキシイミノ、(C₁—C₆) アルキル—(C₁—C₆) アルコキシイミノ、(C₁—C₆) ハロアルキル—(C₁—C₆) アルコキシイミノ、(C₁—C₆) アルキルチオ、(C₁—C₆) ハロアルキルチオ、(C₁—C₆) アルコキシ—(C₁—C₆) アルキルチオ、(C₁—C₆) アルキルチオ—(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルキルスルフィニル、(C₁—C₆) ハロアルキルスルフィニル、(C₁—C₆) アルコキシ—(C₁—C₆) アルキルスルフィニル、(C₁—C₆) アルキルスルフィニル—(C₁—C₆) アルキル、(C₁—C₆) アルキルスルホニル、(C₁—C₆) ハロアルキルスルホニル、(C₁—C₆) アルコキシ—(C₁—C₆) アルキルスルホニル、(C

$C_1 - C_6$) アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルアミノカルボニル、ジ $(C_2 - C_6)$ -アルケニルアミノカルボニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノ、 $NHCO - (C_1 - C_6)$ アルキル $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニルアミノ) であり；

アリール又はヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように 1 置換又は多置換されていてもよく、その際、(ヘタリールの場合には) 少なくとも 1 のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、 SCN 、トリ- $(C_1 - C_6)$ アルキルシリル、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル- $(C_1 - C_6)$ -アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_6)$ アルキニル、 $(C_2 - C_6)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_6)$ シアノアルキニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル- $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキル- $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル- $(C_1 - C_6)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキルカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルカルボニルオキシ、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_2 - C_6)$ アルケニルアミノカルボニル、ジ $(C_2 - C_6)$ -アルケニルアミノカルボニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノスルホニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、ジ $(C_1 - C_6)$ アルキルアミノチオカルボニル、 $(C_3 - C_8)$ シクロアルキルアミノ] であり；

R^5 は、 $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_6)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_6)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_6)$ アルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_1 - C_6)$ ハロアルコキシ- $(C_1 - C_6)$ アルキル、 $(C_2 - C$

10

20

30

40

50

C_6) アルケニル、($C_2 - C_6$) アルケニルオキシ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニルオキシ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルケニル、($C_2 - C_6$) シアノアルケニル、($C_2 - C_6$) アルキニル、($C_2 - C_6$) アルキニルオキシ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニルオキシ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_2 - C_6$) ハロアルキニル、($C_2 - C_6$) シアノアルキニル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_3 - C_8$) シクロアルキル—($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキル—($C_3 - C_8$) シクロアルキル、ハロ($C_3 - C_8$) シクロアルキル、($C_1 - C_6$) アルキルチオ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルチオ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルフィニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルスルホニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ—($C_1 - C_6$) アルキルチオ—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ—($C_1 - C_6$) アルキルスルフィニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ—($C_1 - C_6$) アルキルスルホニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルカルボニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルキルカルボニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシカルボニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) ハロアルコキシカルボニル—($C_1 - C_6$) アルキル、アミノカルボニル—($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルキルアミノ—($C_1 - C_6$) アルキル、ジ($C_1 - C_6$) アルキルアミノ—($C_1 - C_6$) アルキル又は($C_3 - C_8$) シクロアルキルアミノ—($C_1 - C_6$) アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 である]

で表される化合物に関する。

【0067】

好ましいもの(構成 2)は、式(I)〔式中、

A^1 は、窒素、 $=N^+ - O^-$ 又は $=C - R^4$ であり；

A^2 は、 $-N - R^5$ 、酸素又は硫黄であり；

A^3 は、酸素であり；

A^4 は、窒素、 $=N^+ - O^-$ 又は $=C - R^4$ であり；

A^5 は、 $=C - H$ であり；

R^1 は、($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ヒドロキシアルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキル、($C_1 - C_4$) シアノアルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルコキシ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) アルケニルオキシ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニルオキシ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルケニル、($C_2 - C_4$) シアノアルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_2 - C_4$) アルキニルオキシ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニルオキシ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_2 - C_4$) ハロアルキニル、($C_2 - C_4$) シアノアルキニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル—($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルキル—($C_3 - C_6$) シクロアルキル、ハロ($C_3 - C_6$) シクロアルキル、($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、ジ($C_1 - C_4$) アルキルアミノ、($C_3 - C_6$) シクロアルキルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニルアミノ、($C_1 - C_4$) アルキルチオ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルチオ—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルフィニル—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルスルフィニル—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニル—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルカルボニル—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) ハロアルキルカルボニル—($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルキルスルホニルアミノであり；又は、

($C_1 - C_4$) アルキル、($C_1 - C_4$) アルコキシ、($C_2 - C_4$) アルケニル、($C_2 - C_4$) アルキニル、($C_3 - C_6$) シクロアルキル〔ここで、これらは、それぞれ

、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよく、その際、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、アミノスルホニル、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_3-C_4) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルチオ、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィミノで同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい]であり；又は、

R^1 は、アリール、ヘタリール又はヘテロシクリル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、シアノ、カルバモイル、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルチオ、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィミノ、 (C_1-C_4) アルキルスルホキシイミノ、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル、 (C_3-C_4) トリアルキルシリル、 $(=O)$ (ヘテロシクリルの場合のみ) 又は $(=O)_2$ (ヘテロシクリルの場合のみ) で同じように又は異なるように1置換又は2置換されていてもよい] であり；

R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 及び R^4 は、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_4) アルキルシリル、 (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_3-C_6) シクロアルキル- (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルキル- (C_3-C_6) シクロアルキル、ハロ- (C_3-C_6) シクロアルキル、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) シアノアルキル、 (C_1-C_4) ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) アルキル、 (C_2-C_4) アルケニル、 (C_2-C_4) ハロアルケニル、 (C_2-C_4) シアノアルケニル、 (C_2-C_4) アルキニル、 (C_2-C_4) ハロアルキニル、 (C_2-C_4) シアノアルキニル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) シアノアルコキシ、 (C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) アルキルヒドロキシイミノ、 (C_1-C_4) アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) アルキル- (C_1-C_4) アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) ハロアルキル- (C_1-C_4) アルコキシイミノ、 (C_1-C_4) アルキルチオ、 (C_1-C_4) ハロアルキルチオ、 (C_1-C_4) アルキルチオ- (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_4) アルキルスルフィニル- (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニル- (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_4) アルキルカルボニル、 (C_1-C_4) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、アミノチオカルボニル、 (C_1-C_4) アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_4) アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_4) アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_4) アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、 $NHCO-$ (C_1-C_4) アルキル ((C_1-C_4) アルキルカルボニルアミノ) であり；

フェニル又はヘタリール [ここで、これらは、それぞれ、同じように又は異なるように1置換又は2置換されており、その際、(ヘタリールの場合には) 少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基は、いずれの場合にも、以下のものである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、 (C_1-C_4) アルキル、 (C_1-C_4) ハロアルキル、 (C_1-C_4) シアノアルキル、 (C_1-C_4) ヒドロキシアルキル、 (C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) アルキル、 (C_2-C_4) アルケニル、 (C_2-C_4) ハロアルケニル、 (C_2-C_4) シアノアルケニル、 (C_2-C_4) アルキニル、 (C_2-C_4) ハロアルキニル、 (C_2-C_4) シアノアルキニル、 (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) ハロアルコキシ、 (C_1-C_4) シアノアルコキシ、 (C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) アルコキシ、 (C_1-C_4) アルキル

10

20

30

40

50

ヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル] であり；

R^5 は、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニルオキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、ハロ $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル- $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 である]

で表される化合物である。

【0068】

特に好ましいものにの(構成3)は、式(I)〔式中、

A^1 は、窒素又は $=C-R^4$ であり；

A^2 は、 $-N-R^5$ 又は酸素であり；

A^3 は、酸素であり；

A^4 は、窒素又は $=C-R^4$ であり；

A^5 は、 $=C-H$ であり；

R^1 は、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_3 - C_6)$ シクロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；又は、

$(C_1 - C_4)$ アルキル〔ここで、該アルキルは、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルで1置換されていてもよく、その際、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニルは、それぞれ、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル又は $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルで同

じように又は異なるように 1 置換又は 2 置換されていてもよい] であり；又は、

R^1 は、フェニル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラゾリル、トリアゾリル、チアゾリル、テトラゾリル、ピペラジニル、テトラヒドロフリル又はオキセタニル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル又は $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルで同じように又は異なるように 1 置換又は 2 置換されていてもよい] であり；

R^{2a} は、水素、シアノ、アミノカルボニル、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル又は $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニルであり；

10

R^{2b} は、水素、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $NHCO - (C_1 - C_4)$ アルキル又はハロゲンであり；

R^3 は、水素、ハロゲン、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニルであるか、又は、フェニル、ピラゾリル若しくはイミダゾリル [ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで 1 置換されていてもよい] であり；

R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ又は $(C_1 - C_3)$ アルキルであり；

20

R^5 は、 $(C_1 - C_4)$ アルキル又は $(C_1 - C_4)$ アルコキシ - $(C_1 - C_4)$ アルキルであり；

n は、0、1 又は 2 である]

で表される化合物である。

【0069】

極めて特に好ましいもの (構成 4) は、式 (I) [式中、

A^1 は、窒素又は $=C - R^4$ であり；

A^2 は、 $-N - R^5$ 又は酸素であり；

A^3 は、酸素であり；

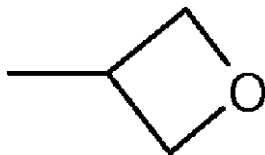
A^4 は、窒素又は $=C - H$ であり；

30

A^5 は、 $=C - H$ であり；

R^1 は、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピル、シクロプロピル、 n -ブチル、 i -ブチル、tert-ブチル、シクロブチル、ヒドロキシエチル ($-CH_2 - CH_2 - OH$)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、 $-(CH_2)_2 - S - C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2 - SO_2 - C_2H_5$ 又は

【化 2 9】



40

【0070】

であり；

R^{2a} は、水素、シアノ、アミノカルボニル ($CONH_2$)、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロ

50

メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

R^{2b} は、水素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、メチルカルボニルアミノ（ NHCO —メチル）、フッ素又は塩素であり；

R^3 は、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロクロロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであるか、又は、フェニル、ピラゾール—1—イル若しくはイミダゾール—1—イル〔ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで1置換されている〕であり；

10

R^4 は、水素、フッ素、塩素、臭素又はシアノであり；

R^5 は、メチル、エチル、*i*—プロピル、メトキシメチル又はメトキシエチルであり；

n は、0、1又は2である〕

で表される化合物である。

【0071】

重要なもの（構成5）は、式（I）〔

A^1 は、窒素（N）又は $=C-H$ であり；

A^2 は、 $-N-CH_3$ 又は酸素（O）であり；

A^3 は、酸素（O）であり；

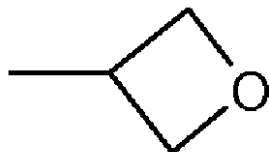
A^4 は、窒素（N）又は $=C-H$ であり；

20

A^5 は、 $=C-H$ であり；

R^1 は、メチル、エチル、*n*—プロピル、*i*—プロピル、シクロプロピル、*n*—ブチル、*i*—ブチル、*tert*—ブチル、シクロブチル、ヒドロキシエチル（ $-CH_2-CH_2-OH$ ）、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、 $-(CH_2)_2-S-C_2H_5$ 、 $-(CH_2)_2-SO_2-C_2H_5$ 又は

【化30】



30

【0072】

（オキセタン—3—イル）であり；

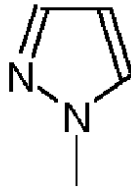
R^{2a} は、水素、シアノ、アミノカルボニル（ $CONH_2$ ）、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、フッ素又は塩素であり；

40

R^{2b} は、水素、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメチル、メチルカルボニルアミノ（ NHCO —メチル）、フッ素又は塩素であり；

R^3 は、フッ素、塩素、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、フルオロエチル、ジフルオロエチル、トリフルオロエチル、テトラフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニルであるか、又は、フェニル、

【化 3 1】

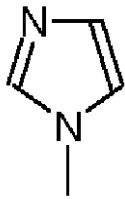


【0073】

10

(ピラゾール-1-イル) 若しくは

【化 3 2】



20

【0074】

(イミダゾール-1-イル) [ここで、これらは、それぞれ、トリフルオロメチルで1置換されていてもよい] であり；

nは、0、1又は2である]

で表される化合物である。

【0075】

特に重要なもの(構成6)は、式(I) [式中、

A¹は、窒素(N)又は=C-Hであり；

30

A²は、-N-CH₃又は酸素(O)であり；

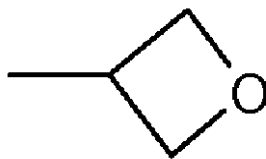
A³は、酸素(O)であり；

A⁴は、窒素(N)又は=C-Hであり；

A⁵は、C-Hであり；

R¹は、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、トリフルオロメチル、-CH₂-CH₂-F、-CH₂-CH₂-OH、-(CH₂)₂-S-C₂H₅、-(CH₂)₂-SO₂-C₂H₅又は

【化 3 3】



40

【0076】

であり；

R^{2a}は、水素、トリフルオロメチル、シアノ、CONH₂、フッ素又は塩素であり；

R^{2b}は、水素、塩素、トリフルオロメチル、メトキシ又はNHCOCH₃であり；

50

R^3 は、ペンタフルオロエチル、トリフルオロメチル、塩素、 $4-CF_3(C_6H_4)$ 、 $4-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル、 $3-(CF_3)$ ピラゾール-1-イル又は $4-(CF_3)$ イミダゾール-1-イルであり；

n は、0、1又は2である]

で表される化合物である。

【0077】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I)〔式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成(1)又は構成(2)又は構成(3)又は構成(4)又は構成(5)又は構成(6)において定義されているとおりであり；及び、

R^{2b} は、アセチル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_6) アルキルシリル、 (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_3-C_8) シクロアルキル- (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_1-C_6) アルキル (C_3-C_8) シクロアルキル(ここで、結合は、アルキルで置換されているシクロアルキルを介している)、ハロ (C_3-C_8) シクロアルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) ハロアルケニル、 (C_2-C_6) シアノアルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、 (C_2-C_6) ハロアルキニル、 (C_2-C_6) シアノアルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) アルキルヒドロキシイミノ、 (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) ハロアルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、 (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) ハロアルキルチオ、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルチオ、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルオキシ、 (C_1-C_6) アルキルカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルチオカルボニル、 (C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルカルボニルオキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル、 (C_1-C_6) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、 (C_2-C_6) アルケニルアミノカルボニル、ジ- (C_2-C_6) -アルケニルアミノカルボニル、 (C_3-C_8) シクロアルキルアミノカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホニルアミノ、 (C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノ、アミノスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル、 (C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、 (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、 (C_3-C_8) シクロアルキルアミノ、 $NHCO-$ (C_1-C_6) アルキル (C_1-C_6) アルキルカルボニルアミノ)であり；

いずれの場合にも同じように又は異なるように1回又は複数回置換されていてもよいヘタリール〔ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換基はいずれの場合にも以下のものである：シアノ、カルボキシル、ハロゲン、ニトロ、アセチル、ヒドロキシル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_6) アルキルシリル、 (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) ハロアルキル、 (C_1-C_6) シアノアルキル、 (C_1-C_6) ヒドロキシアルキル、ヒドロキシカルボニル- (C_1-C_6) -アルコキシ、 (C_1-C_6) アルコキシカルボニル- (C_1-C_6) アルキル、 (C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキル、 (C_2-C_6) アルケニル、 (C_2-C_6) ハロアルケニル、 (C_2-C_6) シアノアルケニル、 (C_2-C_6) アルキニル、 (C_2-C_6) ハロアルキニル、 (C_2-C_6) シアノアルキニル、 (C_1-C_6) アルコキシ、 (C_1-C_6) ハロアルコキシ、 (C_1-C_6) シアノアルコキシ、 (C_1-C_6) アル

10

20

30

40

50

コキシカルボニル- (C_1-C_6) アルコキシ、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルコキシ、(C_1-C_6) アルキルヒドロキシイミノ、(C_1-C_6) アルコキシイミノ、(C_1-C_6) アルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、(C_1-C_6) ハロアルキル- (C_1-C_6) アルコキシイミノ、(C_1-C_6) アルキルチオ、(C_1-C_6) ハロアルキルチオ、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルチオ、(C_1-C_6) アルキルチオ- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) ハロアルキルスルフィニル、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルフィニル、(C_1-C_6) アルキルスルフィニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルホニル、(C_1-C_6) ハロアルキルスルホニル、(C_1-C_6) アルコキシ- (C_1-C_6) アルキルスルホニル、(C_1-C_6) アルキルスルホニル- (C_1-C_6) アルキル、(C_1-C_6) アルキルスルホニルオキシ、(C_1-C_6) アルキルカルボニル、(C_1-C_6) ハロアルキルカルボニル、(C_1-C_6) アルキルカルボニルオキシ、(C_1-C_6) アルコキシカルボニル、(C_1-C_6) ハロアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、(C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノカルボニル、(C_2-C_6) アルケニルアミノカルボニル、ジ- (C_2-C_6) -アルケニルアミノカルボニル、(C_3-C_8) シクロアルキルアミノカルボニル、(C_1-C_6) アルキルスルホニルアミノ、(C_1-C_6) アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノスルホニル、(C_1-C_6) アルキルスルホキシイミノ、アミノチオカルボニル、(C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、ジ- (C_1-C_6) アルキルアミノチオカルボニル、(C_3-C_8) シクロアルキルアミノ] である]

で表される化合物に関する。

【0078】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり；及び、

R^{2b} は、アセチル、アミノ、SCN、トリ- (C_1-C_4) アルキルシリル、(C_3-C_6) シクロアルキル、(C_3-C_6) シクロアルキル- (C_3-C_6) シクロアルキル、(C_1-C_4) アルキル (C_3-C_6) シクロアルキル (ここで、結合は、アルキルで置換されているシクロアルキルを介している)、ハロ (C_3-C_6) シクロアルキル、(C_2-C_4) アルケニル、(C_2-C_4) ハロアルケニル、(C_2-C_4) シアノアルケニル、(C_2-C_4) アルキニル、(C_2-C_4) ハロアルキニル、(C_2-C_4) シアノアルキニル、(C_1-C_4) アルコキシ、(C_1-C_4) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) アルコキシ- (C_1-C_4) アルコキシ、(C_1-C_4) アルキルヒドロキシイミノ、(C_1-C_4) アルコキシイミノ、(C_1-C_4) アルキル- (C_1-C_4) アルコキシイミノ、(C_1-C_4) ハロアルキル- (C_1-C_4) アルコキシイミノ、(C_1-C_4) アルキルチオ、(C_1-C_4) ハロアルキルチオ、(C_1-C_4) アルキルスルフィニル、(C_1-C_4) ハロアルキルスルフィニル、(C_1-C_4) アルキルスルホニル、(C_1-C_4) ハロアルキルスルホニル、(C_1-C_4) アルキルスルホニルオキシ、(C_1-C_4) アルキルカルボニル、(C_1-C_4) ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、(C_1-C_4) アルキルアミノカルボニル、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノカルボニル、(C_1-C_4) アルキルスルホニルアミノ、(C_1-C_4) アルキルアミノ、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノ、アミノスルホニル、(C_1-C_4) アルキルアミノスルホニル、ジ- (C_1-C_4) アルキルアミノスルホニル、アミノチオカルボニル、 $NHCO-$ (C_1-C_4) アルキル (C_1-C_4) アルキルカルボニルアミノ) であり；

いずれの場合にも同じように又は異なるように1回又は2回置換されているヘタリール [ここで、少なくとも1のカルボニル基が存在していてもよく、及び/又は、可能な置換

基はいずれの場合にも以下のものである：シアノ、ハロゲン、ニトロ、アセチル、アミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルキル、 $(C_1 - C_4)$ ヒドロキシアルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_2 - C_4)$ アルケニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルケニル、 $(C_2 - C_4)$ アルキニル、 $(C_2 - C_4)$ ハロアルキニル、 $(C_2 - C_4)$ シアノアルキニル、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ シアノアルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ- $(C_1 - C_4)$ アルコキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルヒドロキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキル- $(C_1 - C_4)$ アルコキシイミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルチオ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルチオ- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルフィニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルフィニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニル- $(C_1 - C_4)$ アルキル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルオキシ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、ジ- $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノカルボニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルスルホニルアミノ、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、ジ- $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノ、アミノスルホニル、 $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル、ジ- $(C_1 - C_4)$ アルキルアミノスルホニル] である]

10

20

で表される化合物に関する。

【0079】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり；及び、

R^{2b} は、 $(C_1 - C_4)$ アルコキシ又は $NHCO - (C_1 - C_4)$ アルキルである]

で表される化合物に関する。

【0080】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり；及び、

R^{2b} は、メトキシ、エトキシ又は $NHCO - \text{メチル}$ である]

で表される化合物に関する。

30

【0081】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I) [式中、 R^1 、 R^{2a} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、特に、構成 (1) 又は構成 (2) 又は構成 (3) 又は構成 (4) 又は構成 (5) 又は構成 (6) において定義されているとおりであり；及び、

R^{2b} は、メトキシ又は $NHCO - \text{メチル}$ である]

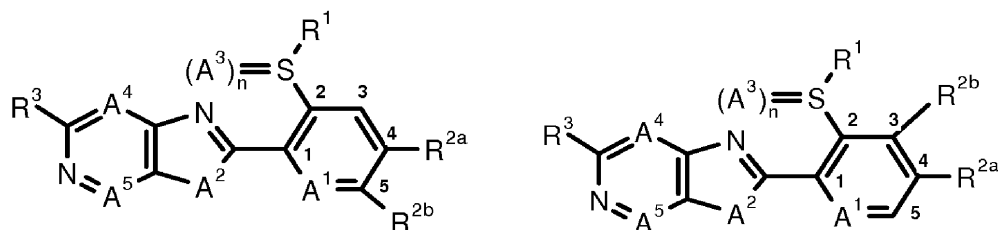
で表される化合物に関する。

40

【0082】

R^{2b} は、3 位又は 5 位において結合している：

【化 3 4】



【0083】

10

好ましい定義において、別途示されていない限り：

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択され；

アリール（これは、より大きな単位（例えば、アリールアルキル）の一部分としてのアリールを包含する）は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルからなる群から選択され、そして、好ましくは、フェニルであり；

ヘタリール（「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位（例えば、ヘタリールアルキル）の一部分としてのヘタリールを包含する）は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3-オキサジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 5-オキサジアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、テトラゾリル、ピリジル、ピリミジル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3-トリアジニル、1, 2, 4-トリアジニル、1, 3, 5-トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2, 1, 3-ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル及びインドリジニルからなる群から選択され；

20

30

ヘテロシクリルは、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は1個の酸素原子及び／又は1個の硫黄原子を含んでいる4員、5員又は6員の飽和環、例えば、アゼチジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、オキセタニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、チエタニル、テトラヒドロチオフェニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペラジニル、モルホリニル及びチオモルホリニルなどである。

【0084】

特に好ましい定義において、別途示されていない限り：

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素からなる群から選択され；

アリール（これは、より大きな単位（例えば、アリールアルキル）の一部分としてのアリールを包含する）は、フェニル、ナフチル、アントリル及びフェナントレニルからなる群から選択され、そして、好ましくは、フェニルであり；

40

ヘタリール（これは、より大きな単位（例えば、ヘタリールアルキル）の一部分としてのヘタリールを包含する）は、ピリジル、ピリミジル、ピラジニル、ピリダジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル、チアゾリル及びテトラゾリルからなる群から選択され；

ヘテロシクリルは、オキセタニル、テトラヒドロフリル及びピペラジニルからなる群から選択される。

【0085】

本発明に関連して、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキル」

50

は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルキル）、1～12個の炭素原子を有する飽和脂肪族炭化水素基のラジカルを意味するものと理解され、そして、直鎖又は分枝鎖であることができる。 C_1-C_{12} -アルキルラジカルの例は、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、 n -ブチル、イソブチル、sec-ブチル、tert-ブチル、 n -ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、tert-ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、1-エチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、 n -ヘプチル、 n -オクチル、 n -ノニル、 n -デシル、 n -ウンデシル及び n -ドデシルである。これらのアルキルラジカルの中で、特に好ましいのは、 C_1-C_6 -アルキルラジカルである。特別に好ましいのは、 C_1-C_4 -アルキルラジカルである。

10

【0086】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルケニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の二重結合を有している直鎖又は分枝鎖の C_2-C_{12} -アルケニルラジカル、例えば、ビニル、アリル、1-プロペニル、イソプロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1,3-ブタジエニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1,3-ペンタジエニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル及び1,4-ヘキサジエニルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、 C_2-C_6 -アルケニルラジカルであり、特に好ましいのは、 C_2-C_4 -アルケニルラジカルである。

20

【0087】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「アルキニル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、少なくとも1の三重結合を有している直鎖又は分枝鎖の C_2-C_{12} -アルキニルラジカル、例えば、エチニル、1-プロピニル及びプロパルギルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、 C_3-C_6 -アルキニルラジカルであり、特に好ましいのは、 C_3-C_4 -アルキニルラジカルである。該アルキニルラジカルは、少なくとも1の二重結合も含むことができる。

【0088】

本発明によれば、他の場所で異なるように定義されていない限り、用語「シクロアルキル」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて、 C_3-C_8 -シクロアルキルラジカル、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル及びシクロオクチルなどを意味するものと理解される。これらの中で、好ましいのは、 C_3-C_6 -シクロアルキルラジカルである。

30

【0089】

用語「アルコキシ」は、それ単独で又はさらなる用語と組み合わせられて（例えば、ハロアルコキシ）、 O -アルキルラジカルを意味するものと理解され、ここで、用語「アルキル」は、上記で定義されているとおりである。

【0090】

ハロゲンで置換されているラジカル（例えば、ハロアルキル）は、モノハロゲン化されているか、又は、置換基の可能な最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は同一であっても又は異なってもよい。この場合、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、特に、フッ素、塩素又は臭素である。

40

【0091】

別途示されていない限り、置換されていてもよいラジカルは、1置換又は多置換されることができ、ここで、多置換の場合における該置換基は、同一であっても又は異なってもよい。

【0092】

概括的に又は好ましい範囲内において上記で与えられているラジカルの定義又は説明は、最終生成物に当てはまり、及び、対応するように、出発物質及び中間体に当てはまる。

50

ラジカルについてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0093】

本発明に従って好ましいのは、好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式（I）で表される化合物の使用である。

【0094】

本発明に従って特に好ましいのは、特に好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式（I）で表される化合物の使用である。

【0095】

本発明に従って極めて特に好ましいのは、極めて特に好ましいものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式（I）で表される化合物の使用である。

10

【0096】

本発明に従って重要なのは、特別なものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式（I）で表される化合物の使用である。

【0097】

本発明に従って特に重要なのは、極めて特別なものとして上記で挙げられている定義の組合せが存在している、式（I）で表される化合物の使用である。

【0098】

式（I）で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態でも、及び／若しくは、光学活性異性体の形態でも、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の所望の混合物を包含する。

20

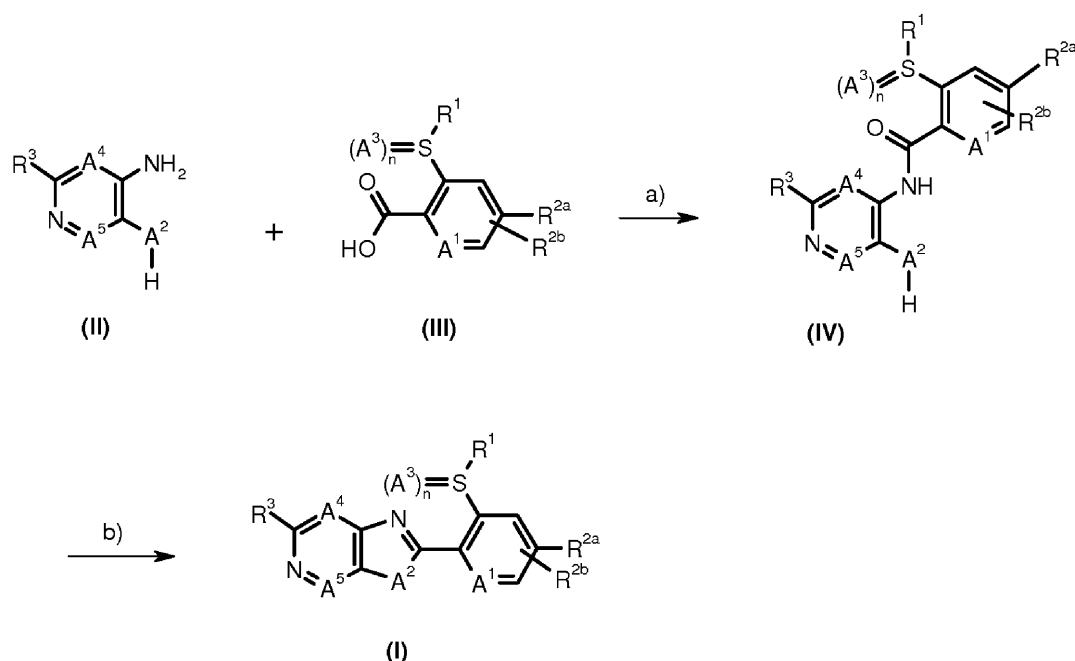
【0099】

式（I）で表される本発明化合物は、以下のスキームにおいて示されている調製方法によって得ることができる。

【0100】

調製方法 A

【化35】



30

40

【0101】

R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

50

【0102】

段階 (a)

式 (I V) で表される化合物は、US 5 5 7 6 3 3 5 に記載されている調製方法と同様にして、式 (I I) で表される化合物を、縮合剤の存在下で、式 (I I I) で表されるカルボン酸と反応させることによって、調製することができる。

【0103】

式 (I I) で表される化合物は、は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2 0 0 3 / 6 9 2 5 7 若しくは WO 2 0 0 6 / 6 5 7 0 3 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0104】

式 (I I I) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2 0 1 0 / 2 3 4 6 0 4、WO 2 0 1 2 / 6 1 9 2 6 若しくは「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0105】

式 (I I) で表される化合物と式 (I I I) で表されるカルボン酸の反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

【0106】

適切な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) 又は 1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミドなどである。

【0107】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0~180℃の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、20~140℃の温度で実施する。

【0108】

段階 (b)

式 (I) で表される化合物は、例えば、WO 2 0 1 2 / 8 6 8 4 8 に記載されている調製方法と同様にして、式 (I V) で表される化合物を縮合させることによって、調製することができる。

【0109】

式 (I) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

【0110】

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【0111】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)又は1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル(例えば、アゾジカルボン酸ジエチル)の混合物。

【0112】

記載されている反応において使用することが可能な適切な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、パラトルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、

10

【0113】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、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(DBU)；第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

【0114】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

【0115】

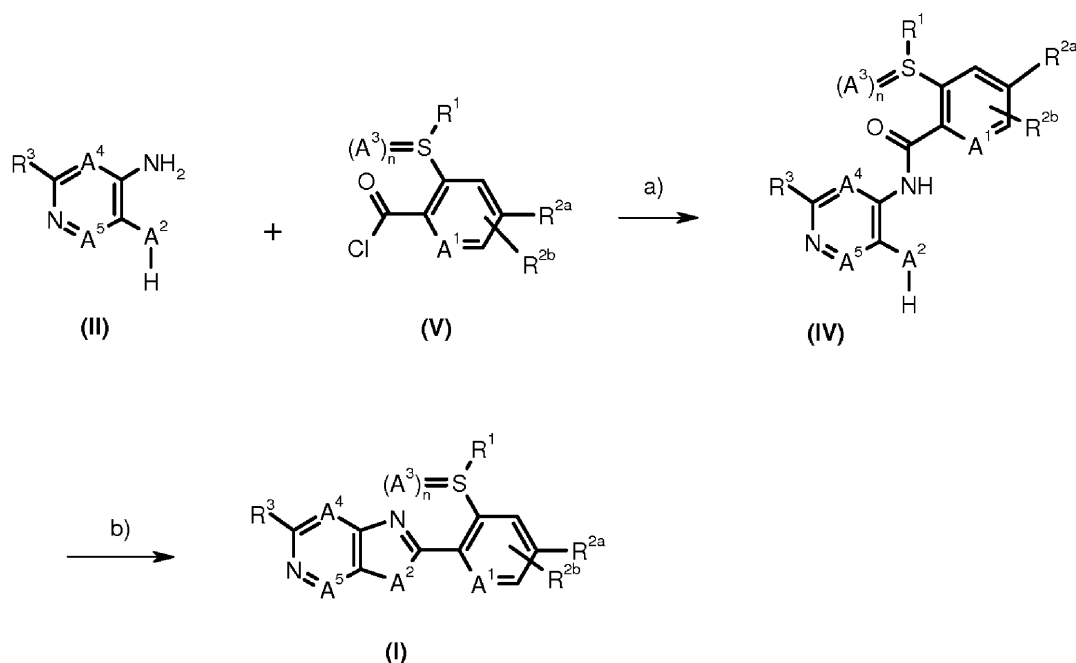
該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0℃～200℃の温度で実施することが可

20

【0116】

調製方法B

【化36】



30

40

【0117】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【0118】

段階(a)

本発明のさらなる実施形態では、式(IV)で表される化合物は、式(II)で表される化合物を、縮合剤の存在下で、式(V)で表される塩化カルボニルと反応させることによって調製することができる。

50

【0119】

式(V)で表される塩化カルボニルは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US2010/234603若しくはUS2010/234604に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0120】

式(II)で表される化合物と式(V)で表される塩化カルボニルの反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；脂肪族炭化水素、例えば、ヘキサン、ヘプタン又はオクタン；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

【0121】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。適しているさらなる塩基は、第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN,N-ジイソプロピルエチルアミン、並びに、窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2,6-ルチジン、4-ジメチルアミノピリジン及び1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン(DBU)である。

【0122】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 -20°C ～ 100°C の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、 0°C ～ 80°C の温度で実施する。

【0123】

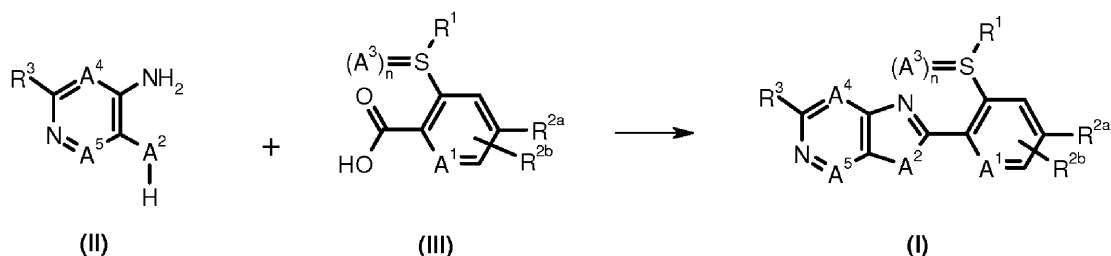
段階(b)

式(IV)で表される化合物の式(I)で表される化合物へのさらなる変換は、調製方法Aの段階(b)におけるのと同様に実施する。

【0124】

調製方法C

【化37】



【0125】

R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【0126】

本発明のさらなる実施形態では、式(I)で表される化合物は、縮合剤の存在下で、式

(I I) 及び式 (I I I) で表される中間体化合物から、1 段階法で調製することができる。

【0127】

式 (I) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

10

【0128】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) 又は1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾジエステル（例えば、アゾジカルボン酸ジエチル）の混合物。

20

【0129】

該反応は、酸又は塩基の存在下で実施することができる。

【0130】

記載されている反応において使用することが可能な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、メタンスルホン酸又はパラトルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

【0131】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、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 (DBU)；第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN, N-ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

30

【0132】

該反応は、適切な触媒（例えば、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール）の存在下で実施することができる。

【0133】

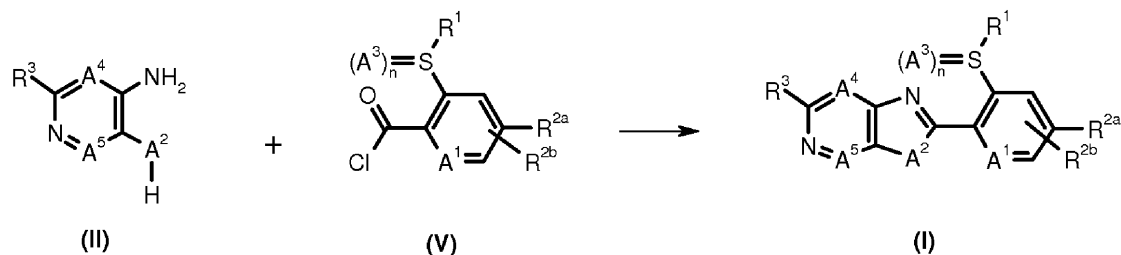
該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0 °C ~ 200 °C の温度で実施することが可能である。

【0134】

調製方法 D

【化38】

40



【0135】

R¹、R^{2 a}、R^{2 b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵ 及び n ラジカルは、それ

50

ぞれ、上記で定義されているとおりである。

【0136】

本発明のさらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、式（II）及び式（V）で表される中間体化合物から、1段階法で調製することができる。

【0137】

式（I）で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

【0138】

該反応は、好ましくは、塩基の存在下で実施する。適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、水酸化物、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムである。適しているさらなる塩基は、第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN, N-ジイソプロピルエチルアミン、窒素ヘテロ環、例えば、ピリジン、ピコリン、2, 6-ルチジン、4-ジメチルアミノピリジン及び1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]-7-ウンデセン（DBU）である。

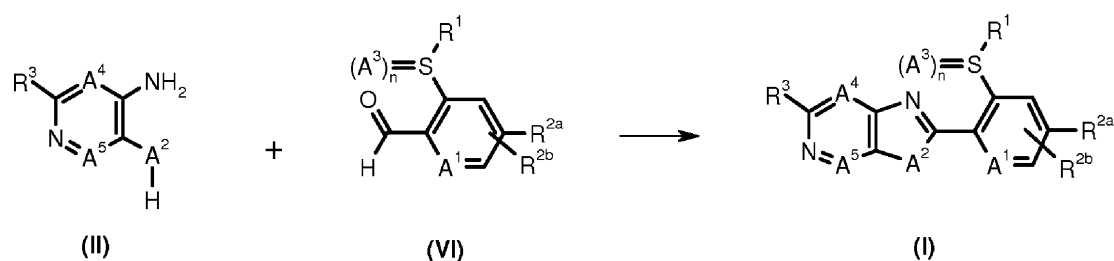
【0139】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0℃～200℃の温度で実施することが可能である。

【0140】

調製方法E

【化39】



【0141】

R¹、R^{2a}、R^{2b}、R³、A¹、A²、A³、A⁴、A⁵及びnラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりである。

【0142】

本発明のさらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、酸化剤の存在下で、式（II）で表される化合物と式（VI）で表されるアルデヒドから調製することができる。

【0143】

式（VI）で表されるアルデヒドは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2009/192195、US 2010/227894若しくは「Angewandte Chemie, International Edition, 48 (200

9), 7064-7068」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0144】

式(I)で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール、エタノール又はイソプロパノール；エステル類、例えば、酢酸エチル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

10

【0145】

該反応は、酸の存在下で実施することができる。記載されている反応において使用することが可能な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、メタンスルホン酸又はパラートルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

【0146】

該反応は、亜硫酸塩の存在下でも実施することができる。記載されている反応において使用することが可能な亜硫酸塩の例は、亜硫酸水素ナトリウム又は亜硫酸ナトリウムである。

20

【0147】

記載されている反応において使用される酸化剤の例は、酸素、塩化銅(II)又はDDQである。

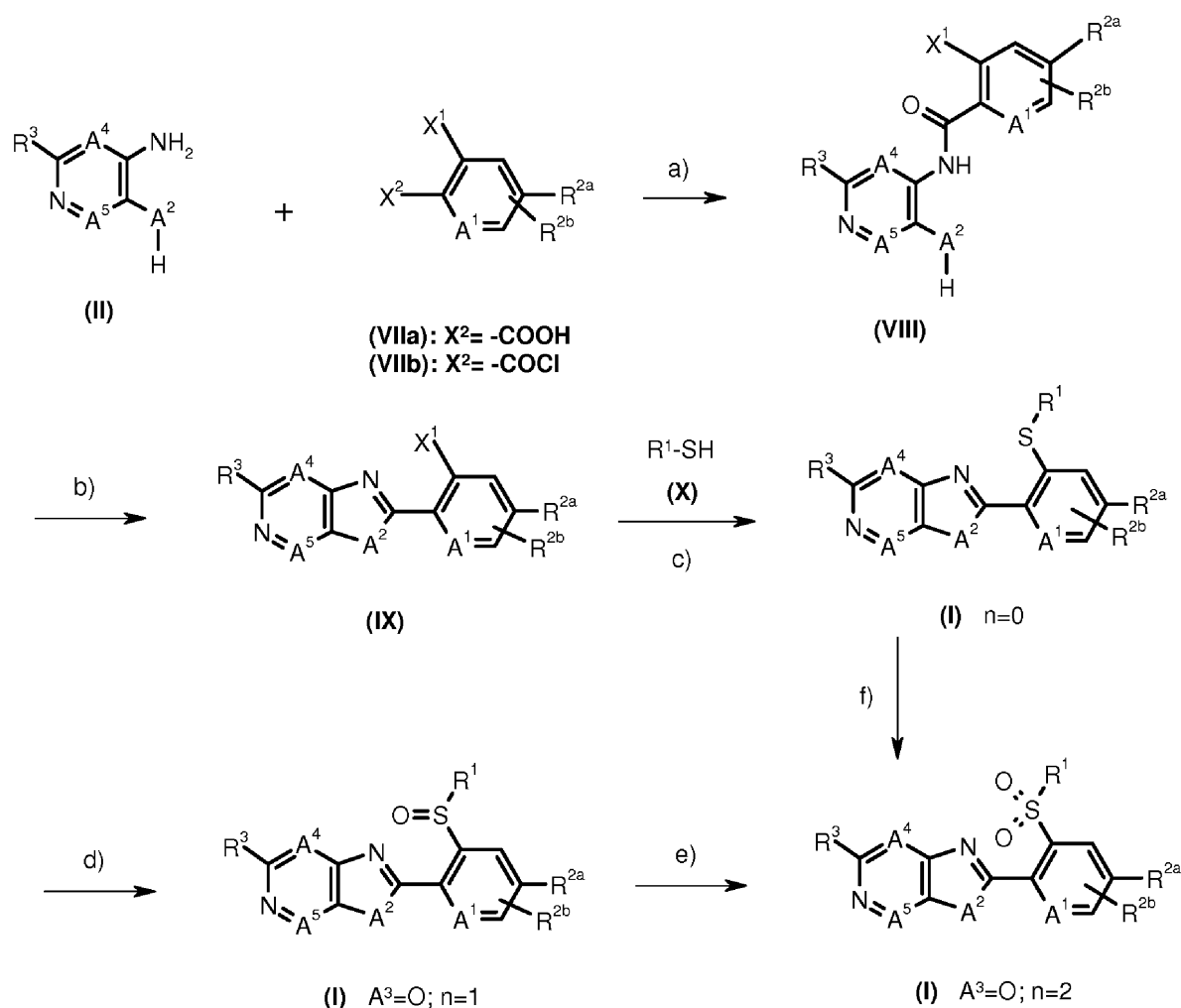
【0148】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0~200℃の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、20~150℃の温度で実施する。

【0149】

調製方法 F

【化 4 0】



10

20

30

【0150】

R^1 、 R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 A^5 及び n ラジカルは、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、並びに、 X^1 はハロゲンである。

【0151】

段階 (a)

式 (VII I) で表される化合物は、US 5 5 7 6 3 3 5 に記載されている調製方法と同様にして、式 (I I) で表される化合物を、縮合剤又は塩基の存在下で、式 (VII a) で表されるカルボン酸又は式 (VII b) で表される塩化カルボニルと反応させることによって、調製することができる。

【0152】

式 (I I) で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2 0 0 3 / 6 9 2 5 7 若しくは WO 2 0 0 6 / 6 5 7 0 3 に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0153】

式 (VII a) で表されるカルボン酸は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2 0 1 0 / 2 3 4 6 0 4、WO 2 0 1 2 / 6 1 9 2 6 若しくは「Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters, 18 (2008), 5023-5026」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0154】

40

50

式(V I I b)で表される塩化カルボニルは、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2 0 1 0 / 2 3 4 6 0 3若しくはUS 2 0 1 0 / 2 3 4 6 0 4に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0155】

式(I I)で表される化合物と式(V I I a)で表されるカルボン酸又は式(V I I b)で表される塩化カルボニルの反応は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

10

【0156】

適切な縮合剤は、例えば、カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)又は1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミドである。

【0157】

適切な塩基は、そのような反応において典型的に使用される無機塩基である。好ましくは、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩、炭酸塩及び炭酸水素塩からなる群から例として選択される塩基を使用する。特に好ましいのは、酢酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウムである。

20

【0158】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0~180℃の温度で実施することが可能であり、好ましくは、該反応は、標準圧力下、20~140℃の温度で実施する。

【0159】

段階(b)

式(I X)で表される化合物は、例えば、WO 2 0 1 2 / 8 6 8 4 8に記載されている調製方法と同様にして、式(V I I I)で表される化合物中間体化合物を縮合させることによって調製することができる。

30

【0160】

式(I X)で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルピロリドン；又は、窒素化合物、例えば、ピリジン。

40

【0161】

該反応は、縮合剤、酸、塩基又は塩素化剤の存在下で実施することができる。

【0162】

適切な縮合剤の例は、以下のものである：カルボジイミド類、例えば、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩(EDCI)又は1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド；無水物、例えば、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸；トリフェニルホスフィンと塩基と四塩化炭素の混合物、又は、トリフェニルホスフィンとアゾ

50

ジエステル（例えば、アゾジカルボン酸ジエチル）の混合物。

【0163】

記載されている反応において使用することが可能な適切な酸の例は、以下のものである：スルホン酸、例えば、パラートルエンスルホン酸；カルボン酸、例えば、酢酸；又は、ポリリン酸。

【0164】

適切な塩基の例は、以下のものである：窒素ヘテロ環、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(DBU)；第3級アミン、例えば、トリエチルアミン及びN, N-ジイソプロピルエチルアミン；無機塩基、例えば、リン酸カリウム、炭酸カリウム及び水素化ナトリウム。

10

【0165】

適切な塩素化剤の例は、オキシ塩化リンである。

【0166】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0℃～200℃の温度で実施することが可能である。

【0167】

段階(c)

式(I)〔式中、nは0である〕で表される化合物は、塩基の存在下で、式(IX)で表される中間体化合物を式(X)で表される中間体化合物と反応させることによって調製することができる。

20

【0168】

式(X)で表されるメルカプタン誘導体（例えば、メチルメルカプタン、エチルメルカプタン又はイソプロピルメルカプタン）は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、US 2006/25633、US 2006/111591、US 2820062、「Chemical Communications, 13(2000), 1163-1164」若しくは「Journal of the American Chemical Society, 44(1922), p. 1329」に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0169】

式(I)〔式中、nは0である〕で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン；非プロトン性極性溶媒、例えば、N, N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン又はジメチルスルホキシド。

30

【0170】

適切な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムである。適しているさらなる塩基は、アルカリ金属水素化物、例えば、水素化ナトリウムである。

40

【0171】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0℃～200℃の温度で実施することが可能である。

【0172】

上記反応において、X¹は、好ましくは、フッ素原子又は塩素原子である。

【0173】

段階(d)

式(I)〔式中、A³は酸素であり、及び、nは1である〕で表される化合物は、式(

50

I)〔式中、 n は0である〕で表される化合物を酸化することによって調製することができる。この酸化は、一般に、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0174】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素、メタークロロ過安息香酸又は過ヨウ素酸ナトリウムである。

【0175】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 $-20^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ の温度で実施することが可能である。

【0176】

段階(e)

式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は2である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は1である〕で表される化合物を酸化することによって調製することができる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0177】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタークロロ過安息香酸である。

【0178】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 $-20^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ の温度で実施することが可能である。

【0179】

段階(f)

式(I)〔式中、 A^3 は酸素であり、及び、 n は2である〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 n は0である〕で表される化合物を酸化することによって1段階法で調製することもできる。この酸化は、一般に、溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン又はクロロベンゼン；アルコール類、例えば、メタノール又はエタノール；ギ酸、酢酸、プロピオン酸；又は、水。

【0180】

適切な酸化剤の例は、過酸化水素及びメタークロロ過安息香酸である。

【0181】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、 $-20^{\circ}\text{C} \sim 120^{\circ}\text{C}$ の温度で実施することが可能である。

【0182】

調製方法G

式(I)〔式中、 R^3 =ハロゲン〕で表される化合物は、式(I)〔式中、 R^3 は、当該定義に従う別のラジカルである〕で表される別の化合物に変換することができる。

【0183】

式(I)〔式中、 R^3 は、当該定義に従うアリール又はヘテロリールからなる群から選択されるC-結合ラジカルである〕で表される化合物は、例えば、式(I)〔式中、 R^3 は、好ましくは、塩素又は臭素の群から選択されるハロゲンである〕で表される化合物から、一般的に知られている方法によって調製することができる(c f. Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483; Tetrahedron 2002, 58, 9633-9695; Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions (eds.: A. de Meijere, F

10

20

30

40

50

. Diederich), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2004)。

【0184】

例えば、 R^3 が好ましくは塩素又は臭素である化合物を、遷移金属塩の群から選択される適切な触媒の存在下で、既知方法 (cf. WO2010071819) によって適切なアリールボロン酸又はそのエステルと反応させて、式 (I) [式中、 R^3 は、アリールの群から選択されるラジカルである] で表される化合物を生成させることができる。好ましいカップリング触媒の例としては、パラジウム触媒、例えば、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン] ジクロロパラジウム (II) 又はテトラキス(トリフェニルホスフィン) パラジウムなどがある。該調製方法を実施するために使用される適切な塩基性反応助剤は、好ましくは、ナトリウム又はカリウムの炭酸塩である。

10

【0185】

必要とされる(ヘテロ)アリールボロン酸又は(ヘテロ)アリールボロン酸エステルの一部は、知られており、及び/又は、市販されており、そして、例えば、一般的に知られている方法によって調製される (cf. Boronic Acids (eds.: D. G. Hall), 2nd ed., Wiley-VCH, Weinheim, 2011)。

【0186】

式 (I) [式中、 R^3 は、N-結合ヘタリール (例えば、イミダゾール-1-イル及びピラゾール-1-イル) である] で表される化合物の調製は、文献から知られている方法 (例えば、「Journal of Organic Chemistry (2010), 69, 5578」を参照されたい) によって、好ましくは、ヨウ化銅 (I) 及び塩基性反応助剤 (例えば、トランス-N, N'-ジメチルシクロヘキサン-1, 2-ジアミン及び炭酸カリウム) の存在下、適切な溶媒又は希釈剤の中で、実施することができる。有用な溶媒又は希釈剤には全ての不活性有機溶媒 (例えば、脂肪族炭化水素又は芳香族炭化水素) が包含される。好ましくは、トルエンを使用する。

20

【0187】

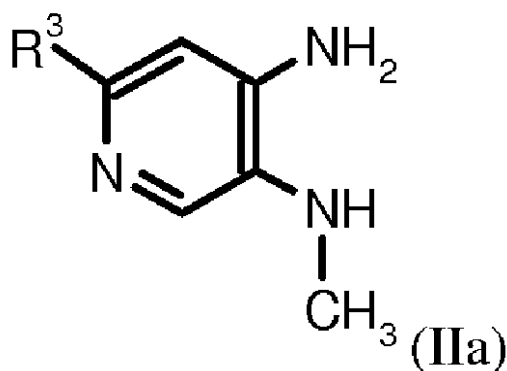
式 (II) で表される化合物の一部は、新規である。

【0188】

新規な化合物は、式 (IIa)

30

【化41】



40

【0189】

[式中、 R^3 は上記で定義されているとおりであるが、 R^3 は塩素、臭素又はCHOであることはできない]

で表される化合物である。

【0190】

本発明は、式 (IIa) [式中、 R^3 は、(C_1-C_4) ハロアルキル、(C_1-C_4) ハロアルコキシ、(C_1-C_4) ハロアルキルチオ、(C_1-C_4) ハロアルキルスル

50

フィニル又は(C₁－C₄)ハロアルキルスルホニルであるが、ここで、R³はCF₃又はCHF₂ではない]で表される化合物も提供する。

【0191】

好ましくは、R³は、CH₂F、C₂H₄F、C₂H₃F₂、C₂H₂F₃、C₂HF₄、C₂F₅、n-C₃F₇、i-C₃F₇、OCH₂F、SCH₂F、SOCH₂F、SO₂CH₂F、OCHF₂、SCHF₂、SOCHF₂、SO₂CHF₂、OCF₃、OCF₂Cl、OCFCl₂、SCF₃、SOCF₃、SO₂CF₃、OC₂H₄F、SC₂H₄F、SOC₂H₄F、SO₂C₂H₄F、OC₂H₃F₂、SC₂H₃F₂、SOC₂H₃F₂、SO₂C₂H₃F₂、OC₂H₂F₃、SC₂H₂F₃、SOC₂H₂F₃、SO₂C₂H₂F₃、OC₂HF₄、SC₂HF₄、SOC₂HF₄、SO₂C₂HF₄、OC₂F₅、SC₂F₅、SOC₂F₅、SO₂C₂F₅、n-OC₃F₇、n-SC₃F₇、n-SOC₃F₇、n-SO₂C₃F₇、i-OC₃F₇、i-SC₃F₇、i-SOC₃F₇又はi-SO₂C₃F₇である。

10

【0192】

さらに好ましくは、R³は、CH₂F、OCF₃、C₂H₄F、C₂H₃F₂、C₂H₂F₃、C₂HF₄、C₂F₅、SCF₃、SOCF₃又はSO₂CF₃である。

【0193】

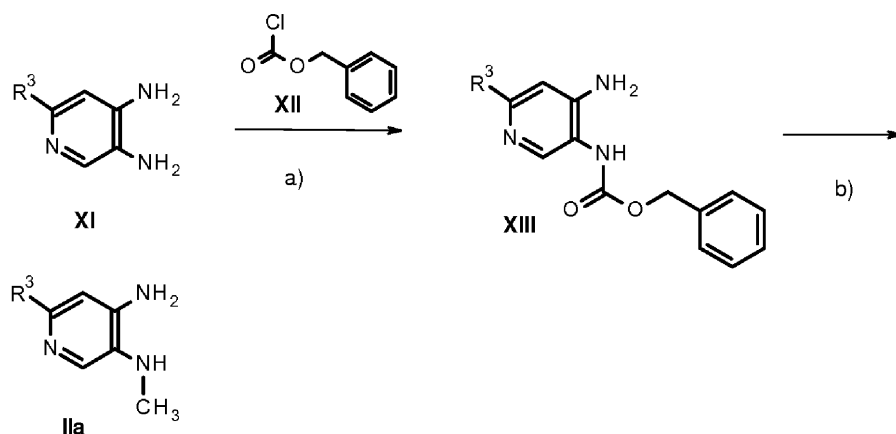
最も好ましくは、R³は、C₂F₅である。

【0194】

調製方法H

20

【化42】



30

【0195】

R³ラジカルは、上記で定義されているとおりである。

【0196】

段階(a)

式(XIII)で表される化合物は、WO2005/55928又は「Journal of Medicinal Chemistry, 48(2005), p. 6128-6139」に記載されている調製方法と同様にして、式(XI)で表される化合物を、例えば塩基の存在下で、式(XI)で表されるクロロ炭酸ベンジル(クロロギ酸ベンジル)と反応させることによって調製することができる。

40

【0197】

式(XI)で表される化合物は、市販されているか、又は、既知方法で、例えば、WO2012/3576、WO2007/47793若しくはWO2006/65703に記載されている調製方法と同様にして、調製することができる。

【0198】

式(XIII)で表される化合物への該変換は、実質的に実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条

50

件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、以下のものである：エーテル類、例えば、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン、tert-ブチルメチルエーテル；ニトリル類、例えば、アセトニトリル又はプロピオニトリル；又は、芳香族炭化水素、例えば、トルエン又はキシレン。

【0199】

適切な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、リン酸塩及び炭酸塩からなる群から選択される無機塩基である。好ましいのは、炭酸セシウム、炭酸ナトリウム及び炭酸カリウムである。

【0200】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0℃～120℃の温度で実施することが可能である。

【0201】

段階 (b)

式 (I Ia) で表される化合物は、例えば、「Journal of Heterocyclic Chemistry, 22 (1985), p. 313-318」に記載されている調製方法と同様にして、式 (X I I I) で表される化合物を還元することによって調製することができる。

【0202】

適切な還元剤の例は、水素化アルミニウムリチウムである。

【0203】

式 (I Ia) で表される化合物への該変換は、何も加えずに実施することが可能であるか、又は、溶媒中で実施することが可能であり、好ましくは、当該反応は、一般的な反応条件下で不活性である慣習的な溶媒から選択される溶媒の中で実施する。好ましいのは、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2-ジメトキシエタン又はtert-ブチルメチルエーテルである。

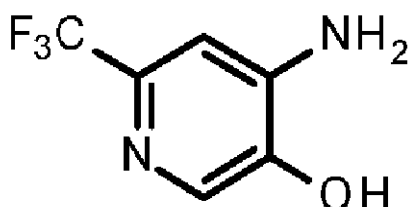
【0204】

該反応は、減圧下、標準圧力下又は高圧下、0℃～100℃の温度で実施することが可能である。

【0205】

式 (I I - 0 2)

【化 4 3】



【0206】

で表される化合物も、新規である。

【0207】

方法及び使用

本発明は、さらに、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式 (I) で表される化合物を害虫及び／又はそれらの生息環境に作用させる。害虫の該防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料物質 (material) の保護において、実施される。好ましくは、該方法から、ヒト又は動物の身体の外科的な又は治療的

10

20

30

40

50

な処置方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法は、除外される。

【0208】

本発明は、さらに、殺有害生物剤としての、特に、作物保護剤としての、式(I)で表される化合物の使用にも関する。

【0209】

本出願に関連して、用語「殺有害生物剤(pesticide)」は、いずれの場合にも、常に、用語「作物保護剤」も包含する。

【0210】

式(I)で表される化合物は、植物が良好な耐性を示し、温血動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す場合、生物的ストレス因子及び非生物的ストレス因子に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、線虫類及び軟体動物を防除するのに適している。それらは、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げるができる：

節足動物門の害虫、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、例えば、アカルス・シロ(Acarus siro)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Aceria sheldoni)、アクロプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus fockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(Amphitetranychus viennensis)、アルガス属種(Argas spp.)、ボオフィルス属種(Boophilus spp.)、ブレビパルス属種(Brevipalpus spp.)、例えば、ブレビパルス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)、ブリオビア・グラミナム(Bryobia graminum)、ブリオビア・プラエチオサ(Bryobia praetiosa)、セントルロイデス属種(Centruroides spp.)、コリオプテス属種(Choriotptes spp.)、デルマニクス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス(Dermatophagoides pteronyssinus)、デルマトファゴイデス・ファリナエ(Dermatophagoides farinae)、デルマセントル属種(Dermacentor spp.)、エオテトラニクス属種(Eotetranychus spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ(Eotetranychus hicoriae)、エピトリメルス・ピリ(Epitrimerus pyri)、エウテトラニクス属種(Eutetranychus spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ(Eutetranychus banksi)、エリオフィエス属種(Eriophyes spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ(Eriophyes pyri)、グリシファグス・ドメスティクス(Glycyphagus domesticus)、ハロチデウス・デストルクトル(Halotydeus destructor)、ヘミタロソネムス属種(Hemitarsonemus spp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス(Hemitarsonemus latus)(=ポリファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus latus))、ヒアロンマ属種(Hyalomma spp.)、イキソデス属種(Ixodes spp.)、ラトロデクトゥス属種(Latrodectus spp.)、ロキソスケレス属種(Loxosceles spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス(Neutrombicula autumnalis)、ヌフェルサ属種(Nuphersa

10

20

30

40

50

spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yotherisi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citriri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multidigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニクス・トルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus* spp.)、スクチゲラ属種 (*Scutigera* spp.) ;

トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*) ; スミンツルス・ビリジス (*Sminthurus viridis*) ;

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*) ;

昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ属種 (*Panchlora* spp.)、パルコブラッタ属種 (*Parcoblatta* spp.)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta* spp.)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、スベラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) ;

コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクツス (*Acanthosc*

elides obtectus）、アドレッツス属種 (*Adoretus* spp.)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora* spp.)、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.)、例えば、アントノムス・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia* spp.)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクツス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus* spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera* spp.)、クルクリオ属種 (*Curculio* spp.)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、クルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adpersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デルメステス属種 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifer a virgifer a*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifer a zeae*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.

)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデ
 ルス属種 (*Diloboderus* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna*
spp.)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna boreali*
s)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*)、エピ
 トリキス属種 (*Epitrix* spp.)、例えば、エピトリキス・ククメリス (*Ep*
itrix cucumeris)、エピトリキス・フスクラ (*Epitrix fus*
cula)、エピトリキス・ヒルチペンニス (*Epitrix hirtipennis*
)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリ
 キス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faust*
inus spp.)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloide* 10
s)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘル
 ラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Het*
eronychus arator)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp
 .) 、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトル
 ペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポスチカ (*Hy*
pera postica)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squ*
amosus)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、
 ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・
 オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・ブベセ
 ンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサング
 イネア (*Lachnosterna consanguinea*)、ラシドデルマ・セリ
 コルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザエ (*La*
theticus oryzae)、ラトリジウス属種 (*Lathridius* spp
 .) 、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Lepti*
notarsa decemlineata)、レウコプテラ属種 (*Leucopter*
a spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coff*
eeella)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhopterus or*
yzophilus)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、ルペロモルファ・キサ
 ントデラ (*Luperomorphaxanthodera*)、ルペロデス属種 (*Lu*
perodes spp.)、リクツス属種 (*Lycetus* spp.)、メガセリス属 30
 種 (*Megascelis* spp.)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp
 .) 、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus lon*
gulus oregonensis)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes*
aeneus)、メロロンタ属種 (*Melolontha* spp.)、例えば、メ
 ロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属
 種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.
)、ナウパクツス・キサントグラフィス (*Naupactus xanthographus*)、
 ネクロビア属種 (*Necrobia* spp.)、ニプツス・ホロレウクス (*Ni*
ptus hololeucus)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhi*
noceros)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus* s 40
urinamensis)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus or*
yzae)、オチオリンクス属種 (*Otiorhynchus* spp.)、例えば、オ
 チオリンクス・クリブリコリス (*Otiorhynchus cribricollis*
)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorhynchus ligustici*)、
 オチオリンクス・オバツス (*Otiorhynchus ovatus*)、オチオリンク
 ス・ルゴソストリアルス (*Otiorhynchus rugosostriatus*)、
 オチオリンクス・スルカツス (*Otiorhynchus sulcatus*)、オキ
 シセトニア・ジュンクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コ
 クレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyl*
llophaga spp.)、フィロファガ・ヘレリ (*Phylllophaga he* 50

lleri)、フィロトレタ属種(Phyllotreta spp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ(Phyllotreta armoraciae)、フィロトレタ・プシラ(Phyllotreta pusilla)、フィロトレタ・ラモサ(Phyllotreta ramosa)、フィロトレタ・ストリオラタ(Phyllotreta striolata)、ポピリア・ジャポニカ(Popillia japonica)、プレムノトリペス属種(Premnotrypes spp.)、プロステファヌス・トルンカツス(Prostephanus truncatus)、プシリオデス属種(Psylliodes spp.)、例えば、プシリオデス・アフィニス(Psylliodes affinis)、プシリオデス・クリソセファラ(Psylliodes chrysocephala)、プシリオデス・プンクツラタ(Psylliodes punctulata)、プチヌス属種(Ptinus spp.)、リゾビウス・ベントラリス(Rhizobius ventralis)、リゾペルタ・ドミニカ(Rhizopertha dominica)、シトフィルス属種(Sitophilus spp.)、例えば、シトフィルス・グラナリウス(Sitophilus granarius)、シトフィルス・リネアリス(Sitophilus linearis)、シトフィルス・オリザエ(Sitophilus oryzae)、シトフィルス・ゼアマイス(Sitophilus zeamais)、スフェノホルス属種(Sphenophorus spp.)、ステゴビウム・パニセウム(Stegobium paniceum)、ステルネクス属種(Sternechus spp.)、例えば、ステルネクス・パルダツス(Sternechus paludatus)、シムフィレテス属種(Symphyletes spp.)、タニメクス属種(Tanymecus spp.)、例えば、タニメクス・ジラチコリス(Tanymecus dilaticollis)、タニメクス・インジクス(Tanymecus indicus)、タニメクス・パリアツス(Tanymecus palliatus)、テネブリオ・モリトル(Tenebrio molitor)、テネブリオイデス・マウレタニクス(Tenebriooides mauretanicus)、トリボリウム属種(Tribolium spp.)、例えば、トリボリウム・アウダキス(Tribolium audax)、トリボリウム・カスタネウム(Tribolium castaneum)、トリボリウム・コンフスム(Tribolium confusum)、トロゴデルマ属種(Trogoderma spp.)、チキウス属種(Tychius spp.)、キシロトレクス属種(Xylotrechus spp.)、ザブルス属種(Zabrus spp.)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス(Zabrus tenebriooides)；

ハエ目(Diptera)の、例えば、アエデス属種(Aedes spp.)、例えば、アエデス・アエギプチ(Aedes aegypti)、アエデス・アルボピクツス(Aedes albopictus)、アエデス・スチクチクス(Aedes sticticus)、アエデス・ベキサンス(Aedes vexans)、アグロミザ属種(Agromyza spp.)、例えば、アグロミザ・フロンテラ(Agromyza frontella)、アグロミザ・パルビコルニス(Agromyza parvicornis)、アナストレファ属種(Anastrepha spp.)、アノフェレス属種(Anopheles spp.)、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス(Anopheles quadrimaculatus)、アノフェレス・ガムビアエ(Anopheles gambiae)、アスホンジリア属種(Asphondylia spp.)、バクトロセラ属種(Bactrocera spp.)、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ(Bactrocera cucurbitae)、バクトロセラ・ドルサリス(Bactrocera dorsalis)、バクトロセラ・オレアエ(Bactrocera oleae)、ビビオ・ホルツラヌス(Bibio hortulanus)、カリホラ・エリトロセファラ(Calliphora erythrocephala)、カリホラ・ビシナ(Calliphora vicina)、セラチ

チス・カピタタ (*Ceratitis capitata*)、キロノムス属種 (*Chironomus* spp.)、クリソミア属種 (*Chrysomya* spp.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、クリソゾナ・プルビアリス (*Chrysozona pluvialis*)、コクリオミア属種 (*Cochliomya* spp.)、コンタリニア属種 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ジョンソニ (*Contarinia johnsoni*)、コンタリニア・ナスツルチイ (*Contarinia nasturtii*)、コンタリニア・ピリボラ (*Contarinia pyrivora*)、コンタリニア・スクルジ (*Contarinia schulzi*)、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コンタリニア・トリチシ (*Contarinia tritici*)、コルジロビア・アントロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クリコトプス・シルベストリス (*Cricotopus sylvestris*)、クレキス属種 (*Culex* spp.)、例えば、クレキス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、クレキス・クインクエファシアツス (*Culex quinquefasciatus*)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、クリセタ属種 (*Culiseta* spp.)、クテレブラ属種 (*Cuterebra* spp.)、ダクス・オレアエ (*Dacus oleae*)、ダシネウラ属種 (*Dasineura* spp.)、例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アントクア (*Delia antiqua*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、デリア・フロリレガ (*Delia florilega*)、デリア・プラツラ (*Delia platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種 (*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ (*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種 (*Echinocnemus* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種 (*Glossina* spp.)、ハエマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種 (*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ (*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種 (*Hylemya* spp.)、ヒッポドスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種 (*Liriomyza* spp.)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ (*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレンシス (*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ (*Liriomyza sativae*)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ (*Lucilia cuprina*)、ルトゾミイア属種 (*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種 (*Mansonia* spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ (*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、パラタニタルスス属種 (*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミイア属種 (*Pegomya* spp.)、例えば、ペゴミイア・ベタエ (*Pegomya betae*)、ペゴミイア・ヒオシアミ (*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ (*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種 (*Phorbia* spp.)、ホルミア属種 (*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ (*Piophilila casei*)、プロジプロシス属種 (*Prodiplosis* spp.)、プシラ・ロサエ (*Psila rosae*)、ラゴレチス属種 (*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラ

タ (*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ (*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ (*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス (*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス (*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ポモネラ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナレ (*Simulium meridionale*)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種 (*Tetanops* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、例えば、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、チブラ・シムプレキス (*Tipula simplex*)；

カメムシ目 (*Hemiptera*) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ (*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシルトシポン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシポン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonoscena* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、(*Aonidiella aurantii*)、(*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフイス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフイス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフイス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフイス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフイス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフイス・ゴシビイ (*Aphis gossypii*)、アフイス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフイス・イリノイセンシス (*Aphis illinoisensis*)、アフイス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフイス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフイス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフイス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフイス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフイス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カ

コブシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギ
 ナタ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carnecephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプ
 ラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorit
 a onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)
 、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズ
 リナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coc
 comytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば
 、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロング
 ルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coc
 cus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus
 viridis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、
 クリプトネオサ属種 (*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種 (*C
 tenarytaina* spp.)、ダルブルス属種 (*Dalbulus* spp.)
 、ジアレウロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シト
 リ (*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis* spp.)
)、ドロシカ属種 (*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種 (*Dysaphis
 spp.*)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifol
 ia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)、
 ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*D
 ysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種 (*Empoasca* spp.)
 、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポア
 スカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ (*Empo
 asca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solana*)
)、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属
 種 (*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Eriosoma
 americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lani
 gerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリト
 ロネウラ属種 (*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種 (*Euc
 alyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura* spp
 .)、エウセリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシア
 属種 (*Ferrisia* spp.)、ゲオコックス・コフェアエ (*Geococcus
 coffeae*)、グリカスピス属種 (*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシ
 ラ・クバナ (*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ (*Hom
 alodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ (*Hyalopteru
 s pruni*)、イセリア属種 (*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・プル
 カシ (*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種 (*Idiocerus* s
 pp.)、イジオスコプス属種 (*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス
 ・ストリアテルス (*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種
 (*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ (*Lecanium co
 rni*) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Parthenolecanium co
 rni*))、レピドサフェス属種 (*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レ
 ピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ
 (*Lipaphis erysimi*)、マクロシフム属種 (*Macrosiphum*

spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lilii*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンズ (*Macrosteles fascifrons*)、マハナルバ属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・プリーノサ (*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス (*Monelliopsis pecanidis*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotianae*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ニラバルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrionea* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrionea cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenerae*)、ペレグリンウス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトプルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriiformis*)、プセウダウラカスピス (*Pseudaulacaspis* pentagona)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロングスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* s

pp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidiotus* spp.)、
 例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランズレギアエ (*Quadraspidiotu*
s juglansregiae)、クアドラスピジオツス・オストレアエホルミス (*Q*
uadraspidiotus ostreaeformis)、クアドラスピジオツス
 ・ペルニシオス (*Quadraspidiotus perniciosus*)、クエ
 サダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス属種 (*Rastroc*
occus spp.)、ロパロシウム属種 (*Rhopalosiphum* spp.)
 、例えば、ロパロシウム・マイジス (*Rhopalosiphum maidis*)、ロ
 パロシウム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum oxyacanthae*
)、ロパロシウム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)、ロパロシウム・
 ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdominale*)、
 サイセチア属種 (*Saissetia* spp.)、例えば、サイセチア・コフェアエ (*S*
aissetia coffeae)、サイセチア・ミランダ (*Saissetia*
miranda)、サイセチア・ネグレクトア (*Saissetia neglecta*)
 、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホイデウス・チタヌ
 ス (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラミナム (*Schi*
zaphis graminum)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenas*
pidus articulatus)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion a*
venae)、ソガタ属種 (*Sogata* spp.)、ソガテラ・フルシフェラ (*So*
gatella furcifera)、ソガトデス属種 (*Sogatodes* spp
 .)、スティクトセファラ・フェスチナ (*Stictocephala festina*)
 、シホニヌス・フィリレアエ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラ
 ファラ・マライエンシス (*Tenalaphara malayensis*)、テトラゴ
 ノセフェラ属種 (*Tetragonocephala* spp.)、チノカリス・カリア
 エホリアエ (*Tinocallis caryaefoliae*)、トマスピス属種 (*T*
omaspis spp.)、トキシプロテラ属種 (*Toxoptera* spp.)、例
 えば、トキシプロテラ・アウランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシ
 プテラ・シトリシズス (*Toxoptera citricidus*)、トリアレウロデ
 ス・バポラリオルム (*Trialeurodes vaporariorum*)、トリオ
 ザ属種 (*Trioza* spp.)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza d*
iospyri)、チフロシバ属種 (*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属
 種 (*Unaspis* spp.)、ビテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifo*
lii)、ジギナ属種 (*Zygina* spp.) ;

カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アナサ・トリスチス (*Anas*
a tristis)、アンテスチオプシス属種 (*Antestiopsis* spp.
)、ボイセア属種 (*Boisea* spp.)、ブリスス属種 (*Blissus* spp
 .)、カロコリス属種 (*Calocoris* spp.)、カムピロンマ・リビダ (*Ca*
mpylomma livida)、カベレリウス属種 (*Cavelerius* spp
 .)、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、例えば、シメキス・アドジュンクツス (*C*
imex adjunctus)、シメキス・ヘミプテルス (*Cimex hemip*
terus)、シメキス・レクツラリウス (*Cimex lectularius*)、シ
 メキス・ピロセルス (*Cimex pilosellus*)、コラリア属種 (*Colla*
ria spp.)、クレオンチアデス・ジルツス (*Creontiades dilu*
tus)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynus piperis*)、ジケロプス・フル
 カツス (*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウエッチ (*Dic*
onocoris hewetti)、ジスデルクス属種 (*Dysdercus* spp
 .)、エウスキスツス属種 (*Euschistus* spp.)、例えば、エウスキスツ
 ス・ヘロス (*Euschistus heros*)、エウスキスツス・セルブス (*Eus*
chistus servus)、エウスキスツス・トリスチグムス (*Euschist*
us tristigmus)、エウスキスツス・バリオラリウス (*Euschistu*

s variolarius)、エウリガステル属種 (Eurygaster spp.)、ハリオモルファ・ハリス (Halyomorpha halys)、ヘリオパルチス属種 (Heliopeletis spp.)、ホルシアス・ノビレルス (Horcias nobilellus)、レプトコリサ属種 (Leptocorisa spp.)、レプトコリサ・バリコルニス (Leptocorisa varicornis)、レプトグロスス・オッシデンタリス (Leptoglossus occidentalis)、レプトグロスス・フィロプス (Leptoglossus phyllopus)、リゴコリス属種 (Lygocoris spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (Lygocoris pabulinus)、リグス属種 (Lygus spp.)、例えば、リグス・エリスス (Lygus elisus)、リグス・ヘスペルス (Lygus hesperus)、リグス・リネオラルリス (Lygus lineolaris)、マクロペス・エキスカバツス (Macropes excavatus)、モナロニオン・アトラツム (Monalunion atratum)、ネザラ属種 (Nezara spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (Nezara viridula)、オエバルス属種 (Oebalus spp.)、ピエスマ・クアドラタ (Piesma quadrata)、ピエゾドルス属種 (Piezodorus spp.)、例えば、ピエゾドルス・グイルジニイ (Piezodorus guildinii)、プサルス属種 (Psallus spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (Pseudacysta perseae)、ロドニウス属種 (Rhodnius spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (Sahlbergella singularis)、スカプトコリス・カスターネア (Scaptocoris castanea)、スコチノホラ属種 (Scotinophora spp.)、ステファニチス・ナシ (Stephanitis nashi)、チブラカ属種 (Tibraca spp.)、トリアトマ属種 (Triatomas spp.) ;

ハチ目 (Hymenoptera) の、例えば、アクロミルメキス属種 (Acromyrmex spp.)、アタリア属種 (Athalia spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (Athalia rosae)、アッタ属種 (Atta spp.)、ジブリオン属種 (Diprion spp.)、例えば、ジブリオン・シミリス (Diprion similis)、ホプロカムパ属種 (Hopllocampa spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (Hopllocampa cookei)、ホプロカムパ・テスツジネア (Hopllocampa testudinea)、ラシウス属種 (Lasius spp.)、リネピテマ・フミレ (Linepithema humile)、モノモリウム・ファラオニス (Monomorium pharaonis)、シレキス属種 (Sirex spp.)、ソレノプシス・インビクタ (Solenopsis invicta)、タピノマ属種 (Tapinoma spp.)、ウロセルス属種 (Urocerus spp.)、ベスパ属種 (Vespa spp.)、例えば、ベスパ・クラブロ (Vespa crabro)、キセリス属種 (Xeris spp.) ;

ワラジムシ目 (Isopoda) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (Armadillidium vulgare)、オニスクス・アセルス (Oniscus asellus)、ポルセリオ・スカベル (Porcellio scaber) ;

シロアリ目 (Isoptera) の、例えば、コプトテルメス属種 (Coptotermes spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (Coptotermes formosanus)、コルニテルメス・クムランズ (Cornitermes cumulans)、クリプトテルメス属種 (Cryptotermes spp.)、インシシテルメス属種 (Incisitermes spp.)、ミクロテルメス・オベシ (Microtermes obesi)、オドントテルメス属種 (Odontotermes spp.)、レチクリテルメス属種 (Reticulitermes spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (Reticulitermes flavipes)、レチクリテルメス・ヘスペルス (Reticulitermes hesperus) ;

10

20

30

40

50

チョウ目 (Lepidoptera) の、例えば、アクロイア・グリセラ (Achr^oia grisella)、アクロニクタ・マジョル (Acr^onic^ta major)、アドキシフィエス属種 (Adoxoph^yes spp.)、例えば、アドキシフィエス・オラナ (Adoxoph^yes orana)、アエジア・レウコメラス (Aedⁱa leucomelas)、アグロチス属種 (Agrotⁱs spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (Agrotⁱs segetum)、アグロチス・イプシロン (Agrotⁱs ipsilon)、アラバマ属種 (Alabama spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (Alabama argill^acea)、アミエロイス・トランシテラ (Amyeloⁱs transitella)、アナルシア属種 (Anarsⁱa spp.)、アンチカルシア属種 (Anticarsⁱa spp.)、
 10 例例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (Anticarsⁱa gemmatalis)、アルギロプロセ属種 (Argyroploce spp.)、バラトラ・ブラシカエ (Barathra brassicae)、ボルボ・シンナラ (Borbo cin nara)、ブクラトリキス・ツルベリエラ (Bucculat^rix thurber iella)、ブパルス・ピニアリウス (Bupalus pinia^rius)、ブッセオラ属種 (Busseola spp.)、カコエシア属種 (Cacoecⁱa spp.)、カロプチリア・テイボラ (Caloptilⁱa theivora)、カプア・レチクラナ (Capua reticulana)、カルポカプサ・ポモネラ (Carpo caps^a pomonella)、カルポシナ・ニポネンシス (Carposi na niponensis)、ケイマトビア・ブルマタ (Cheimatobia b
 20 rumata)、キロ属種 (Chilo spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (Chilo plejadellus)、キロ・スプレッサリス (Chilo supp ressalis)、コリストネウラ属種 (Choristoneura spp.)、クリシア・アムビグエラ (Clysia ambiguel^la)、クナファロセルス属種 (Cnaphalocerus spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (Cn aphalocrocⁱs medinalis)、クネファシア属種 (Cnephas ia spp.)、コノボモルファ属種 (Conopomorpha spp.)、コノトラケルス属種 (Conotrachelus spp.)、コピタルシア属種 (Cop itarsia spp.)、シジア属種 (Cydia spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ (Cydia nigricana)、シジア・ポモネラ (Cydia po
 30 monella)、ダラカ・ノクツイデス (Dalaca noctuides)、ジアファニア属種 (Diaphania spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (Dia tra^ea saccharalis)、エアリアス属種 (Earias spp.)、エクジトロファ・アウランチュム (Ecdytolopha aurantⁱum)、エラスモバルプス・リグノセルス (Elasmopalpus lignosellus)、エルダナ・サッカリナ (Eldana saccharina)、エフェスチア属種 (Ephes^tia spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (Ephes^tia elutella)、エフェスチア・クエーニエラ (Ephes^tia kuehnie lla)、エピノチア属種 (Epino^tia spp.)、エピフィアス・ポストビッ
 40 タナ (Epiphyas postvittana)、エチエラ属種 (Etiella spp.)、エウリア属種 (Eulia spp.)、エウポエシリア・アムビグエラ (Eupoecilia ambiguel^la)、エウプロクチス属種 (Euproct is spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (Euproctⁱs ch rysorrhoea)、エウキソア属種 (Euxoa spp.)、フェルチア属種 (Feltⁱa spp.)、ガレリア・メロネラ (Galleria mellonella)、グラシラリア属種 (Gracillaria spp.)、グラホリタ属種 (G rapholitha spp.)、例えば、グラホリタ・モレストタ (Grapholi ta molest^a)、グラホリタ・プルニボラ (Grapholita pruni vora)、ヘジレプタ属種 (Hedylepta spp.)、ヘリコベルパ属種 (H elicoverpa spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (Helico
 50

verpa armigera)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テスツラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セバラタ (*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketicus* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonorycter crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Platynota stultana*)、プロジア・インテルプンクテラ (*Plodia interpunctella*)、プルシア属種 (*Plusia* spp.)、プルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*) (=プルテラ・マクリペンニス (*Plutella maculipennis*))、プライス属種 (*Prays* spp.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、プロトバルセ属種 (*Protoparce* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseudaletia* spp.)、例えば、プセウダレチア・ユニプンクタ (*Pseudaletia unipuncta*)、プセウドプルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、ラキプルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウス属種 (*Schoenobius* sp

p.)、例えば、スコエノビウス・ビブクチフェル (*Schoenobius bipunctifer*)、シルポファガ属種 (*Scirpophaga* spp.)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpophaga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパルガノチス属種 (*Sparganothis* spp.)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギペルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・プラエフィカ (*Spodoptera praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ (*Stomopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthedon* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cloacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pelionella*)、チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペトゼラ (*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属種 (*Trichoplusia* spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*Tuta absoluta*)、ビラコラ属種 (*Virachola* spp.) ;

バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ジクロプルス属種 (*Dichroplus* spp.)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種 (*Locusta* spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプルス属種 (*Melanoplus* spp.)、例えば、メラノプルス・デバスタトル (*Melanoplus devastator*)、パラトランチクス・ウスリエンシス (*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinia* spp.)、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属種 (*Linognathus* spp.)、ペジクルス属種 (*Pediculus* spp.)、フィロキセラ・バスタトリキス (*Phylloxera vastatrix*)、フチルス。プビス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp.) ;

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) の、例えば、レピノツス属種 (*Lepinotus* spp.)、リポセルリス属種 (*Liposcelis* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレキス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、キセノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) ;

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、ドレパノトリプス・レウテリ (*Drepanothrips leutheri*) ;

nothrips reuteri)、エンネオトリプス・フラベンス(Enneothrips flavens)、フランクリニエラ属種(Frankliniella spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ(Frankliniella fusc a)、フランクリニエラ・オッシデンタリス(Frankliniella occidentalis)、フランクリニエラ・スクルトゼイ(Frankliniella schultzei)、フランクリニエラ・トリチシ(Frankliniella tritici)、フランクリニエラ・バシニイ(Frankliniella vaccini i)、フランクリニエラ・ウィリアムシ(Frankliniella williamsi)、ヘリオトリプス属種(Heliothrips spp.)、ヘルシノトリプス・フェモラリス(Hercinothrips femoralis)、リピホトリプス・クルエンタツス(Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトトリプス属種(Scirtothrips spp.)、タエニオトリプス・カルダモミ(Taeniothrips cardamomi)、トリプス属種(Thrips spp.)、例えば、トリプス・パルミ(Thrips palmi)、トリプスタバシ(Thrips tabaci)；

シミ目(Zygentoma(=Thysanura))の、例えば、クテノレピスマ属種(Ctenolepisma spp.)、レピスマ・サッカリナ(Lepisma saccharina)、レスピモデス・インクイリヌス(Lepismodes inquilinus)、テルモビア・ドメスチカ(Thermobia domestica)；

コムカデ綱(Symphyla)の、例えば、スクチゲレラ属種(Scutigere lla spp.)、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ(Scutigere lla immaculata)；

軟体動物門(Mollusca)の害虫、例えば、ニマイガイ綱(Bivalvia)の、例えば、ドレイセナ属種(Dreissena spp.)；及び、さらに、

マキガイ綱(Gastropoda)の、例えば、アリオン属種(Arion spp.)、例えば、アリオン・アテル・ルフス(Arion ater rufus)、ビオムファラリア属種(Biomphalaria spp.)、ブリヌス属種(Bulinus spp.)、デロセラス属種(Deroceras spp.)、例えば、デロセラス・ラエベ(Deroceras laeve)、ガルバ属種(Galba spp.)、リムナエア属種(Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種(Oncomelania spp.)、ポマセア属種(Pomacea spp.)、スクシネア属種(Succinea spp.)；

扁形動物門(Platyhelminthes)及び線形動物門(Nematoda)の、動物及びヒトの寄生生物、例えば、アエルロストロンギルス属種(Aelurostrongylus spp.)、アミドストムム属種(Amidostomum spp.)、アンシロストマ属種(Ancylostoma spp.)、アンギオストロンギルス属種(Angiostrongylus spp.)、アニサキス属種(Anisakis spp.)、アノプロセファラ属種(Anoplocephala spp.)、アスカリス属種(Ascaris spp.)、アスカリジア属種(Ascaridia spp.)、バイリサスカリス属種(Baylisascaris spp.)、ブルギア属種(Brugia spp.)、ブノストムム属種(Bunostomum spp.)、カピラリア属種(Capillaria spp.)、カベルチア属種(Cha bertia spp.)、クロノルキス属種(Clonorchis spp.)、コオペリア属種(Cooperia spp.)、クレノソマ属種(Crenosoma spp.)、シアトストマ属種(Cyathostoma spp.)、ジクロコエリウム属種(Dicrocoelium spp.)、ジクチオカウルス属種(Dictyocaulus spp.)、ジフィロボトリウム属種(Diphyllbothrium spp.)、ジフィリジウム属種(Dipylidium spp.)、ジロフィラリア(Dirofilaria spp.)、ドラクンクルス属種(Dracuncul

10

20

30

40

50

us spp.)、エキノコックス属種 (Echinococcus spp.)、エキ
 ノストマ属種 (Echinostoma spp.)、エンテロビウス属種 (Enter
 obius spp.)、エウコレウス属種 (Eucoleus spp.)、ファシオ
 ラ属種 (Fasciola spp.)、ファシオロイデス属種 (Fascioloid
 es spp.)、ファシオロプシス属種 (Fasciolopsis spp.)、フ
 ィラロイデス属種 (Filaroides spp.)、ゴンギロネマ属種 (Gongy
 lonema spp.)、ギロダクチルス属種 (Gyrodactylus spp.
)、ハプロネマ属種 (Habronema spp.)、ハエモンクス属種 (Haemo
 nchus spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (Heligmosomoides
 spp.)、ヘテラキス属種 (Heterakis spp.)、ヒメノレピス属種 (H
 ymenolepis spp.)、ヒオストロンギルス属種 (Hyostrongyl
 us spp.)、リトモソイデス属種 (Litomosoides spp.)、ロア
 属種 (Loa spp.)、メタストロンギルス属種 (Metastrongylus
 spp.)、メトルキス属種 (Metorchis spp.)、メソセストイデス属種
 (Mesocestoides spp.)、モニエジア属種 (Moniezia sp
 p.)、ムエレリウス属種 (Muellerius spp.)、ネカトル属種 (Nec
 ator spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ニッ
 ポストロンギルス属種 (Nippostrongylus spp.)、オエソファゴス
 トムム属種 (Oesophagostomum spp.)、オルラヌス属種 (Ollu
 lanus spp.)、オンコセルカ属種 (Onchocerca spp.)、オピス
 トルキス属種 (Opisthorchis spp.)、オスレルス属種 (Osleru
 s spp.)、オステルタギア属種 (Ostertagia spp.)、オキシウリ
 ス属種 (Oxyuris spp.)、パラカピラリア属種 (Paracapillar
 ia spp.)、パラフィラリア属種 (Parafilaria spp.)、パラゴ
 ニムス属種 (Paragonimus spp.)、パラムフィストムム属種 (Para
 mphistomum spp.)、パラノプロセファラ属種 (Paranoploce
 phala spp.)、パラスカリス属種 (Parascaris spp.)、パッ
 サルルス属種 (Passalurus spp.)、プロトストロンギルス属種 (Pro
 tostrongylus spp.)、スキストソマ属種 (Schistosoma
 spp.)、セタリア属種 (Setaria spp.)、スピロセルカ属種 (Spir
 ocerca spp.)、ステファノフィラリア属種 (Stephanofilaria
 spp.)、ステファヌルス属種 (Stephanurus spp.)、ストロン
 ギロイデス属種 (Strongyloides spp.)、ストロンギルス属種 (St
 rongylus spp.)、シンガムス属種 (Syngamus spp.)、タエ
 ニア属種 (Taenia spp.)、テラドルサギア属種 (Teladorsagia
 spp.)、テラジア属種 (Thelazia spp.)、トキサスカリス属種 (T
 oxascaris spp.)、トキシカラ属種 (Toxocara spp.)、トリ
 キネラ属種 (Trichinella spp.)、トリコビルハルジア属種 (Tri
 chobilharzia spp.)、トリコストロンギルス属種 (Trichost
 rongylus spp.)、トリクリス属種 (Trichuris spp.)、ウ
 ンシナリア属種 (Uncinaria spp.)、ウケレリア属種 (Wucherer
 ia spp.) ;

線形動物門 (Nematoda) の植物害虫 (即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレ
 ンクス属種 (Aglencbus spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (A
 glencbus agricola)、アングイナ属種 (Anguina spp.)
 、例えば、アングイナ・トリチシ (Anguina tritici)、アフエレンコイ
 デス属種 (Aphelenchooides spp.)、例えば、アフエレンコイデス・
 アラキジス (Aphelenchooides arachididis)、アフエレンコイデ
 ス・フラガリアエ (Aphelenchooides fragariae)、ペロノライ
 ムス属種 (Belonolaimus spp.)、例えば、ペロノライムス・グラシリ

60
40
20
0

nema spp.)、スバングイナ属種 (Subanguina spp.)、トリコドルス属種 (Trichodorus spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス (Trichodorus obtusus)、トリコドルス・プリミチブス (Trichodorus primitivus)、チレンコリンクス属種 (Tylenchorhynchus spp.)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス (Tylenchorhynchus annulatus)、チレンクルス属種 (Tylenchulus spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (Tylenchulus semipenetrans)、キシフィネマ属種 (Xiphinema spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス (Xiphinema index)。

【0211】

さらにまた、原生動物亜界 (Protozoa) の、コクシジウム目 (Coccidia)、例えば、エイメリア属種 (Eimeria spp.) なども防除することができる。

【0212】

式 (I) で表される化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (microbicide) 若しくは除雄剤 (gametocide) として、例えば、殺菌剤 (fungicide)、抗真菌剤 (antimycotic)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する) としても使用し得るか、又は、MLO (マイコプラズマ様生物) 及び RLO (リケッチア様生物) に対する作用薬としても使用し得る。適切な場合には、式 (I) で表される化合物は、別の活性成分を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【0213】

製剤

本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態〔例えば、灌注液、滴下液及び散布液〕にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、及び／又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油 (例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油 (例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル (例えば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル)、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び／又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び／又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩 (例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム)、及び／又は、保持促進剤 (retention promoter) (例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアールポリマー)、及び／又は、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、及び／又は、肥料 (例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料) を含有する。

【0214】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルジョン剤 (EW)、懸濁製剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、顆粒剤 (GR)、カプセル製剤 (capsule concentrates) (CS)； これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173 (作製元：the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、式 (I) で表される1種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性成分を含有する。

【0215】

これらは、好ましくは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤（spontaneity promoter）、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤（frost protectant）、殺生物剤、増粘剤及び／又は他の補助剤（例えば、アジュバント）など〕を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的活性を向上させる成分であって、その成分自体が生物学的活性を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張（spreading）特性、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

【0216】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式（I）で表される化合物を補助剤（例えば、増量剤、溶媒及び／若しくは固体担体、並びに／又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤）と混合させることにより調製する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

10

【0217】

使用する補助剤は、式（I）で表される化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態（例えば、即時使用可能な（ready-to-use）殺有害生物剤、例えば、散布液又は種子粉衣製品）に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び／又は生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

【0218】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである： 芳香族及び非芳香族の炭化水素類（例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類）、アルコール類及びポリオール類（これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び／又は、エステル化されていてもよい）、ケトン類（例えば、アセトン、シクロヘキサノン）、エステル類（これは、脂肪類及び油類を包含する）及び（ポリ）エーテル類、置換されていない及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類）、及び、ラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）。

20

【0219】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒としては、本質的に以下のものなどがある： 芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサノン又はパラフィン類、例えば、鉱油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、又は、水。

30

【0220】

原則として、適切な任意の溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサノン、パラフィン類、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、及び、さらに、水である。

40

【0221】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、粉碎された天

50

然鉱物、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、粉碎された合成鉱物、例えば、微粉化シリカ、アルミナ、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及び／又は、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粗びき粉からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

【0222】

液化ガスの増量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に適しているのは、標準温度及び標準圧力下では気体である増量剤又は担体、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロ炭化水素類、又は、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【0223】

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステル塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（I）で表される化合物のうちの1種類及び／又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

【0224】

該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤は、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

【0225】

さらに、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤も存在させることができる。さらに、泡形成剤又は消泡剤も存在させることができる。

【0226】

さらにまた、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる可能な補助剤は、鉱油及び植物油である。

【0227】

場合により、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式（I）で表される化合物は、製剤を目的として通常使

用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【0228】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質（例えば、スルホコハク酸ジオクチル）又は粘弾性を増大させる全ての物質（例えば、ヒドロキシプロピルグアールポリマー）が包含される。

【0229】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性成分の浸透を向上させるために典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、（一般には、水性の）施用液から、及び／又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性成分のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート（coconut fatty ethoxylate）（10）若しくはイソトリデシルエトキシレート（12）、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート（15）、又は、アンモニウム塩及び／若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げる
10
20
30
40
50
60
70
80
90
100
110
120
130
140
150
160
170
180
190
200
210
220
230
240
250
260
270
280
290
300
310
320
330
340
350
360
370
380
390
400
410
420
430
440
450
460
470
480
490
500
510
520
530
540
550
560
570
580
590
600
610
620
630
640
650
660
670
680
690
700
710
720
730
740
750
760
770
780
790
800
810
820
830
840
850
860
870
880
890
900
910
920
930
940
950
960
970
980
990
1000
1010
1020
1030
1040
1050
1060
1070
1080
1090
1100
1110
1120
1130
1140
1150
1160
1170
1180
1190
1200
1210
1220
1230
1240
1250
1260
1270
1280
1290
1300
1310
1320
1330
1340
1350
1360
1370
1380
1390
1400
1410
1420
1430
1440
1450
1460
1470
1480
1490
1500
1510
1520
1530
1540
1550
1560
1570
1580
1590
1600
1610
1620
1630
1640
1650
1660
1670
1680
1690
1700
1710
1720
1730
1740
1750
1760
1770
1780
1790
1800
1810
1820
1830
1840
1850
1860
1870
1880
1890
1900
1910
1920
1930
1940
1950
1960
1970
1980
1990
2000
2010
2020
2030
2040
2050
2060
2070
2080
2090
2100
2110
2120
2130
2140
2150
2160
2170
2180
2190
2200
2210
2220
2230
2240
2250
2260
2270
2280
2290
2300
2310
2320
2330
2340
2350
2360
2370
2380
2390
2400
2410
2420
2430
2440
2450
2460
2470
2480
2490
2500
2510
2520
2530
2540
2550
2560
2570
2580
2590
2600
2610
2620
2630
2640
2650
2660
2670
2680
2690
2700
2710
2720
2730
2740
2750
2760
2770
2780
2790
2800
2810
2820
2830
2840
2850
2860
2870
2880
2890
2900
2910
2920
2930
2940
2950
2960
2970
2980
2990
3000
3010
3020
3030
3040
3050
3060
3070
3080
3090
3100
3110
3120
3130
3140
3150
3160
3170
3180
3190
3200
3210
3220
3230
3240
3250
3260
3270
3280
3290
3300
3310
3320
3330
3340
3350
3360
3370
3380
3390
3400
3410
3420
3430
3440
3450
3460
3470
3480
3490
3500
3510
3520
3530
3540
3550
3560
3570
3580
3590
3600
3610
3620
3630
3640
3650
3660
3670
3680
3690
3700
3710
3720
3730
3740
3750
3760
3770
3780
3790
3800
3810
3820
3830
3840
3850
3860
3870
3880
3890
3900
3910
3920
3930
3940
3950
3960
3970
3980
3990
4000
4010
4020
4030
4040
4050
4060
4070
4080
4090
4100
4110
4120
4130
4140
4150
4160
4170
4180
4190
4200
4210
4220
4230
4240
4250
4260
4270
4280
4290
4300
4310
4320
4330
4340
4350
4360
4370
4380
4390
4400
4410
4420
4430
4440
4450
4460
4470
4480
4490
4500
4510
4520
4530
4540
4550
4560
4570
4580
4590
4600
4610
4620
4630
4640
4650
4660
4670
4680
4690
4700
4710
4720
4730
4740
4750
4760
4770
4780
4790
4800
4810
4820
4830
4840
4850
4860
4870
4880
4890
4900
4910
4920
4930
4940
4950
4960
4970
4980
4990
5000
5010
5020
5030
5040
5050
5060
5070
5080
5090
5100
5110
5120
5130
5140
5150
5160
5170
5180
5190
5200
5210
5220
5230
5240
5250
5260
5270
5280
5290
5300
5310
5320
5330
5340
5350
5360
5370
5380
5390
5400
5410
5420
5430
5440
5450
5460
5470
5480
5490
5500
5510
5520
5530
5540
5550
5560
5570
5580
5590
5600
5610
5620
5630
5640
5650
5660
5670
5680
5690
5700
5710
5720
5730
5740
5750
5760
5770
5780
5790
5800
5810
5820
5830
5840
5850
5860
5870
5880
5890
5900
5910
5920
5930
5940
5950
5960
5970
5980
5990
6000
6010
6020
6030
6040
6050
6060
6070
6080
6090
6100
6110
6120
6130
6140
6150
6160
6170
6180
6190
6200
6210
6220
6230
6240
6250
6260
6270
6280
6290
6300
6310
6320
6330
6340
6350
6360
6370
6380
6390
6400
6410
6420
6430
6440
6450
6460
6470
6480
6490
6500
6510
6520
6530
6540
6550
6560
6570
6580
6590
6600
6610
6620
6630
6640
6650
6660
6670
6680
6690
6700
6710
6720
6730
6740
6750
6760
6770
6780
6790
6800
6810
6820
6830
6840
6850
6860
6870
6880
6890
6900
6910
6920
6930
6940
6950
6960
6970
6980
6990
7000
7010
7020
7030
7040
7050
7060
7070
7080
7090
7100
7110
7120
7130
7140
7150
7160
7170
7180
7190
7200
7210
7220
7230
7240
7250
7260
7270
7280
7290
7300
7310
7320
7330
7340
7350
7360
7370
7380
7390
7400
7410
7420
7430
7440
7450
7460
7470
7480
7490
7500
7510
7520
7530
7540
7550
7560
7570
7580
7590
7600
7610
7620
7630
7640
7650
7660
7670
7680
7690
7700
7710
7720
7730
7740
7750
7760
7770
7780
7790
7800
7810
7820
7830
7840
7850
7860
7870
7880
7890
7900
7910
7920
7930
7940
7950
7960
7970
7980
7990
8000
8010
8020
8030
8040
8050
8060
8070
8080
8090
8100
8110
8120
8130
8140
8150
8160
8170
8180
8190
8200
8210
8220
8230
8240
8250
8260
8270
8280
8290
8300
8310
8320
8330
8340
8350
8360
8370
8380
8390
8400
8410
8420
8430
8440
8450
8460
8470
8480
8490
8500
8510
8520
8530
8540
8550
8560
8570
8580
8590
8600
8610
8620
8630
8640
8650
8660
8670
8680
8690
8700
8710
8720
8730
8740
8750
8760
8770
8780
8790
8800
8810
8820
8830
8840
8850
8860
8870
8880
8890
8900
8910
8920
8930
8940
8950
8960
8970
8980
8990
9000
9010
9020
9030
9040
9050
9060
9070
9080
9090
9100
9110
9120
9130
9140
9150
9160
9170
9180
9190
9200
9210
9220
9230
9240
9250
9260
9270
9280
9290
9300
9310
9320
9330
9340
9350
9360
9370
9380
9390
9400
9410
9420
9430
9440
9450
9460
9470
9480
9490
9500
9510
9520
9530
9540
9550
9560
9570
9580
9590
9600
9610
9620
9630
9640
9650
9660
9670
9680
9690
9700
9710
9720
9730
9740
9750
9760
9770
9780
9790
9800
9810
9820
9830
9840
9850
9860
9870
9880
9890
9900
9910
9920
9930
9940
9950
9960
9970
9980
9990
10000

【0230】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.000000001重量%～98重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、特に好ましくは、0.01重量%～95重量%の式（I）で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.5重量%～90重量%の式（I）で表される化合物を含んでいる。

【0231】

該製剤（特に、殺有害生物剤）から調製された使用形態の中の式（I）で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式（I）で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.000000001重量%～95重量%の式（I）で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%～1重量%の式（I）で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。
10
20
30
40
50
60
70
80
90
100
110
120
130
140
150
160
170
180
190
200
210
220
230
240
250
260
270
280
290
300
310
320
330
340
350
360
370
380
390
400
410
420
430
440
450
460
470
480
490
500
510
520
530
540
550
560
570
580
590
600
610
620
630
640
650
660
670
680
690
700
710
720
730
740
750
760
770
780
790
800
810
820
830
840
850
860
870
880
890
900
910
920
930
940
950
960
970
980
990
1000
1010
1020
1030
1040
1050
1060
1070
1080
1090
1100
1110
1120
1130
1140
1150
1160
1170
1180
1190
1200
1210
1220
1230
1240
1250
1260
1270
1280
1290
1300
1310
1320
1330
1340
1350
1360
1370
1380
1390
1400
1410
1420
1430
1440
1450
1460
1470
1480
1490
1500
1510
1520
1530
1540
1550
1560
1570
1580
1590
1600
1610
1620
1630
1640
1650
1660
1670
1680
1690
1700
1710
1720
1730
1740
1750
1760
1770
1780
1790
1800
1810
1820
1830
1840
1850
1860
1870
1880
1890
1900
1910
1920
1930
1940
1950
1960
1970
1980
1990
2000
2010
2020
2030
2040
2050
2060
2070
2080
2090
2100
2110
2120
2130
2140
2150
2160
2170
2180
2190
2200
2210
2220
2230
2240
2250
2260
2270
2280
2290
2300
2310
2320
2330
2340
2350
2360
2370
2380
2390
2400
2410
2420
2430
2440
2450
2460
2470
2480
2490
2500
2510
2520
2530
2540
2550
2560
2570
2580
2590
2600
2610
2620
2630
2640
2650
2660
2670
2680
2690
2700
2710
2720
2730
2740
2750
2760
2770
2780
2790
2800
2810
2820
2830
2840
2850
2860
2870
2880
2890
2900
2910
2920
2930
2940
2950
2960
2970
2980
2990
3000
3010
3020
3030
3040
3050
3060
3070
3080
3090
3100
3110
3120
3130
3140
3150
3160
3170
3180
3190
3200
3210
3220
3230
3240
3250
3260
3270
3280
3290
3300
3310
3320
3330
3340
3350
3360
3370
3380
3390
3400
3410
3420
3430
3440
3450
3460
3470
3480
3490
3500
3510
3520
3530
3540
3550
3560
3570
3580
3590
3600
3610
3620
3630
3640
3650
3660
3670
3680
3690
3700
3710
3720
3730
3740
3750
3760
3770
3780
3790
3800
3810
3820
3830
3840
3850
3860
3870
3880
3890
3900
3910
3920
3930
3940
3950
3960
3970
3980
3990
4000
4010
4020
4030
4040
4050
4060
4070
4080
4090
4100
4110
4120
4130
4140
4150
4160
4170
4180
4190
4200
4210
4220
4230
4240
4250
4260
4270
4280
4290
4300
4310
4320
4330
4340
4350
4360
4370
4380
4390
4400
4410
4420
4430
4440
4450
4460
4470
4480
4490
4500
4510
4520
4530
4540
4550
4560
4570
4580
4590
4600
4610
4620
4630
4640
4650
4660
4670
4680
4690
4700
4710
4720
4730
4740
4750
4760
4770
4780
4790
4800
4810
4820
4830
4840
4850
4860
4870
4880
4890
4900
4910
4920
4930
4940
4950
4960
4970
4980
4990
5000
5010
5020
5030
5040
5050
5060
5070
5080
5090
5100
5110
5120
5130
5140
5150
5160
5170
5180
5190
5200
5210
5220
5230
5240
5250
5260
5270
5280
5290
5300
5310
5320
5330
5340
5350
5360
5370
5380
5390
5400
5410
5420
5430
5440
5450
5460
5470
5480
5490
5500
5510
5520
5530
5540
5550
5560
5570
5580
5590
5600
5610
5620
5630
5640
5650
5660
5670
5680
5690
5700
5710
5720
5730
5740
5750
5760
5770
5780
5790
5800
5810
5820
5830
5840
5850
5860
5870
5880
5890
5900
5910
5920
5930
5940
5950
5960
5970
5980
5990
6000
6010
6020
6030
6040
6050
6060
6070
6080
6090
6100
6110
6120
6130
6140
6150
6160
6170
6180
6190
6200
6210
6220
6230
6240
6250
6260
6270
6280
6290
6300
6310
6320
6330
6340
6350
6360
6370
6380
6390
6400
6410
6420
6430
6440
6450
6460
6470
6480
6490
6500
6510
6520
6530
6540
6550
6560
6570
6580
6590
6600
6610
6620
6630
6640
6650
6660
6670
6680
6690
6700
6710
6720
6730
6740
6750
6760
6770
6780
6790
6800
6810
6820
6830
6840
6850
6860
6870
6880
6890
6900
6910
6920
6930
6940
6950
6960
6970
6980
6990
7000
7010
7020
7030
7040
7050
7060
7070
7080
7090
7100
7110
7120
7130
7140
7150
7160
7170
7180
7190
7200
7210
7220
7230
7240
7250
7260
7270
7280
7290
7300
7310
7320
7330
7340
7350
7360
7370
7380
7390
7400
7410
7420
7430
7440
7450
7460
7470
7480
7490
7500
7510
7520
7530
7540
7550
7560
7570
7580
7590
7600
7610
7620
7630
7640
7650
7660
7670
7680
7690
7700
7710
7720
7730
7740
7750
7760
7770
7780
7790
7800
7810
7820
7830
7840
7850
7860
7870
7880
7890
7900
7910
7920
7930
7940
7950
7960
7970
7980
7990
8000
8010
8020
8030
8040
8050
8060
8070
8080
8090
8100
8110
8120
8130
8140
8150
8160
8170
8180
8190
8200
8210
8220
8230
8240
8250
8260
8270
8280
8290
8300
8310
8320
8330
8340
8350
8360
8370
8380
8390
8400
8410
8420
8430
8440
8450
8460
8470
8480
8490
8500
8510
8520
8530
8540
8550
8560
8570
8580
8590
8600
8610
8620
8630
8640
8650
8660
8670
8680
8690
8700
8710
8720
8730
8740
8750
8760
8770
8780
8790
8800
8810
8820
8830
8840
8850
8860
8870
8880
8890
8900
8910
8920
8930
8940
8950
8960
8970
8980
8990
9000
9010
9020
9030
9040
9050
9060
9070
9080
9090
9100
9110
9120
9130
9140
9150
9160
9170
9180
9190
9200
9210
9220
9230
9240
9250
9260
9270
9280
9290
9300
9310
9320
9330
9340
9350
936

剤、及び／又は、鳥忌避剤、及び／又は、植物活性化剤、及び／又は、成長調節剤、及び／又は、肥料）との混合物の中に存在させることもできる。同様に、式（I）で表される化合物は、植物の特性（例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質）を向上させるための作用剤と混合して使用することも可能である。

【0234】

本発明の特定の実施形態では、式（I）で表される化合物は、製剤の形態又はそのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物（好ましくは、以下に記載されている化合物）と混合された状態で存在している。

【0235】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。

【0236】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

本明細書中において「一般名」で特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。

【0237】

（1） アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬、例えば、

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

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホスーエチル、アジンホスーメチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスーメチル、クマホス、シアノホス、ジメトニーSーメチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファムフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、Oー（メトキシアミノチオホスホリル）サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトニーメチル、パラチオン、パラチオンーメチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホスーメチル、プロフェノホス、プロペタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン；

（2） GABA制御塩化物チャンネル拮抗薬、例えば、

シクロジェン有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル；

（3） ナトリウムチャンネルモジュレーター／電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、

ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、dーシーストランスアレスリン、dートランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン sーシクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ

10

20

30

40

50

ーシフルトリン、シハロトリン、ラムダーシハロトリン、ガンマーシハロトリン、シペルメトリン、アルファーシペルメトリン、ベーターシペルメトリン、シーターシペルメトリン、ゼーターシペルメトリン、シフェノトリン〔(1R)ートランス異性体〕、デルタメトリン、エムペントリン〔(E Z)ー(1R)異性体〕、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウーフルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、ペルメトリン、フェノトリン〔(1R)ートランス異性体〕、プラレトリン、ピレトリン類(除虫菊(pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン〔(1R)異性体〕、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、

10

DDT；又は、メトキシクロル；

(4) ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)作動薬、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、スルホキサフロル；

(5) ニコチン作動性アセチルコリン受容体(nAChR)のアロステリック活性化薬、例えば、

スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド；

20

(6) 塩化物チャンネル活性化薬、例えば、アベルメクチン系／ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン；

(7) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレレン、キノプレレン、及び、メトプレレン；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン；

(8) 作用機序が知られていないか又は特定されていない活性成分、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフリル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石；

30

(9) 選択的摂食阻害薬、例えば、ピメトロジン；又は、フロニカミド；

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロビダジン；又は、エトキサゾール；

(11) 昆虫腸管膜の微生物ディスラプター、例えば、バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス(*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・スファエリクス(*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ(*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ(*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス(*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、及び、BT植物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34／35Ab1；

40

(12) 酸化的リン酸化阻害薬、ATPディスラプター、例えば、ジアフェンチウロン；又は、有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ；又は、プロパルギット；又は、テトラジホン；

50

(13) Hプロトン勾配を遮断する酸化のリン酸化デカップラー、例えば、クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルアミド；

(14) ニコチン作動性アセチルコリン受容体拮抗薬、例えば、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップーナトリウム；

(15) キチン生合成阻害薬（タイプ0）、例えば、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、及び、トリフルムロン；

(16) キチン生合成阻害薬（タイプ1）、例えば、ブプロフェジン；

10

(17) 脱皮阻害薬（特に、双翅目（即ち、双翅類）に関する）、例えば、シロマジン；

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド；

(19) オクトパミン作動性作動薬、例えば、アミトラズ；

(20) 複合体 I I I 電子伝達阻害薬、例えば、ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム；

20

(21) 複合体 I 電子伝達阻害薬、例えば、MET I 殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、ロテノン（Derris）；

(22) 電位制御ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン；

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、及び、スピロテトラマト；

(24) 複合体 I V 電子伝達阻害薬、例えば、

ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、リン化亜鉛；又は、シアン化物；

30

(25) 複合体 I I 電子伝達阻害薬、例えば、シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン；

(28) リアノジン受容体エフェクター、例えば、

ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、及び、フルベンジアミド；

さらなる活性成分、例えば、アフィドピロベン、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石（cryolite）、ジコホル、ジフロビダジン、フルエンスルホン、フロメトキン、フルフェネリム、フルフェノキシストロビン、フルフィプロール、フルオピラム、フルピラジフロン、フフェノジド（fufenozide）、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、メベルフルトリン、パイコングディング（paichongding）、ピフルブミド、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン、テトラメチルフルトリン、及び、ヨードメタン；並びに、さらに、バシルス・フィルムス（Bacillus firmus）に基づく調製物（I-1582, BioNeem, Votivo）、及び、さらに、以下の化合物：3-プロモ-N-〔2-プロモ-4-クロロ-6-〔（1-シクロプロピルエチル）カルバモイル〕フェニル〕-1-（3-クロロピリジン-2-イル）-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド（WO2005/077934から既知）、及び、1-〔2-フルオロ-4-メチル-5-〔（2, 2, 2-トリフルオロエチル）スルフ

40

50

ィニル] フェニル} - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール -
 5 - アミン (WO 2 0 0 6 / 0 4 3 6 3 5 から既知)、{ 1' - [(2 E) - 3 - (4 -
 クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - フルオロスピロ [インドール - 3
 , 4' - ピペリジン] - 1 (2 H) - イル} (2 - クロロピリジン - 4 - イル) メタノン
 (WO 2 0 0 3 / 1 0 6 4 5 7 から既知)、2 - クロロ - N - [2 - {1 - [(2 E) -
 3 - (4 - クロロフェニル) プロパ - 2 - エン - 1 - イル] ピペリジン - 4 - イル} - 4
 - (トリフルオロメチル) フェニル] イソニコチンアミド (WO 2 0 0 6 / 0 0 3 4 9 4
 から既知)、3 - (2, 5 - ジメチルフェニル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1,
 8 - ジアザスピロ [4. 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン (WO 2 0 0 9 / 0 4 9 8 5 1 から
 既知)、3 - (2, 5 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 2 - オキソ - 1, 8 - ジ
 アザスピロ [4. 5] デカ - 3 - エン - 4 - イル - エチルカルボネート (WO 2 0 0 9 /
 0 4 9 8 5 1 から既知)、4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3, 5 - ジ
 メチルピペリジン - 1 - イル) - 5 - フルオロピリミジン (WO 2 0 0 4 / 0 9 9 1 6 0
 から既知)、4 - (ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 6 - (3 - クロロフェニル) ピ
 リミジン (WO 2 0 0 3 / 0 7 6 4 1 5 から既知)、PF 1 3 6 4 (C A S - R e g . N
 o . 1 2 0 4 7 7 6 - 6 0 - 2)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (ト
 リフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチ
 ル - N - {2 - オキソ - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオロエチル) アミノ] エチル} ベ
 ンズアミド (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、4 - {5 - [3 - クロロ - 5 - (ト
 リフルオロメチル) フェニル] - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1
 , 2 - オキサゾール - 3 - イル} - N - {2 - オキソ - 2 - [(2, 2, 2 - トリフルオ
 ロエチル) アミノ] エチル} - 1 - ナフタミド (WO 2 0 0 9 / 0 0 2 8 0 9 から既知)
 、2 - [2 - ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾ
 ール - 5 - イル] カルボニル} アミノ) - 5 - クロロ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メ
 チルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、2 - [2 -
 ({ [3 - プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イ
 ル] カルボニル} アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジ
 ンカルボン酸メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、2 - [2 - ({ [3 - プ
 ロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボ
 ニル} アミノ) - 5 - シアノ - 3 - メチルベンゾイル] - 2 - メチルヒドラジンカルボン酸
 メチル (WO 2 0 0 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、2 - [3, 5 - ジプロモ - 2 - ({ [3 -
 プロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カ
 ルボニル} アミノ) ベンゾイル] - 2 - エチルヒドラジンカルボン酸メチル (WO 2 0 0
 5 / 0 8 5 2 1 6 から既知)、1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - N - [4 - シア
 ノ - 2 - メチル - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 3 - { [5 - (トリフルオ
 ロメチル) - 2 H - テトラゾール - 2 - イル] メチル} - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキ
 サミド (WO 2 0 1 0 / 0 6 9 5 0 2 から既知)、N - [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4
 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - プロモ - 1 -
 (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (CN 1 0
 2 0 5 7 9 2 5 から既知)、3 - クロロ - N - (2 - シアノプロパン - 2 - イル) - N -
 [4 - (1, 1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘプタフルオロプロパン - 2 - イル) - 2 - メチ
 ルフェニル] フタルアミド (WO 2 0 1 2 / 0 3 4 4 7 2 から既知)、8 - クロロ - N -
 [(2 - クロロ - 5 - メトキシフェニル) スルホニル] - 6 - (トリフルオロメチル) イ
 ミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミド (WO 2 0 1 0 / 1 2 9 5 0 0 から
 既知)、4 - [5 - (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4,
 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチ
 エタン - 3 - イル) ベンズアミド (WO 2 0 0 9 / 0 8 0 2 5 0 から既知)、4 - [5 -
 (3, 5 - ジクロロフェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1,
 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - (1 - オキシドチエタン - 3 - イル)
 ベンズアミド (WO 2 0 1 2 / 0 2 9 6 7 2 から既知)、1 - [(2 - クロロ - 1, 3 -

10

20

30

40

50

チアゾール-5-イル)メチル]-4-オキソ-3-フェニル-4H-ピリド [1, 2-a] ピリミジン-1-イウム-2-オレート (WO 2009/099929 から既知)、
 1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-4-オキソ-3-フェニル-4H-
 ピリド [1, 2-a] ピリミジン-1-イウム-2-オレート (WO 2009/099929 から既知)、(5S, 8R)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-
 9-ニトロ-2, 3, 5, 6, 7, 8-ヘキサヒドロ-1H-5, 8-エポキシイミダゾ
 [1, 2-a] アゼピン (WO 2010/069266 から既知)、(2E)-1-[(6-
 クロロピリジン-3-イル)メチル]-N'-ニトロ-2-ペンチリデンヒドラジン
 カルボキシイミドアミド (WO 2010/060231 から既知)、4-(3-{2, 6-
 ジクロロ-4-[(3, 3-ジクロロプロパー-2-エン-1-イル)オキシ]フェノキ
 シ}プロポキシ)-2-メトキシ-6-(トリフルオロメチル)ピリミジン (CN 101
 337940 から既知)、N-[2-(tert-ブチルカルバモイル)-4-クロロ-
 6-メチルフェニル]-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-3-(フルオロメトキ
 シ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド (WO 2008/134969 から既知)

。

【0238】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そし
 て、例えば、「Pesticide Manual」に記載されているか、又は、インタ
 ーネット上に記載されている（例えば、「http://www.alanwood.net/pesticides」）。

【0239】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1. 1) アルジモルフ、(1.
 2) アザコナゾール、(1. 3) ビテルタノール、(1. 4) ブロムコナゾール、(1.
 5) シプロコナゾール、(1. 6) ジクロブトラゾール、(1. 7) ジフェノコナゾール
 、(1. 8) ジニコナゾール、(1. 9) ジニコナゾール-M、(1. 10) ドデモルフ
 、(1. 11) 酢酸ドデモルフ、(1. 12) エポキシコナゾール、(1. 13) エタコ
 ナゾール、(1. 14) フェナリモール、(1. 15) フェンブコナゾール、(1. 16
) フェンヘキサミド、(1. 17) フェンプロピジン、(1. 18) フェンプロピモルフ
 、(1. 19) フルキンコナゾール、(1. 20) フルルプリミドール、(1. 21) フ
 ルシラゾール、(1. 22) フルトリアホル、(1. 23) フルコナゾール、(1. 2
 4) フルコナゾール-シス、(1. 25) ヘキサコナゾール、(1. 26) イマザリル、
 (1. 27) 硫酸イマザリル、(1. 28) イミベンコナゾール、(1. 29) イブコナ
 ザール、(1. 30) メトコナゾール、(1. 31) ミクロブタニル、(1. 32) ナフ
 チフィン、(1. 33) ヌアリモール、(1. 34) オキシポコナゾール、(1. 35)
 パクロブトラゾール、(1. 36) ペフラゾエート、(1. 37) ペンコナゾール、(1
 . 38) ピペラリン、(1. 39) プロクロラズ、(1. 40) プロピコナゾール、(1
 . 41) プロチオコナゾール、(1. 42) ピリブチカルブ、(1. 43) ピリフェノッ
 クス、(1. 44) キンコナゾール、(1. 45) シメコナゾール、(1. 46) スピロ
 キサミン、(1. 47) テブコナゾール、(1. 48) テルビナフィン、(1. 49) テ
 トラコナゾール、(1. 50) トリアジメホン、(1. 51) トリアジメノール、(1.
 52) トリデモルフ、(1. 53) トリフルミゾール、(1. 54) トリホリン、(1.
 55) トリチコナゾール、(1. 56) ウニコナゾール、(1. 57) ウニコナゾール-
 P、(1. 58) ビニコナゾール、(1. 59) ボリコナゾール、(1. 60) 1-(4
 -クロロフェニル)-2-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)シクロヘプタ
 ノール、(1. 61) 1-(2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1
 -イル)-1H-イミダゾール-5-カルボン酸メチル、(1. 62) N'-{5-(ジ
 フルオロメチル)-2-メチル-4-[3-(トリメチルシリル)プロポキシ]フェニル
 }-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(1. 63) N-エチル-N-メチル
 -N'-{2-メチル-5-(トリフルオロメチル)-4-[3-(トリメチルシリル)

10

20

30

40

50

プロポキシ] フェニル} イミドホルムアミド、及び、(1. 64) O- [1- (4-メトキシフェノキシ) -3, 3-ジメチルブタン-2-イル] 1H-イミダゾール-1-カルボチオエート、(1. 65) ピリソキサゾール；

(2) 呼吸阻害薬(呼吸鎖阻害薬)、例えば、(2. 1) ビキサフェン、(2. 2) ボスカリド、(2. 3) カルボキシシン、(2. 4) ジフルメトリム、(2. 5) フェンフラム、(2. 6) フルオピラム、(2. 7) フルトラニル、(2. 8) フルクキサピロキサド、(2. 9) フラメトピル、(2. 10) フルメシクロックス、(2. 11) イソピラザム(シン-エピマー性ラセミ化合物(1RS, 4SR, 9RS)とアンチ-エピマー性ラセミ化合物(1RS, 4SR, 9SR)の混合物)、(2. 12) イソピラザム(アンチ-エピマー性ラセミ化合物)、(2. 13) イソピラザム(アンチ-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9S)、(2. 14) イソピラザム(アンチ-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9R)、(2. 15) イソピラザム(シン-エピマー性ラセミ化合物 1RS, 4SR, 9RS)、(2. 16) イソピラザム(シン-エピマー性エナンチオマー 1R, 4S, 9R)、(2. 17) イソピラザム(シン-エピマー性エナンチオマー 1S, 4R, 9S)、(2. 18) メプロニル、(2. 19) オキシカルボキシシン、(2. 20) ペンフルフェン、(2. 21) ペンチオピラド、(2. 22) セダキサシン、(2. 23) チフルザミド、(2. 24) 1-メチル-N- [2- (1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル] -3- (トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 25) 3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-N- [2- (1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ) フェニル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 26) 3- (ジフルオロメチル) -N- [4-フルオロ-2- (1, 1, 2, 3, 3, 3-ヘキサフルオロプロポキシ) フェニル] -1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 27) N- [1- (2, 4-ジクロロフェニル) -1-メトキシプロパン-2-イル] -3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 28) 5, 8-ジフルオロ-N- [2- (2-フルオロ-4- { [4- (トリフルオロメチル) ピリジン-2-イル] オキシ} フェニル) エチル] キナゾリン-4-アミン、(2. 29) ベンゾビンジフルピル、(2. 30) N- [(1S, 4R) -9- (ジクロロメチレン) -1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタレン-5-イル] -3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、及び、(2. 31) N- [(1R, 4S) -9- (ジクロロメチレン) -1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノナフタレン-5-イル] -3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 32) 3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-N- (1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 33) 1, 3, 5-トリメチル-N- (1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 34) 1-メチル-3- (トリフルオロメチル) -N- (1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル) -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 35) 1-メチル-3- (トリフルオロメチル) -N- [(3R) -1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 36) 1-メチル-3- (トリフルオロメチル) -N- [(3S) -1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 37) 3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-N- [(3S) -1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 38) 3- (ジフルオロメチル) -1-メチル-N- [(3R) -1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 39) 1, 3, 5-トリメチル-N- [(3R) -1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル] -1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2. 40) 1, 3, 5-トリメチル-N- [(3S) -1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1

10

20

30

40

50

H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.41)ベノ
 ダニル、(2.42)2-クロロ-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-
 1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキサミド、(2.43)イソフェタミ
 ド；

(3) 呼吸鎖の複合体 I I I に対して作用する呼吸阻害薬(呼吸鎖阻害薬)、例えば
 、(3.1)アメトクトラジン、(3.2)アミスルブロム、(3.3)アゾキシストロ
 ビン、(3.4)シアゾファミド、(3.5)クメトキシストロビン(coumetho
 xystrobin)、(3.6)クモキシストロビン、(3.5)ジモキシストロビン
 、(3.8)ネンストロブリン、(3.9)ファミキサドン、(3.10)フェンアミド
 ン、(3.11)フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)、(10
 3.12)フルオキサストロビン、(3.13)クレソキシム-メチル、(3.14)メ
 トミノストロビン、(3.15)オリサストロビン、(3.16)ピコキシストロビン、
 (3.17)ピラクロストロビン、(3.18)ピラメトストロビン、(3.19)ピラ
 オキシストロビン、(3.20)ピリベンカルブ、(3.21)トリクロピリカルブ、(3.
 22)トリフロキシストロビン、(3.23)(2E)-2-(2-{[6-(3-
 クロロ-2-メチルフェノキシ)-5-フルオロピリミジン-4-イル]オキシ}フェニ
 ル)-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3.24)(2E)-2-
 (メトキシイミノ)-N-メチル-2-(2-{[(1E)-1-[3-(トリフル
 オロメチル)フェニル]エチリデン}アミノ]オキシ}メチル)フェニル)エタンアミド
 、(3.25)(2E)-2-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-{2-[(E)-
 20 {1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ}イミノ]メチル}フェニル
 }エタンアミド、(3.26)(2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-{[(E)-1-フルオロ-2-フェニルエテニル]オキシ}フェニル)エチリデン]アミノ
 }オキシ}メチル}フェニル}-2-(メトキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3.
 27)(2E)-2-{2-[(2E,3E)-4-(2,6-ジクロロフェ
 ニル)ブタ-3-エン-2-イリデン]アミノ}オキシ}メチル}フェニル}-2-(メ
 トキシイミノ)-N-メチルエタンアミド、(3.28)2-クロロ-N-(1,1,3-
 ートリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ピリジン-3-カルボキ
 サミド、(3.29)5-メトキシ-2-メチル-4-(2-{[(1E)-1-[3-
 30 (トリフルオロメチル)フェニル]エチルデン}アミノ]オキシ}メチル}フェニル
)-2,4-ジヒドロ-3H-1,2,4-トリアゾール-3-オン、(3.30)(2
 E)-2-{2-[(シクロプロピル[(4-メトキシフェニル)イミノ]メチル}ス
 ルファニル)メチル}フェニル}-3-メトキシプロパー-2-エン酸メチル、(3.31
)N-(3-エチル-3,5,5-トリメチルシクロヘキシル)-3-(ホルミルアミノ
)-2-ヒドロキシベンズアミド、(3.32)2-{2-[(2,5-ジメチルフェノ
 キシ)メチル}フェニル}-2-メトキシ-N-メチルアセトアミド；

(4) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、(4.1)ベノミル、(4.2)カ
 ルベンダジム、(4.3)クロルフェナゾール、(4.4)ジエトフェンカルブ、(4.
 5)エタボキサム、(4.6)フルオピコリド、(4.7)フベリダゾール、(4.8)
 ベンシクロン、(4.9)チアベンダゾール、(4.10)チオファネート-メチル、(40
 4.11)チオファネート、(4.12)ゾキサミド、(4.13)5-クロロ-7-(
 4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)[1,
 2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、及び、(4.14)3-クロロ-5-(
 6-クロロピリジン-3-イル)-6-メチル-4-(2,4,6-トリフルオロフェニ
 ル)ピリダジン；

(5) 多部位に活性を示す化合物、例えば、(5.1)ボルドー液、(5.2)カプ
 タホール、(5.3)キャプタン、(5.4)クロロタロニル、(5.5)銅剤(例えば
 、水酸化銅)、(5.6)ナフテン酸銅、(5.7)酸化銅、(5.8)塩基性塩化銅、
 (5.9)硫酸銅、(5.10)ジクロフルアニド、(5.11)ジチアノン、(5.1
 2)ドジン、(5.13)ドジン遊離塩基、(5.14)ファーバム、(5.15)フル
 50

オロホルペット、(5. 16) ホルペット、(5. 17) グアザチン、(5. 18) 酢酸
グアザチン、(5. 19) イミノクタジン、(5. 20) イミノクタジンアルベシル酸塩
、(5. 21) イミノクタジン三酢酸塩、(5. 22) マンカップパー、(5. 23) マン
ゼブ、(5. 24) マンネブ、(5. 25) メチラム、(5. 26) メチラム亜鉛 (z i
n c m e t i r a m)、(5. 27) オキシシン銅 (c o p p e r - o x i n e)、(5
. 28) プロパミジン (p r o p a m i d i n e)、(5. 29) プロピネブ、(5. 3
0) 硫黄及び硫黄剤 (例えば、多硫化カルシウム)、(5. 31) チウラム、(5. 32
) トリルフルアニド、(5. 33) ジネブ、(5. 34) ジラム、及び、(5. 35) ア
ニラジン；

(6) 抵抗性誘導物質、例えば、(6. 1) アシベンゾラルーSーメチル、(6. 2
) イソチアニル、(6. 3) プロベナゾール、(6. 4) チアジニル、及び、(6. 5)
ラミナリン (l a m i n a r i n)；

(7) アミノ酸及びタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、(7. 1) アンドプリム
(a n d o p r i m)、(7. 2) プラストサイジンーS、(7. 3) シプロジニル、(7.
4) カスガマイシン、(7. 5) カスガマイシン塩酸塩水和物、(7. 6) メパニピ
リム、(7. 7) ピリメタニル、(7. 8) 3ー(5ーフルオロー3, 3, 4, 4ーテト
ラメチルー3, 4ージヒドロイソキノリンー1ーイル) キノリン、及び、(7. 9) オキ
シテトラサイクリン、及び、(7. 10) ストレプトマイシン；

(8) ATP産生阻害薬、例えば、(8. 1) 酢酸トリフェニルスズ、(8. 2) 塩
化トリフェニルスズ、(8. 3) 水酸化トリフェニルスズ、及び、(8. 4) シルチオフ
ァム；

(9) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、(9. 1) ベンチアバリカルブ、(9. 2) ジ
メトモルフ、(9. 3) フルモルフ、(9. 4) イプロバリカルブ、(9. 5) マンジブ
ロパミド、(9. 6) ポリオキシシン、(9. 7) ポリオキシリム、(9. 8) バリダマイ
シン、(9. 9) バリフェナレート、及び、(9. 10) ポリオキシシンB；

(10) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、(10. 1) ビフェニル、(10. 2
) クロロネブ (c h l o r n e b)、(10. 3) ジクロラン、(10. 4) エジフェン
ホス、(10. 5) エトリジアゾール、(10. 6) ヨードカルブ (i o d o c a r b)
、(10. 7) イプロベンホス、(10. 8) イソプロチオラン、(10. 9) プロパモ
カルブ、(10. 10) プロパモカルブ塩酸塩、(10. 11) プロチオカルブ、(10
. 12) ピラゾホス、(10. 13) キントゼン、(10. 14) テクナゼン、及び、(10
. 15) トルクロホスーメチル；

(11) メラニン生合成阻害薬、例えば、(11. 1) カルプロパミド、(11. 2
) ジクロシメット、(11. 3) フェノキサニル、(11. 4) フタリド、(11. 5)
ピロキロン、(11. 6) トリシクラゾール、及び、(11. 7) {3ーメチルー1ー[
(4ーメチルベンゾイル) アミノ] ブタンー2ーイル} カルバミン酸2, 2, 2ートリフ
ルオロエチル；

(12) 核酸合成の阻害薬、例えば、(12. 1) ベナラキシル、(12. 2) ベナ
ラキシルーM (キララキシル (k i r a l a x y l))、(12. 3) ブピリメート、(12.
4) クロジラコン、(12. 5) ジメチリモール、(12. 6) エチリモール、(12.
7) フララキシル、(12. 8) ヒメキサゾール、(12. 9) メタラキシル、(12.
10) メタラキシルーM (メフェノキサム)、(12. 11) オフラセ、(12.
12) オキサジキシル、(12. 13) オキシリン酸、及び、(12. 14) オクチリノ
ン；

(13) シグナル伝達阻害薬、例えば、(13. 1) クロゾリネート、(13. 2)
フェンピクロニル、(13. 3) フルジオキシソニル、(13. 4) イプロジオン、(13
. 5) プロシミドン、(13. 6) キノキシフェン、(13. 7) ピンクロゾリン、及び
、(13. 8) プロキナジド；

(14) デカップラー、例えば、(14. 1) ビナパクリル、(14. 2) ジノカッ
プ、(14. 3) フェリムゾン、(14. 4) フルアジナム、及び、(14. 5) メブチ

10

20

30

40

50

ルジノカップ；

(15) さらなる化合物、例えば、(15. 1) ペンチアゾール、(15. 2) ベトキサジン、(15. 3) カプシマイシン (capsimycin)、(15. 4) カルボン、(15. 5) キノメチオネート、(15. 6) ピリオフェノン (クラザフェノン (chlazafenone))、(15. 7) クフラネブ、(15. 8) シフルフェナミド、(15. 9) シモキサニル、(15. 10) シプロスルファミド、(15. 11) ダゾメット、(15. 12) デバカルブ、(15. 13) ジクロロフェン、(15. 14) ジクロメジン、(15. 15) ジフェンゾコート、(15. 16) ジフェンゾコートメチル硫酸塩、(15. 17) ジフェニルアミン、(15. 18) エコメイト、(15. 19) フェンピラザミン、(15. 20) フルメトベル、(15. 21) フルオルイミド、(15. 22) フルスルファミド、(15. 23) フルチアニル、(15. 24) ホセチルーアルミニウム、(15. 25) ホセチルーカルシウム、(15. 26) ホセチルーナトリウム、(15. 27) ヘキサクロロベンゼン、(15. 28) イルマイシン、(15. 29) メタスルホカルブ、(15. 30) イソチオシアン酸メチル、(15. 31) メトラフェノン、(15. 32) ミルディオマイシン、(15. 33) ナタマイシン、(15. 34) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15. 35) ニトロタルーイソプロピル、(15. 36) オクチリノン、(15. 37) オキサモカルブ (oxamocarb)、(15. 38) オキシフェンチン (oxyfenthin)、(15. 39) ペンタクロロフェノール及びその塩、(15. 40) フェノトリン、(15. 41) リン酸及びその塩、(15. 42) プロパモカルブーホセチレート (propamocarb-fosetyl ate)、(15. 43) プロパノシンーナトリウム (propanosine-sodium)、(15. 44) ピリモルフ、(15. 45) (2E)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル) プロパー-2-エン-1-オン、(15. 46) (2Z)-3-(4-tert-ブチルフェニル)-3-(2-クロロピリジン-4-イル)-1-(モルホリン-4-イル) プロパー-2-エン-1-オン、(15. 47) ピロールニトリン、(15. 48) テブフロキン、(15. 49) テクロフタラム、(15. 50) トルニファニド、(15. 51) トリアゾキシド、(15. 52) トリクラミド、(15. 53) ザリラミド、(15. 54) (3S, 6S, 7R, 8R)-8-ベンジル-3-[(3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピリジン-2-イル}カルボニル)アミノ]-6-メチル-4, 9-ジオキソ-1, 5-ジオキソナン-7-イル 2-メチルプロパノエート、(15. 55) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15. 56) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15. 57) 1-(4-{4-[(5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、(15. 58) 1-(4-メトキシフェノキシ)-3, 3-ジメチルブタン-2-イル 1H-イミダゾール-1-カルボキシレート、(15. 59) 2, 3, 5, 6-テトラクロロ-4-(メチルスルホニル)ピリジン、(15. 60) 2, 3-ジブチル-6-クロロチエノ[2, 3-d]ピリミジン-4(3H)-オン、(15. 61) 2, 6-ジメチル-1H, 5H-[1, 4]ジチイノ[2, 3-c: 5, 6-c']ジピロール-1, 3, 5, 7(2H, 6H)-テトロネ、(15. 62) 2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5R)-5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-チアゾール-2-イル}ピペリジン-1-イル)エタノン、(15. 63) 2-[5-メチル-

10

20

30

40

50

3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-(4-{4-[(5
 S)-5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル]-1, 3-
 チアゾール-2-イル} ピペリジン-1-イル) エタノン、(15. 64) 2-[5-メ
 チル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-{4-[4-
 (5-フェニル-4, 5-ジヒドロ-1, 2-オキサゾール-3-イル)-1, 3-チア
 ザール-2-イル] ピペリジン-1-イル} エタノン、(15. 65) 2-ブトキシ-6
 -ヨード-3-プロピル-4H-クロメン-4-オン、(15. 66) 2-クロロ-5-
 [2-クロロ-1-(2, 6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-4-メチル-1H
 -イミダゾール-5-イル] ピリジン、(15. 67) 2-フェニルフェノール及び塩、
 (15. 68) 3-(4, 4, 5-トリフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロ
 イソキノリン-1-イル) キノリン、(15. 69) 3, 4, 5-トリクロロピリジン-
 2, 6-ジカルボニトリル、(15. 70) 3-クロロ-5-(4-クロロフェニル)-
 4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-6-メチルピリダジン、(15. 71) 4-(4-
 クロロフェニル)-5-(2, 6-ジフルオロフェニル)-3, 6-ジメチルピリダジ
 ン、(15. 72) 5-アミノ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-チオール、(15.
 73) 5-クロロ-N'-フェニル-N'- (プロパー-2-イン-1-イル) チオフェン
 -2-スルホノヒドラジド、(15. 74) 5-フルオロ-2-[(4-フルオロベンジ
 ル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15. 75) 5-フルオロ-2-[(4-メチ
 ルベンジル) オキシ] ピリミジン-4-アミン、(15. 76) 5-メチル-6-オクチ
 ル[1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5-a] ピリミジン-7-アミン、(15. 77) (20
 2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチル、(15. 78) N'-
 -(4-{ [3-(4-クロロベンジル)-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル] オ
 キシ}-2, 5-ジメチルフェニル)-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15.
 79) N-(4-クロロベンジル)-3-[3-メトキシ-4-(プロパー-2-イン-1-イル
 オキシ) フェニル] プロパンアミド、(15. 80) N-[(4-クロロフェ
 ニル) (シアノ) メチル]-3-[3-メトキシ-4-(プロパー-2-イン-1-イル
 オキシ) フェニル] プロパンアミド、(15. 81) N-[(5-プロモ-3-クロロピ
 リジン-2-イル) メチル]-2, 4-ジクロロニコチンアミド、(15. 82) N-[
 1-(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル) エチル]-2, 4-ジクロロニコチ
 ンアミド、(15. 83) N-[1-(5-プロモ-3-クロロピリジン-2-イル) エ
 チル]-2-フルオロ-4-ヨードニコチンアミド、(15. 84) N-{ (E)-[(シ
 クロプロピルメトキシ) イミノ] [6-(ジフルオロメトキシ)-2, 3-ジフルオロ
 フェニル] メチル}-2-フェニルアセトアミド、(15. 85) N-{ (Z)-[(シ
 クロプロピルメトキシ) イミノ] [6-(ジフルオロメトキシ)-2, 3-ジフルオロ
 フェニル] メチル}-2-フェニルアセトアミド、(15. 86) N'-{4-[(3-t
 e r t-ブチル-4-シアノ-1, 2-チアゾール-5-イル) オキシ]-2-クロロ-
 5-メチルフェニル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 87) N
 -メチル-2-(1-{ [5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール
 -1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル)-N-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ
 ナフタレン-1-イル)-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15. 88) N
 -メチル-2-(1-{ [5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール
 -1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル)-N-[(1R)-1, 2, 3, 4-テ
 トラヒドロナフタレン-1-イル]-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミド、(15
 . 89) N-メチル-2-(1-{ [5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-
 ピラゾール-1-イル] アセチル} ピペリジン-4-イル)-N-[(1S)-1, 2,
 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]-1, 3-チアゾール-4-カルボキサミ
 ド、(15. 90) {6-[({ [(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル) (フェ
 ニル) メチレン] アミノ} オキシ) メチル] ピリジン-2-イル} カルバミン酸ペンチ
 ル、(15. 91) フェナジン-1-カルボン酸、(15. 92) キノリン-8-オール
 、(15. 93) キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、(15. 94) {6-

10

20

30

40

50

[({ [(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバミン酸 t e r t - ブチル、 (1 5 . 9 5) 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - N - [2 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 6) N - (4 ' - クロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 7) N - (2 ' , 4 ' - ジクロロビフェニル - 2 - イル) - 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 8) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 9 9) N - (2 ' , 5 ' - ジフルオロビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 0) 3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - [4 ' - (プロパー - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 1) 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - N - [4 ' - (プロパー - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 2) 2 - クロロ - N - [4 ' - (プロパー - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、 (1 5 . 1 0 3) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 4) N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 5) 3 - (ジフルオロメチル) - N - (4 ' - エチニルビフェニル - 2 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 6) N - (4 ' - エチニルビフェニル - 2 - イル) - 5 - フルオロ - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 0 7) 2 - クロロ - N - (4 ' - エチニルビフェニル - 2 - イル) ニコチンアミド、 (1 5 . 1 0 8) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 , 3 - ジメチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、 (1 5 . 1 0 9) 4 - (ジフルオロメチル) - 2 - メチル - N - [4 ' - (トリフルオロメチル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 5 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 1 0) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 1 1) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 - ヒドロキシ - 3 - メチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、 (1 5 . 1 1 2) 3 - (ジフルオロメチル) - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 1 3) 5 - フルオロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 (1 5 . 1 1 4) 2 - クロロ - N - [4 ' - (3 - メトキシ - 3 - メチルブター - 1 - イン - 1 - イル) ビフェニル - 2 - イル] ニコチンアミド、 (1 5 . 1 1 5) (5 - ブロモ - 2 - メトキシ - 4 - メチルピリジン - 3 - イル) (2 , 3 , 4 - トリメトキシ - 6 - メチルフェニル) メタノン、 (1 5 . 1 1 6) N - [2 - (4 - { [3 - (4 - クロロフェニル) プロパー - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } - 3 - メトキシフェニル) エチル] - N 2 - (メチルスルホニル) バリンアミド、 (1 5 . 1 1 7) 4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル) アミノ] ブタン酸、 (1 5 . 1 1 8) ブター - 3 - イン - 1 - イル { 6 - [({ [(Z) - (1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オキシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、 (1 5 . 1 1 9) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール (互変異性体形態 : 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 (1 H) - オン)、 (1 5 . 1 2 0) 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ安息香酸プロピル、 (1 5 . 1 2 1) 1 , 3 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル) - 1 H - ピラゾール

10

20

30

40

50

ルー 4-カルボキサミド、(15. 122) 1, 3-ジメチル-N-[(3R)-1, 1,
 , 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール
 -4-カルボキサミド、(15. 123) 1, 3-ジメチル-N-[(3S)-1, 1,
 , 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-
 4-カルボキサミド、(15. 124) [3-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-
 5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピリジン-
 3-イル) メタノール、(15. 125) (S)-[3-(4-クロロ-2-フルオロフ
 ェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4-イル] (ピ
 リジン-3-イル) メタノール、(15. 126) (R)-[3-(4-クロロ-2-
 フルオロフェニル)-5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-1, 2-オキサゾール-4
 -イル] (ピリジン-3-イル) メタノール、(15. 127) 2-{[3-(2-クロ
 ロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-
 2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 128) 1
 -{[3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-
 2-イル] メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(1
 5. 129) 5-(アリルスルファニル)-1-{[3-(2-クロロフェニル)-2-
 (2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-1H-1, 2, 4-
 トリアゾール、(15. 130) 2-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロ
 キシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2
 , 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 131) 2-{[rel (2R, 3S)-3
 -(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル
] メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15
 . 132) 2-{[rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-
 ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-2, 4-ジヒドロ-3H-1
 , 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 133) 1-{[rel (2R, 3S)
 -3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-
 イル] メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イルチオシアネート、(15.
 134) 1-{[rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-
 ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾ
 ール-5-イルチオシアネート、(15. 135) 5-(アリルスルファニル)-1-{[
 rel (2R, 3S)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニ
 ル) オキシラン-2-イル] メチル}-1H-1, 2, 4-トリアゾール、(15. 13
 6) 5-(アリルスルファニル)-1-{[rel (2R, 3R)-3-(2-クロロフ
 ェニル)-2-(2, 4-ジフルオロフェニル) オキシラン-2-イル] メチル}-1H
 -1, 2, 4-トリアゾール、(15. 137) 2-[(2S, 4S, 5S)-1-(2
 , 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イ
 ル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 13
 8) 2-[(2R, 4S, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 -2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4
 -トリアゾール-3-チオン、(15. 139) 2-[(2R, 4R, 5R)-1-(2
 , 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イ
 ル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 14
 0) 2-[(2S, 4R, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 -2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4
 -トリアゾール-3-チオン、(15. 141) 2-[(2S, 4S, 5R)-1-(2
 , 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イ
 ル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 14
 2) 2-[(2R, 4S, 5R)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ
 -2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4
 -トリアゾール-3-チオン、(15. 143) 2-[(2R, 4R, 5S)-1-(2

10

20

30

40

50

, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 144) 2-[(2S, 4R, 5S)-1-(2, 4-ジクロロフェニル)-5-ヒドロキシ-2, 6, 6-トリメチルヘプタン-4-イル]-2, 4-ジヒドロ-3H-1, 2, 4-トリアゾール-3-チオン、(15. 145) 2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1, 1, 3-トリメチル-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(15. 146) 2-(6-ベンジルピリジン-2-イル)キナゾリン、(15. 147) 2-[6-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-メチルピリジン-2-イル]キナゾリン、(15. 148) 3-(4, 4-ジフルオロ-3, 3-ジメチル-3, 4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン、(15. 149) アブシジン酸、(15. 150) 3-(ジフルオロメチル)-N-メトキシ-1-メチル-N-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)プロパン-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 151) N'-[5-プロモ-6-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ)-2-メチルピリジン-3-イル]-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 152) N'-{5-プロモ-6-[1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 153) N'-{5-プロモ-6-[(1R)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 154) N'-{5-プロモ-6-[(1S)-1-(3, 5-ジフルオロフェニル)エトキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 155) N'-{5-プロモ-6-[(シス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 156) N'-{5-プロモ-6-[(トランス-4-イソプロピルシクロヘキシル)オキシ]-2-メチルピリジン-3-イル}-N-エチル-N-メチルイミドホルムアミド、(15. 157) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 158) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 159) N-(2-tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 160) N-(5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 161) N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 162) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-フルオロベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 163) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(5-フルオロ-2-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 164) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-フルオロベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 165) N-(2-シクロペンチル-5-フルオロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 166) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-フルオロ-6-イソプロピルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 167) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-N-(2-エチル-5-メチルベンジル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 168) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1-メチル-1H-ピラゾール-

10

20

30

40

50

4-カルボキサミド、(15. 169) N-シクロプロピル-N-(2-シクロプロピル-5-メチルベンジル)-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 170) N-(2-tert-ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 171) N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(15. 172) N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-N

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

【0240】

クラス(1)～(15)に記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成し得る。

【0241】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

式(I)で表される化合物は、生物学的殺有害生物剤と組み合わせることができる。

【0242】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質又は二次代謝産物)などがある。

【0243】

生物学的殺有害生物剤としては、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【0244】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである：

バシルス・アミロリクエファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)株FZB42(DSM 231179)、又は、バシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス(*B. cereus*)株CN

10

20

30

40

50

CM I-1562、又は、バシルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) 株 I-1582 (受託番号 CNCM I-1582)、又は、バシルス・プミルス (*Bacillus pumilus*)、特に、株 GB34 (受託番号 ATCC 700814) 及び株 QST2808 (受託番号 NRRL B-30087)、又は、バシルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に、株 GB03 (受託番号 ATCC SD-1397)、又は、バシルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*) 株 QST713 (受託番号 NRRL B-21661)、又は、バシルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*) 株 OST 30002 (受託番号 NRRL B-50421)、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス (*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (抗原型 H-14) 株 AM65-52 (受託番号 ATCC 1276)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ (*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株 ABTS-1857 (SD-1372)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ (*B. thuringiensis subsp. kurstaki*) 株 HD-1、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス (*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*) 株 NB 176 (SD-5428)、パステウリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種 (*Pasteuria spp.*) (ロチレンクルス・レニホルミス (*Rotylenchulus reniformis*) 線虫) - PR3 (受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス・ミクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 AQ6121 (= QRD 31.013、NRRL B-50550)、ストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 AQ 6047 (受託番号 NRRL 30232)。

【0245】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な菌類及び酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91-8 (受託番号 DSM-9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium spp.*)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*)) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウィア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に、株 NRRL Y-30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在：イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株 IFPC 200613 又は株 A popka 97 (受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株 251 (AGAL 89/030550)、タラロミセス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に、株 V117b、トリコデルマ・アトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株 SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*T. harzianum rifai*) T39 (受託番号 CNCM I-952)。

【0246】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能なウイルス類の

例は、以下のものである：

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV)、コドリリング (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

【0247】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定に特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に含まれる。例としては、以下のものを挙げることができる：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、*パセウドモナス・セパシア* (*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラ・モノスポルム (*Gigaspora monosporum*)、グロムス属種 (*Glomus* spp.)、ラッカリア属種 (*Laccaria* spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ (*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属種 (*Paraglomus* spp.)、ピソリthus・チンクトルス (*Pisolithus tinctorius*)、*パセウドモナス*属種 (*Pseudomonas* spp.)、リゾビウム属種 (*Rhizobium* spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ (*Rhizobium trifolii*)、リゾポゴン属種 (*Rhizopogon* spp.)、スクレロデルマ属種 (*Scleroderma* spp.)、スイルス属種 (*Suillus* spp.)、ストレプトミセス (*Streptomyces* spp.)。

【0248】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物 (これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する) の例は、以下のものである：

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (*azadirachtin*)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (*Chenopodium quinoa*) サボニン抽出物)、除虫菊 (*pyrethrum/pyrethrins*)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Regalia、「RequiemTM Insecticide」、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ (*Symphytum officinale*)、ヨモギギク (*Tanacetum vulgare*)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (*Tropaeolum majus*)、セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (*Viscum album*)、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

【0249】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ペノキサコール、クロキントセト (ーメキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (ーエチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (ーエチル)、メフェンピル (ージエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2ーメトキシーNー ({ 4ー [(メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (C A S 1 2 9 5 3 1ー1 2ー0)、4ー (ジクロロアセチル)ー1ーオキサー4ーアザスピロ [4. 5] デカン (C A S 7 1 5 2 6ー0 7ー3)、2, 2, 5ートリメチルー3ー (ジクロロアセチル)ー1, 3ーオキサゾリジン (C A S 5 2 8 3 6ー3 1ー4)。

10

【0250】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の全ての部分を処理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物 (天然に発生している作物植物を包含する) のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類 (コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物 (果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実を有するもの及びブドウの木) などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、塊茎、根及び根茎などである。収穫物、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) 及び生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) 及び種子なども、植物の部分に包含される。

20

30

【0251】

式 (I) で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧 (fogging)、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 (propagation material) の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

【0252】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種により得られた植物種及び植物品種、並びに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的な方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種 (遺伝子組換え生物) 及びそれらの部分を処理する。用語「部分 (parts)」又は「植物の部分 (parts of plants)」又は「植物の部分 (plant parts)」については、既に上記で説明した。本発明に従って、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な品種又は使用されている慣習的な品種の植物を処理する。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換えDNA技術によって得られた、新しい特性 (「形質」) を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

40

50

【0253】

トランスジェニック植物、種子処理、及び、統合イベント (integration events)

特に有利で有益な特性（「形質」）を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種（遺伝子工学により得られたもの）に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、渇水又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び／又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び／又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物に対する（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する）植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリンギエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝物質〔例えば、遺伝子 *CryIA(a)*、*CryIA(b)*、*CryIA(c)*、*CryIIA*、*CryIIIA*、*CryIIIB2*、*Cry9c*、*Cry2Ab*、*Cry3Bb* 及び *CryIF* 並びにそれらの組合せ〕によって植物体内で形成された毒素による、害虫及び有害微生物に対する（例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類に対する）植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性 (*SAR*)、システミン (*systemin*)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び／又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性成分（例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート類又はホスフィノトリシン）に対する植物の向上した耐性である（例えば、「*PAT*」遺伝子）。望まれる当該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（果実のリンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウを有するもの）などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

【0254】

作物保護－処理の種類

式 (I) で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の処理は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散 (*spreading-on*)、注入、灌水（灌注 (*drenching*)）、点滴灌漑などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 (*propagation material*) の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理用の粉末として、液体種子処理用の溶液として、スラリー処理用の水溶性粉末として、被覆、1以上の被膜によるコーティングなどによっても行う。さらに、式 (I) で表される化合物を微量散布法 (*ultra-low volume method*) によって施用することも可能であり、又は、該施用形態若しくは式 (I) で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。

【0255】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用である。即ち、式 (I) で表される化合物を茎葉部に施用し、その際、処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って

適合させるべきである。

【0256】

浸透移行性活性化合物の場合、式（I）で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。従って、植物は、その植物の生息環境に対して式（I）で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注（drenching）によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させる〔即ち、植物の成育場所（例えば、土壌、又は、水耕系）に式（I）で表される化合物の液体形態を含浸させる〕ことによって、又は、土壌施用〔即ち、式（I）で表される化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の成育場所に導入する〕ことによって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式（I）で表される化合物（例えば、粒剤として）を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

10

【0257】

種子の処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。それにもかかわらず、種子の処理においては、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が生じる。かくして、植物の貯蔵中、播種後又は出芽後に殺有害生物剤を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性成分によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性成分の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の殺有害生物剤を使用して種子及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、害虫抵抗性トランスジェニック植物又は害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

20

【0258】

従って、本発明は、特に、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式（I）で表される化合物のうちの1種類で処理することによる。種子及び発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、異なった時点で処理するような方法も包含する。

30

【0259】

本発明は、さらに、種子及びその種子から生じた植物を害虫に対して保護するために種子を処理するための、式（I）で表される化合物の使用にも関する。

【0260】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、式（I）で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式（I）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（I）で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式（I）で表される化合物と混合成分が被膜の一部として又は被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

40

【0261】

本発明は、さらに、式（I）で表される化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

【0262】

式（I）で表される化合物のうちの1種類が浸透移行的に作用する場合に生じる有利な

50

点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

【0263】

別の有利な点は、式(I)で表される化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽及び出芽が増進され得るということである。

【0264】

式(I)で表される化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

【0265】

さらに、式(I)で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物と組合せて使用することが可能であり、その結果として、共生生物(例えば、根粒菌、菌根菌及び／又は内部寄生性の細菌若しくは菌類)によるコロニー形成が良好になり、及び／又は、窒素固定が最適化される。

【0266】

式(I)で表される化合物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワ及びエンバク)、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、ナタネ、ビート(例えば、テンサイ及び飼料用ビート)、ラッカセイ、野菜(例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ、アブラナ科野菜、タマネギ及びレタス)、果実植物、芝生及び観賞植物の種子を包含する。穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、ナタネ及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

【0267】

既に上記で記載したように、式(I)で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、ポリペプチド(特に、殺虫特性及び／又は殺線虫特性を有するポリペプチド)の発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子を包含する。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、バシルス(*Bacillus*)種、リゾビウム(*Rhizobium*)種、プセウドモナス(*Pseudomonas*)種、セラチア(*Serratia*)種、トリコデルマ(*Trichoderma*)種、クラビバクテル(*Clavibacter*)種、グロムス(*Glomus*)種又はグリオクラジウム(*Gliocladium*)種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種(*Bacillus* sp.)に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。該異種遺伝子は、さらに好ましくは、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する。

【0268】

本発明に関連して、式(I)で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子(例えば、プライミング)を使用することもできる。イネの種子の場合、例えば、特定の段階(鳩胸段階)に達するまで水中で予め膨潤させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が良好になり、及び、出芽がより均一になる。

【0269】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、種子から生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式(I)で表される化合物の量及び／又はさらなる添加剤の量を選択することに、概して注意しなければならない。このことは、とり

わけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性成分の場合に、確実に実施しなければならない。

【0270】

一般に、式（I）で表される化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤及びプロセスは、当業者には知られている。

【0271】

式（I）で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換することが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換することも可能である。

【0272】

これらの製剤は、既知方法で、式（I）で表される化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、製造する。

【0273】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な着色剤は、そのような目的に関して慣習的な全ての着色剤である。水中であまり溶解しない顔料又は水中で溶解する染料を使用することができる。その例としては、「Rhodamin B」、「C. I. Pigment Red 112」及び「C. I. Solvent Red 1」の名称で知られている着色剤などを挙げることができる。

【0274】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用する。

【0275】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる適切な分散剤及び／又は乳化剤は、農薬活性化合物の製剤に関して慣習的な非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用する。適している非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体などがある。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリアルスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【0276】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる消泡剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的に使用される全ての泡抑制物質である。好ましくは、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウムを使用する。

【0277】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げることができる。

【0278】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる第2の増粘剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。好ましい例としては、セルロース誘導体、アクリル酸誘導体、キサンタン、変性クレイ及び微粉化シリカなどを挙げることができる。

【0279】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用

10

20

30

40

50

な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げることができる。

【0280】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3（＝ジベレリン酸）、ジベレリンA4及びジベレリンA7である。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている（cf. R. Wegler “Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel” vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412）。

10

【0281】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤（concentrate）又は水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズ及びビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

20

【0282】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はその種子粉衣製剤から調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機（これは、バッチ式又は連続的に作動される）の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのまま添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

30

【0283】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該製剤中の式（I）で表される化合物の特定の含有量及び当該種子に左右される。式（I）で表される化合物の施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001～50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01～15gである。

【0284】

動物衛生

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式（I）で表される化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物又は内部寄生生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生生物」は、特に、蠕虫類及び原生動物（例えば、コクシジウム）を包含する。外部寄生生物は、典型的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類及びダニ類である。

40

【0285】

獣医学の分野において、恒温動物に対する毒性が好ましい程度である式（I）で表される化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物（domestic animal）において発生する寄生生物を防除するのに適している。

【0286】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、並びに

50

、特に、ウシ及びブタ；家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、及び、特に、ニワトリ；魚類及び甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類及び甲殻類の動物；及び、さらに、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

【0287】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テンジクネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、及び、特に、イヌ、ネコ、籠の鳥、爬虫類、両生類、又は、水槽の魚。

【0288】

好ましい実施形態では、式（I）で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0289】

好ましい別の実施形態では、式（I）で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、及び、特に、家禽類に対して、投与される。

【0290】

動物寄生生物を防除するために式（I）で表される化合物を使用することは、上記動物の病気、死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性（performance）（肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合）の低下を低減又は予防することが意図され、その結果、より経済で且つより容易な動物飼育が可能となり、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

【0291】

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する（control）」又は「防除する（controlling）」は、式（I）で表される化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式（I）で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すことが可能であること、その成長を阻害することが可能であること、又は、その増殖を阻害することが可能であることを意味する。

【0292】

節足動物としては、以下のものを挙げることができる：

アノプルリダ目（Anoplurida）の、例えば、ハエマトピヌス属種（Haematopinus spp.）、リノグナツス属種（Linognathus spp.）、ペジクルス属種（Pediculus spp.）、プチルス属種（Phtirus spp.）、ソレノポテス属種（Solenopotes spp.）；マロファギダ目（Mallophagida）並びにアムブリセリナ亜目（Amblycerina）及びイスクノセリナ亜目（Ischnocerina）の、例えば、トリメノポン属種（Trimenopon spp.）、メノポン属種（Menopon spp.）、トリノトン属種（Trinoton spp.）、ボビコラ属種（Bovicola spp.）、ウェルネキエラ属種（Werneckiella spp.）、レピケントロン属種（Lepikentron spp.）、ダマリナ属種（Damalina spp.）、トリコデクテス属種（Trichodectes spp.）、フェリコラ属種（Felicola spp.）；双翅目（Diptera）並びにネマトセリナ亜目（Nematocerina）及びブラキセリナ亜目（Brachycerina）の、例えば、アエデス属種（Aedes spp.）、アノフェレス属種（Anopheles spp.）、クレキス属種（Culex spp.）、シムリウム属種（Simulium spp.）、エウシムリウム属種（Eusimulium spp.）、フレボトムス属種（Phlebotomus spp.）、ルトゾミイア属種（Lutzomyia spp.）、クリコイデス属種（Culicoides spp.）、クリソプス属種（Chrysops spp.）、オダグミア属種（Odagmia spp.）、ウィルヘルミア属種（Wilhelmia spp.）、ヒボミトラ属種（Hybomitra spp.）、アチロツス属種（Atylotus spp.）、タバヌス属種（Tabanus spp.）、ハエマトポタ属種（Haematopota spp.）、フィリポミイア属種（Philipomyia spp.）、ブラウラ属種（Braul

10

20

30

40

50

a spp.)、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア属種 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキス属種 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトビア属種 (*Haematobia* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、グロシナ属種 (*Glossina* spp.)、カリホラ属種 (*Calliphora* spp.)、ルシリア属種 (*Lucilia* spp.)、クリソミイア属種 (*Chrysomyia* spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ属種 (*Sarcophaga* spp.)、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* spp.)、ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、メロファグス属種 (*Melophagus* spp.)、リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、チブラ属種 (*Tipula* spp.) ; ノミ目 (*Siphonapterida*) の、例えば、プレキス属種 (*Pulex* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp.)、ツンガ属種 (*Tunga* spp.)、キセノプシラ属種 (*Xenopsylla* spp.)、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp.) ;

ヘテロプテリダ目 (*Heteropterida*) の、例えば、シメキス属種 (*Cimex* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロングイルス属種 (*Panstrongylus* spp.) ; 並びに、さらに、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫及び衛生害虫。

【0293】

節足動物としては、さらに、以下のものを挙げることができる：

ダニ亜綱 (*Acarari* (*Acarina*)) 及びメタスチグマタ目 (*Metastigmata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例えば、イキシデス属種 (*Ixodes* spp.)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (*Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp.)、デルマセントル属種 (*Dermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis* spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.) (多宿主ダニの原属) ; メソスチグマタ目 (*Mesostigmata*) の、例えば、デルマニスス属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニスス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)、プネウモニスス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、バロア属種 (*Varroa* spp.)、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.) ; アクチネジダ目 (*Actinedida* (*Prostigmata*)) の、例えば、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属種 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属種 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス属種 (*Psorergates* spp.)、デモデキス属種 (*Demodex* spp.)、トロムビクラ属種 (*Trombicula* spp.)、ネオトロムビクラ属種 (*Neotrombiculla* spp.)、リストロホルス属種 (*Listrophorus* spp.) ; 及び、アカリジダ目 (*Acaridida* (*Astigmata*)) の、例えば、アカルス属種 (*Acarus* spp.)、チロファグス属種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、プ

テロリクス属種 (*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属種 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属種 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属種 (*Cytodites* spp.)、ラミノシオプテス属種 (*Laminosioptes* spp.)。

【0294】

寄生性原生動物としては、以下のものを挙げるができる：

鞭毛虫亜門 (*Mastigophora*) (鞭毛虫類 (*Flagellata*))、例えば、トリパノソーマ科 (*Trypanosomatidae*)、例えば、トリパノソーマ・b.・ブルセイ (*Trypanosoma b. brucei*)、トリパノソーマ・b.・ガムビエンセ (*T. b. gambiense*)、トリパノソーマ・b.・ロデシエンセ (*T. b. rhodesiense*)、トリパノソーマ・コンゴレンセ (*T. congolense*)、トリパノソーマ・クルジ (*T. cruzi*)、トリパノソーマ・エバンシ (*T. evansi*)、トリパノソーマ・エクイヌム (*T. equinum*)、トリパノソーマ・レウィシ (*T. lewisi*)、トリパノソーマ・ペルカエ (*T. percae*)、トリパノソーマ・シミアエ (*T. simiae*)、トリパノソーマ・ビバキス (*T. vivax*)、レイスマニア・ブラシリエンシス (*Leishmania brasiliensis*)、レイスマニア・ドノバニ (*L. donovani*)、レイスマニア・トロピカ (*L. tropica*)；例えば、トリコモナス科 (*Trichomonadidae*)、例えば、ギアルジア・ラムブリア (*Giardia lamblia*)、ギアルジア・カニス (*G. canis*)；

有毛根足虫亜門 (*Sarcomastigophora*) (根足虫類 (*Rhizopoda*))；例えば、エントアメーバ科 (*Entamoebidae*)、例えば、エンタモエバ・ヒストリチカ (*Entamoeba histolytica*)；ハルトマネリダエ科 (*Hartmanellidae*)、例えば、アカンタモエバ属種 (*Acanthamoeba* sp.)、ハルマレラ属種 (*Harmanella* sp.)；

アピコンプレックス門 (*Apicomplexa*) (孢子虫類 (*Sporozoa*))、例えば、エイメリア科 (*Eimeriidae*)、例えば、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、エイメリア・アデノイデス (*E. adenoides*)、エイメリア・アラバメンシス (*E. alabamensis*)、エイメリア・アナチス (*E. anatis*)、エイメリア・アンセリナ (*E. anserina*)、エイメリア・アルロインギ (*E. arloingi*)、エイメリア・アシャタ (*E. ashata*)、エイメリア・アウブルネンシス (*E. auburnensis*)、エイメリア・ボビス (*E. bovis*)、エイメリア・ブルネッチ (*E. brunetti*)、エイメリア・カニス (*E. canis*)、エイメリア・キンキラエ (*E. chinchillae*)、エイメリア・クルペアルム (*E. clupearum*)、エイメリア・コルムバエ (*E. columbae*)、エイメリア・コントルタ (*E. contorta*)、エイメリア・克蘭ダリス (*E. crandalis*)、エイメリア・デブリエクキ (*E. deblickei*)、エイメリア・ジスペルサ (*E. dispersa*)、エイメリア・エリプソイダレス (*E. ellipsooidales*)、エイメリア・ファルシホルミス (*E. falciformis*)、エイメリア・ファウレイ (*E. faurei*)、エイメリア・フラベセンシス (*E. flaveescens*)、エイメリア・ガロパボニス (*E. gallopavonis*)、エイメリア・ハガニ (*E. hagai*)、エイメリア・インテスチナリス (*E. intestinalis*)、エイメリア・イロクオイナ (*E. iroquoiana*)、エイメリア・イレシズア (*E. irresidua*)、エイメリア・ラベアナ (*E. labbeana*)、エイメリア・レウカルチ (*E. leucarti*)、エイメリア・マグナ (*E. magna*)、エイメリア・マキシマ (*E. maxima*)、エイメリア・メジア (*E. media*)、エイメリア・メレアグリジス (*E. meleagridis*)

10

20

30

40

50

is)、エイメリア・メレアグリミチス(E. meleagrimitis)、エイメリア・ミチス(E. mitis)、エイメリア・ネカトリキス(E. necatrix)、エイメリア・ニナコーリアキモバエ(E. ninakohlyakimovae)、エイメリア・オビス(E. ovis)、エイメリア・パルバ(E. parva)、エイメリア・パボニス(E. pavonis)、エイメリア・ペルホランス(E. perforans)、エイメリア・ファサニ(E. phasani)、エイメリア・ピリホルミス(E. piriiformis)、エイメリア・ブラエコキス(E. praecox)、エイメリア・レシズア(E. residua)、エイメリア・スカブラ(E. scabra)、エイメリア属種(E. spec.)、エイメリア・ステダイ(E. stiedai)、エイメリア・スイス(E. suis)、エイメリア・テナラ(E. tenella)、エイメリア・ツルンカタ(E. truncata)、エイメリア・ツルッタエ(E. truttae)、エイメリア・ズエルニイ(E. zuernii)、グロビジウム属種(Globidium spec.)、イソスポラ・ベリ(Isospora belli)、イソスポラ・カニス(I. canis)、イソスポラ・フェリス(I. felis)、イソスポラ・オヒオエンシス(I. ohioensis)、イソスポラ・リボルタ(I. rivolta)、イソスポラ属種(I. spec.)、イソスポラ・スイス(I. suis)、シスチスポラ属種(Cystispora spec.)、クリプトスポリジウム属種(Cryptosporidium spec.)、特に、クリプトスポリジウム・パルブム(C. parvum)；例えば、トキソプラズマ科(Toxoplasma didae)、例えば、トキソプラズマ・ゴンジイ(Toxoplasma gondii)、ハモンジア・ヘイドルニイ(Hammondia heydornii)、ネオスポラ・カニヌム(Neospora caninum)、ベスノイチア・ベスノイチイ(Besnoitia besnoitii)；例えば、肉胞子虫科(Sarcocystidae)、例えば、サルコシスチス・ボビカニス(Sarcocystis bovicanis)、サルコシスチス・ボビホルミス(S. bovi hominis)、サルコシスチス・オビカニス(S. ovicanis)、サルコシスチス・オビフェリス(S. ovifelis)、サルコシスチス・ネウロナ(S. neurona)、サルコシスチス属種(S. spec.)、サルコシスチス・スイホミニス(S. sui hominis)；例えば、レウコゾイダエ科(Leucozooidae)、例えば、レウコジトゾオン・シモンジ(Leucozytozoon simondi)；例えば、プラスモディウム科(Plasmodiidae)、例えば、プラスモジウム・ベルゲイ(Plasmodium berghei)、プラスモジウム・ファルシパルム(P. falciparum)、プラスモジウム・マラリアエ(P. malariae)、プラスモジウム・オバレ(P. ovale)、プラスモジウム・ビバキス(P. vivax)、プラスモジウム属種(P. spec.)；例えば、ピロプラズマ亜目(Piroplasmea)、例えば、バベシア・アルゲンチナ(Babesia argentina)、バベシア・ボビス(B. bovis)、バベシア・カニス(B. canis)、バベシア属種(B. spec.)、テイレリア・パルバ(Theileria parva)、テイレリア属種(Theileria spec.)；例えば、アデレア亜目(Adeleina)、例えば、ヘパトゾオン・カニス(Hepatozoon canis)、ヘパトゾオン属種(H. spec.)。

【0295】

病原性内部寄生生物(これは、蠕虫類である)としては、扁形動物門(Platyhelmintha)〔例えば、単生類(Monogenea)、条虫類(cestodes)及び吸虫類(trematodes)〕、線形動物(roundworms)、鉤頭動物門(Acanthocephala)及び舌形動物門(Pentastoma)などがある。これらのものとしては、以下のものを挙げることができる：

単生綱(Monogenea)：例えば：ギロダクチルス属種(Gyrodactylus spp.)、ダクチロギルス属種(Dactylogyrus spp.)、ポリ

ストマ属種 (*Polystoma* spp.) ;

条虫類 (*Cestodes*) : ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllidea*) の、例えば: ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、スピロメトラ属種 (*Spirometra* spp.)、シストセファルス属種 (*Schistocephalus* spp.)、リグラ属種 (*Ligula* spp.)、ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジフロゴノポルス属種 (*Diphlogonoporus* spp.) ;

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllide*) の、例えば: メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、チサノソマ属種 (*Thysanosoma* spp.)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia* spp.)、アビテリナ属種 (*Avitellina* spp.)、スチレシア属種 (*Stilesia* spp.)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia* spp.)、アンジラ属種 (*Andyra* spp.)、ベルチエラ属種 (*Bertiella* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、ヒダチゲラ属種 (*Hydatigera* spp.)、ダバイネア属種 (*Davainea* spp.)、ライリエチナ属種 (*Raillietina* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、エキノレピス属種 (*Echinolepis* spp.)、エキノコチレ属種 (*Echinocotyle* spp.)、ジオルキス属種 (*Diorchis* spp.)、ジピリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、ジョイエウキシエラ属種 (*Joyeuxiella* spp.)、ジプロピリジウム属種 (*Diplopylidium* spp.) ;

吸虫類 (*Trematodes*) : 二生亜綱 (*Digenea*) の、例えば: ジプロストムム属種 (*Diplostomum* spp.)、ポストジプロストムム属種 (*Posthodiplostomum* spp.)、シストソマ属種 (*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属種 (*Trichobilharzia* spp.)、オルニトビルハルジア属種 (*Ornithobilharzia* spp.)、アウストロビルハルジア属種 (*Austrotrichobilharzia* spp.)、ギガントビルハルジア属種 (*Gigantobilharzia* spp.)、レウコクロリジウム属種 (*Leucochloridium* spp.)、ブラキライマ属種 (*Brachylaema* spp.)、エキノストマ属種 (*Echinostoma* spp.)、エキノパリフィウム属種 (*Echinoparyphium* spp.)、エキノカスムス属種 (*Echinochasmus* spp.)、ヒポデラエウム属種 (*Hypoderaeum* spp.)、ファシオラ属種 (*Fasciola* spp.)、ファシオリデス属種 (*Fasciolides* spp.)、ファシオロプシス属種 (*Fasciolopsis* spp.)、シクロコエルム属種 (*Cyclocoelum* spp.)、チフロコエルム属種 (*Typhlocoelum* spp.)、パラムフィストムム属種 (*Paramphistomum* spp.)、カリコホロン属種 (*Calicophoron* spp.)、コチロホロン属種 (*Cotylophoron* spp.)、ギガントコチレ属種 (*Gigantocotyle* spp.)、フィスコエデリウス属種 (*Fischöderius* spp.)、ガストロチラクス属種 (*Gastrothylacus* spp.)、ノトコチルス属種 (*Notocotylus* spp.)、カタトロピス属種 (*Catantropis* spp.)、ブラギオルキス属種 (*Plagiorchis* spp.)、プロストゴニムス属種 (*Prosthogonimus* spp.)、ジクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、エウリトレマ属種 (*Eurytrema* spp.)、トログロトレマ属種 (*Troglootrema* spp.)、パラゴニムス属種 (*Paragonimus* spp.)、コリリクルム属種 (*Collyriclum* spp.)、ナノフィエツス属種 (*Nanophyetu*

10

20

30

40

50

s spp.)、オピストルキス属種 (Opisthorchis spp.)、クロノルキス属種 (Clonorchis spp.)、メトルキス属種 (Metorchis spp.)、ヘテロフィエス属種 (Heterophyes spp.)、メタゴニムス属種 (Metagonimus spp.) ;

線虫類：ベンチュウ目 (Trichinellida) の、例えば：トリクリス属種 (Trichuris spp.)、カピラリア属種 (Capillaria spp.)、パラカピラリア属種 (Paracapillaria spp.)、エウコレウス属種 (Eucoleus spp.)、トリコモソイデス属種 (Trichomosoides spp.)、トリキネラ属種 (Trichinella spp.) ;

クキセンチュウ目 (Tylenchida) の、例えば：ミクロネマ属種 (Micronema spp.)、ストロンギロイデス属種 (Strongyloides spp.) ;

カンセンチュウ目 (Rhabditida) の、例えば：ストロンギルス属種 (Strongylus spp.)、トリオドントホルス属種 (Triodontophorus spp.)、オエソファゴドンツス属種 (Oesophagodontus spp.)、トリコネマ属種 (Trichonema spp.)、ギアロセファルス属種 (Gyallocephalus spp.)、シリンドロファリンキス属種 (Cylindropharynx spp.)、ポテリオストムム属種 (Poteriostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyclococercus spp.)、シリコステファヌス属種 (Cylicostephanus spp.)、オエソファゴストムム属種 (Oesophagostomum spp.)、カベルチア属種 (Chabertia spp.)、ステファヌルス属種 (Stephanurus spp.)、アンシロストマ属種 (Ancylostoma spp.)、ウンシナリア属種 (Uncinaria spp.)、ネカトル属種 (Necator spp.)、ブノストムム属種 (Bunostomum spp.)、グロボセファルス属種 (Globocephalus spp.)、シンガムス属種 (Syngamus spp.)、シアトストマ属種 (Cyathostoma spp.)、メタストロンギルス属種 (Metastrongylus spp.)、ジクチオカウルス属種 (Dictyocaulus spp.)、ムエレリウス属種 (Muellerius spp.)、プロトストロンギルス属種 (Protostrongylus spp.)、ネオストロンギルス属種 (Neoststrongylus spp.)、シストカウルス属種 (Cystocaulus spp.)、プネウモストロンギルス属種 (Pneumoststrongylus spp.)、スピコカウルス属種 (Spicocaulus spp.)、エラホストロンギルス属種 (Elaphoststrongylus spp.)、パレラホストロンギルス属種 (Parelaphoststrongylus spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、パラクレノソマ属種 (Paracrenosoma spp.)、オスレルス属種 (Oslerus spp.)、アングリオストロンギルス属種 (Angiostrongylus spp.)、アエルロストロンギルス属種 (Aelurostrongylus spp.)、フィラロイデス属種 (Filaroides spp.)、パラフィラロイデス属種 (Parafilaroides spp.)、トリコストロンギルス属種 (Trichostrongylus spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、オステルタギア属種 (Ostertagia spp.)、テラドルサギア属種 (Teladorsagia spp.)、マルシャラギア属種 (Marshallagia spp.)、クーペリア属種 (Cooperia spp.)、ニッポストロンギルス属種 (Nippostrongylus spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (Heligmosomoides spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ヒオストロンギルス属種 (Hyoststrongylus spp.)、オベリスコイデス属種 (Obeliscooides spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、オルラヌス属種 (Ollulanus spp.) ;

10

20

30

40

50

センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば：オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、パスアルス属種 (*Passalurus* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、アスピクルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキシカラ属種 (*Toxocara* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Baylisascaris* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis* spp.)、アスカリジア属種、(*Ascaridia* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハブロネマ属種 (*Habronema* spp.)、パラブロネマ属種 (*Parabronema* spp.)、ドラスキア属種 (*Draschia* spp.)、ドラクンクルス属種 (*Dracunculus* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、リトモソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.)、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)；

鉤頭動物門 (*Acanthocephala*)：ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば：マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.)；ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば：フィリコリス属種 (*Filicollis* spp.)；サジョウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば：モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.)；

コウトウチュウ目 (*Echinorhynchida*) の、例えば：アカントセファルス属種 (*Acanthocephalus* spp.)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus* spp.)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides* spp.)；

舌形動物門 (*Pentastoma*)：ポロケファルス目 (*Porocephalida*) の、例えば：リングアツラ属種 (*Linguatula* spp.)。

【0296】

獣医学の分野において、及び、動物飼育において、式 (I) で表される化合物は、当技術分野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経路、非経口的経路、経皮的経路又は経鼻的経路を介して投与する。投与は、予防的又は治療的であり得る。

【0297】

かくして、本発明の一実施形態は、薬物としての式 (I) で表される化合物の使用である。

【0298】

さらなる態様は、坑内部寄生生物剤としての、特に、殺蠕虫剤 (*helminthicidal agent*) 又は坑原生動物剤 (*antiprotozoic agent*) としての、式 (I) で表される化合物の使用である。式 (I) で表される化合物は、例えば、畜産業において、動物育種において、家畜用の建物の中で、及び、衛生学の分野において、坑内部寄生生物剤として使用するのに、特に、殺蠕虫剤又は坑原生動物剤として使用するのに、適している。

【0299】

10

20

30

40

50

さらなる態様は、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式（I）で表される化合物の使用に関する。さらなる態様は、例えば、畜産業における、動物育種における、家畜用の建物の中における、又は、衛生学の分野における、坑外部寄生生物剤としての、特に、殺虫剤又は殺ダニ剤などの殺節足動物剤としての、式（I）で表される化合物の使用に関する。

【0300】

媒介動物の防除

式（I）で表される化合物は、媒介動物（vector）の防除において使用することも可能である。本発明に関連して、媒介動物は、病原体（例えば、ウイルス類、蠕虫類（worms）、単細胞生物及び細菌類）を病原体保有宿主（植物、動物、ヒトなど）から宿主まで運ぶことが可能な節足動物（特に、昆虫又はクモ形類動物）である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る（例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ）、又は、宿主体内への注入後に運ばれ得る（例えば、蚊によるマラリア原虫）。

10

【0301】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、以下のとおりである：

（1）蚊類

- ・ ハマダラカ（*Anopheles*）： マラリア、フィラリア症；
- ・ アカイエカ（*Culex*）： 日本脳炎、フィラリア症、別のウイルス性疾患、蠕虫類の運搬；
- ・ ヤブカ（*Aedes*）： 黄熱病、デング熱、フィラリア症、別のウイルス性疾患；
- ・ ブユ（*Simuliidae*）： 蠕虫類（特に、回旋糸状虫（*Onchocerca volvulus*））の運搬；

20

（2）シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

（3）ノミ類： 伝染病、発疹熱；

（4）ハエ類： 睡眠病（トリパノソーマ病）；コレラ、別の細菌性疾患；

（5）ダニ類： ダニ症（acariosis）、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兎病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎（TBE）、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症（borreliosis）；

（6）マダニ類： ボレリア症（borrelioses）、例えば、ダットン回帰熱ボレリア（*Borrelia duttoni*）、ダニ媒介脳炎、Q熱（*Coxiella burnetii*）、バベシア症（*Babesia canis canis*）。

30

【0302】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類又はアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類及び線虫類である。

【0303】

本発明に関連して、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び／又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類〔特に、ヤブカ属（*Aedes*）の蚊、ハマダラカ属（*Anopheles*）の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ（*A. gambi*）、アノフェレス・アラビエンシス（*A. arabiensis*）、アノフェレス・フネスツス（*A. funestus*）、アノフェレス・ジルス（*A. dirus*）（マラリア）、及び、アカイエカ属（*Culex*）の蚊〕、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

40

【0304】

式（I）で表される化合物が抵抗性を打破する（resistance-breaking）場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0305】

式（I）で表される化合物は、疾患の予防及び／又は媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、

50

農業において、園芸において、林業において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式（I）で表される化合物の使用である。

【0306】

工業材料の保護

式（I）で表される化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目（Coleoptera）、ハチ目（Hymenoptera）、シロアリ目（Isoptera）、チョウ目（Lepidoptera）、チャタテムシ目（Psocoptera）及びシミ目（Zygentoma）の昆虫類〕による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

10

【0307】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、加工木材製品及び塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【0308】

さらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、少なくとも1種類のさらなる殺虫剤及び／又は少なくとも1種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【0309】

さらなる実施形態では、式（I）で表される化合物は、即時使用可能な（ready-to-use）殺有害生物剤として存在している。即ち、それは、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能である。適切なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、特に、上記で挙げたものである。

20

【0310】

驚くべきことに、式（I）で表される化合物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式（I）で表される化合物は、単独で、又は、別の活性成分と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【0311】

衛生分野における害虫の防除

式（I）で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定的には、本発明は、家庭内の分野において、衛生の分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間（例えば、住居、工場の通路、オフィス及び車両の客室）において遭遇する昆虫類、クモ形類動物及びダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、式（I）で表される化合物は、単独で使用するか、又は、別の活性成分及び／又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式（I）で表される化合物は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

30

【0312】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱（Arachnida）のサソリ目（Scorpiones）、クモ目（Araneae）及びザトウムシ目（Opiliones）の害虫、ムカデ綱（Chilopoda）及びヤスデ綱（Diplopoda）の害虫、昆虫綱（Insecta）のゴキブリ目（Blattodea）、コウチュウ目（Coleoptera）、ハサミムシ目（Dermaptera）、ハエ目（Diptera）、カメムシ亜目（Heteroptera）、ハチ目（Hymenoptera）、シロアリ目（Isoptera）、チョウ目（Lepidoptera）、シラミ目（Phthiraptera）、チャタテムシ目（Psocoptera）、バッタ目（Saltatoria 又は Orthoptera）、ノミ目（Siphonaptera）及びシミ目（Zygentoma）の害虫、並びに、軟甲綱（Malacostraca）のワラジムシ目（Isopoda）の害虫などをあげることができる。

40

【0313】

50

施用は、例えば、エーロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム（automatic fogging system）、噴霧器（fogger）、泡、ゲル、セルロース製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙（moth papers）、防虫バッグ（moth bags）及び防虫ゲル（moth gels）において実施するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて実施するか、又は、ベイトステーションで実施する。

【実施例】

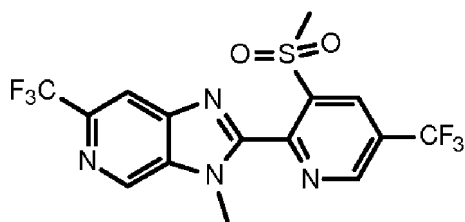
【0314】

10

調製実施例：

調製実施例 1：3-メチル-2-[3-(メチルスルホニル)-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)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン (I-36)

【化44】



20

【0315】

41 mg (0.10 mmol) の 3-メチル-2-[3-(メチルスルファニル)-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)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジンを 4 mL のジクロロメタンに溶解させ、86.5 mg (0.36 mmol) のメタクロロ過安息香酸を 0℃で添加し、次いで、その混合物を室温で 20 時間攪拌する。その混合物を重亜硫酸ナトリウム溶液と混合させ、10 分間攪拌し、30 mL の水で希釈し、45%水酸化ナトリウム溶液を用いて pH 9-10 に調節する。その混合物をジクロロメタンで 3 回抽出し、次いで、その有機相を合して溶媒を減圧下で除去する。

30

【0316】

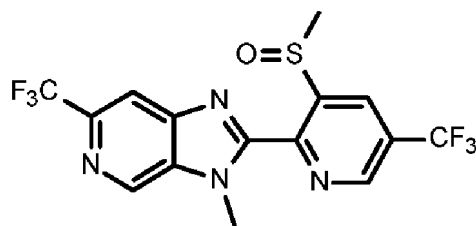
(log P (中性) : 2.64 ; MH⁺ : 425 ; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm : 3.70 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 8.83 (s, 1H), 9.32 (s, 1H), 9.58 (s, 1H)。

【0317】

3-メチル-2-[3-(メチルスルフィニル)-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-(トリフルオロメチル)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン (I-26) の調製

40

【化 4 5】



10

【0318】

41 mg (0.10 mmol) の 3-メチル-2-[[3-(メチルスルファニル)-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)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジンを 4 mL のジクロロメタンに溶解させ、1.92 mg (0.04 mmol) のギ酸及び 28.44 mg の 35% 過酸化水素溶液を室温で添加する。その混合物を室温で 5 時間攪拌し、重亜硫酸ナトリウム溶液を添加し、その混合物をさらに 3 時間攪拌する。次いで、その混合物を 10% 炭酸水素ナトリウム溶液と一緒に攪拌し、その有機相を除去し、その水相をジクロロメタンで 2 回抽出し、その有機相を合し、次いで、溶媒を減圧下で除去する。

【0319】

20

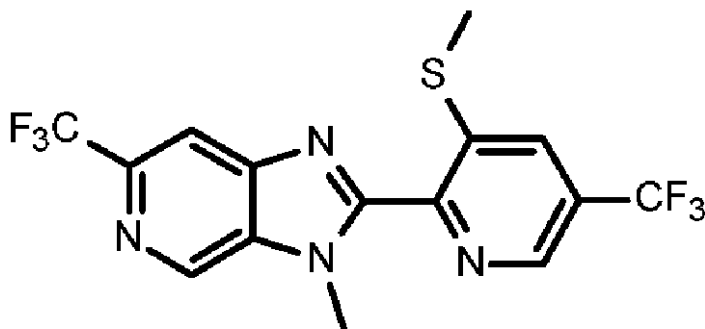
(log P (中性) : 2.76 ; MH⁺ : 409 ; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm : 3.15 (s, 3H), 4.35 (s, 3H), 8.37 (s, 1H), 8.85 (s, 1H), 9.37 (s, 1H), 9.39 (s, 1H)。

【0320】

3-メチル-2-[[3-(メチルスルファニル)-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)-3H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン (I-3) の調製

【化 4 6】

30



40

【0321】

150 mg (0.39 mmol) の 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-c]ピリジンと 83 mg (1.18 mmol) のナトリウムメタンチオラートを DMF の中で室温で 6 時間攪拌する。その混合物を水と混合させ、酢酸エチルで 3 回抽出する。その有機相を合して塩化ナトリウム溶液で洗浄し、除去し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で除去する。

【0322】

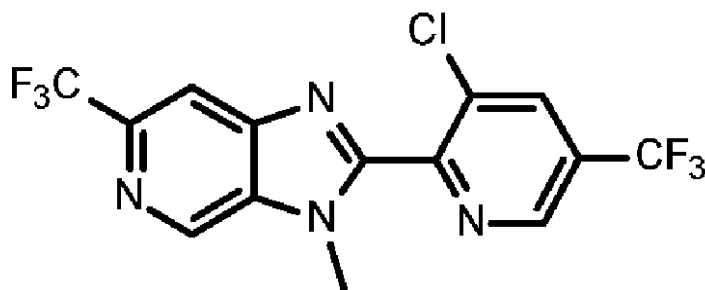
50

(log P (中性)) : 3.16 ; MH^+ : 393 ; ^1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm : 2.58 (s, 3H), 4.06 (s, 3H), 8.27 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 9.29 (s, 1H)。

【0323】

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-c]ピリジン (IX-01) の調製

【化47】



10

20

【0324】

950 mg (4.97 mmol) の N^3 -メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3,4-ジアミン (II-01)、1.12 g (4.97 mmol) の 3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸及び953 mg (4.97 mmol) の 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) を 10 mL のピリジンの中で 115 °C で 7 時間攪拌する。その反応混合物から溶媒を減圧下で除去し、次いで、水を添加し、その混合物を酢酸エチルで 3 回抽出する。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、再度濃縮し、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC を用いて、カラムクロマトグラフィー精製によって精製する。

30

【0325】

(log P (中性)) : 2.96 ; MH^+ : 381 ; ^1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm : 4.00 (s, 3H), 8.35 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 9.22 (s, 1H), 9.30 (s, 1H)。

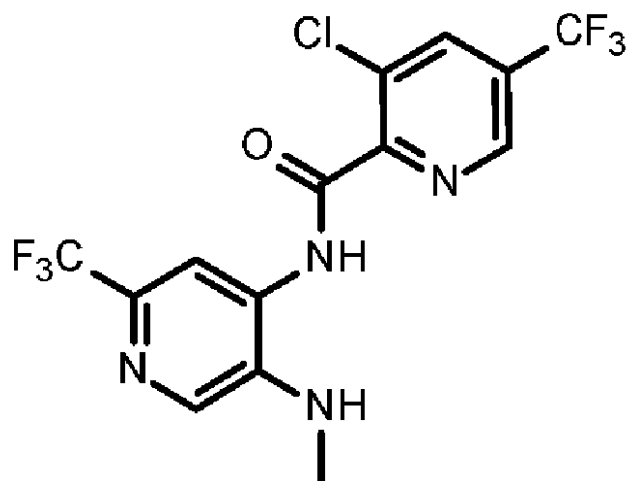
【0326】

3-クロロ-N-[5-(メチルアミノ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキサミド (VII-01) の調製

N^3 -メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3,4-ジアミン (II-01) と 3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボン酸から 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-c]ピリジン (IX-01) を調製するための上記方法によって、化合物 (IX-01) に関する中間体としての化合物 3-クロロ-N-[5-(メチルアミノ)-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]-5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキサミド (VII-01) も同様に調製することができる。

40

【化 4 8】



10

【0327】

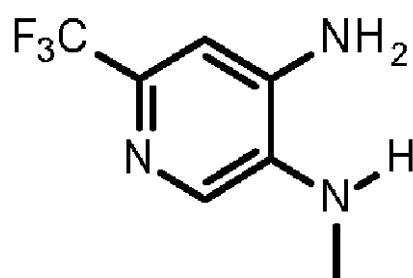
(log P (中性) : 3.09 ; MH^+ : 399 ; ^1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm : 2.87 (d, 3H), 5.97 (q, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 9.09 (s, 1H), 10.40 (br. s, 1H)。

20

【0328】

N³-メチル-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3,4-ジアミン (II-01)
の調製

【化 4 9】



30

【0329】

0.93 g (3.0 mmol) の [4-アミノ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル] カルバミン酸ベンジルを 85 mL のテトラヒドロフランに溶解させた溶液を 0℃まで冷却し、0.65 g (17 mmol) の水素化アルミニウムリチウムと混合させる。その混合物を、アルゴン下、0℃で 15 分間攪拌し、次いで、室温で 4 時間攪拌する。酢酸エチルを添加することによって、過剰の水素化アルミニウムリチウムを破壊し、その混合物を濾過し、その濾液を、毎回 50 mL の 2 N 塩酸で 2 回抽出する。その塩酸抽出物を合し、冷却しながら、炭酸ナトリウムを用いて pH = 8 に調節する。次いで、その混合物を、毎回 100 mL の酢酸エチルで 2 回抽出し、その有機相を合し、硫酸ナトリウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去する。その生成物を、ヘキサン/イソプロパノールの混合物から再結晶させることによってさらに精製する。

40

50

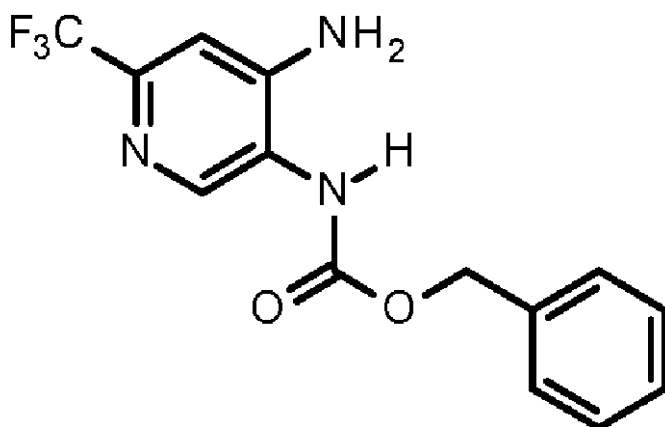
【0330】

(MH^+ : 192; ^1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 2.81 (d, 3H), 5.22 (q, 1H), 5.82 (br. s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.57 (s, 1H)。

【0331】

[4-アミノ-6-(トリフルオロメチル)ピリジン-3-イル]カルバミン酸ベンジルの調製

【化50】



10

20

【0332】

0.91 g of 6-(trifluoromethyl)pyridin-3,4-diamine in 20 mL of tetrahydrofuran and 2 mL of pyridine mixture is dissolved. While stirring, 1.07 g (6.3 mmol) of chloroformate benzyl (chloroglycolic acid benzyl) in 2 mL of tetrahydrofuran is dissolved and the solution is added dropwise. Next, the reaction mixture is stirred overnight, diluted with 100 mL of water, extracted twice with 100 mL of ethyl acetate. The organic phase is combined, washed with 50 mL of water, dried with sodium sulfate, concentrated. The residue is washed with 50 mL of chloroform. As a result, the product is obtained as a white solid.

30

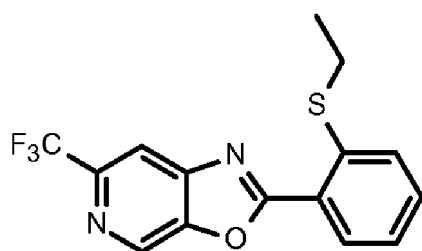
【0333】

(^1H NMR (500 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm: 5.15 (s, 2H), 6.40 (br. s, 2H), 7.05 (s, 1H), 7.30-7.45 (m, 5H), 8.35 (s, 1H), 9.00 (br. s, 1H)。

【0334】

調製実施例2: 2-[2-(エチルスルファニル)フェニル]-6-(トリフルオロメチル)[1,3]オキサゾロ[5,4-c]ピリジン(I-35)

【化51】



40

【0335】

400 mg (1.16 mmol) of 2-(ethylsulfanyl)-N-[5-hydroxy

50

シー 2 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] ベンズアミド及び 398 mg (1.51 mmol) のトリフェニルホスフィンを用いた THF に溶解させ、トルエン中の 40% アゾジカルボン酸ジエチル (DEAD) 661 mg (1.51 mmol) を室温で滴下して加える。その混合物を室温で 3 時間攪拌する。次いで、溶媒を減圧下で留去し、その残渣を、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用するカラムクロマトグラフィー精製によって精製する。

【0336】

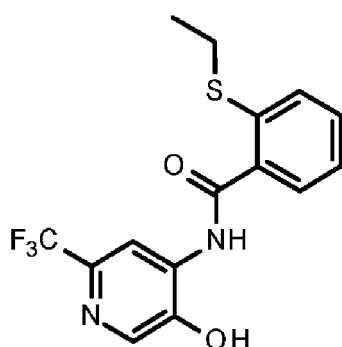
(log P (中性)) : 4.07 ; MH^+ : 325 ; ^1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm : 1.32 (t, 3H), 3.10 (q, 2H), 7.42 (t, 1H), 7.60-7.69 (m, 2H), 8.21 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 9.33 (s, 1H)。

10

【0337】

2 - (エチルスルファニル) - N - [5 - ヒドロキシ - 2 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 4 - イル] ベンズアミド (VII-02) の調製

【化 52】



20

【0338】

206 mg (1.12 mmol) の 2 - (エチルスルファニル) 安息香酸及び 201 mg (1.12 mmol) の 4 - アミノ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - オールを 5 mL のピリジンに溶解させ、325 mg (1.69 mmol) の 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド塩酸塩 (EDCI) を添加し、その混合物を、50℃で 2 時間攪拌し及び 80℃で 3 時間攪拌する。溶媒を減圧下で留去し、その残渣を取って水の中に入れ、酢酸エチルで抽出する。その有機相を塩化ナトリウム溶液で洗浄し、除去し、硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮する。その残渣を、溶離液として水/アセトニトリルの勾配を使用する分取 HPLC を用いて、カラムクロマトグラフィー精製によって精製する。

30

【0339】

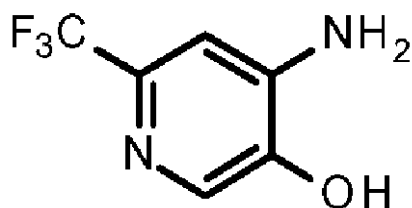
(log P (中性)) : 1.59 ; MH^+ : 343 ; ^1H NMR (400 MHz, D_6 -DMSO) δ ppm : 1.21 (t, 3H), 2.98 (q, 2H), 7.29-7.34 (m, 1H), 7.48-7.53 (m, 2H), 7.61 (d, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 9.99 (s, 1H), 11.31 (br. s, 1H)。

40

【0340】

4 - アミノ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - オール (II-02) の調製

【化 5 3】



10

【0341】

12.3 g (42.1 mmol) の [5-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチル を 300 mL のジクロロメタンに溶解させ、 -78°C まで冷却し、150 mL のジクロロメタンの中の 42.2 g (168 mmol) の三臭化ホウ素をその温度で滴下して加える。その混合物を一晩室温とし、次いで、400 mL の炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その混合物を、毎回 100 mL のジクロロメタンで 3 回抽出する。溶媒を留去し、その残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製する。

【0342】

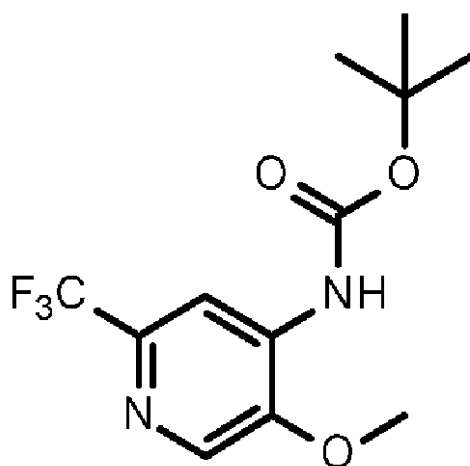
20

(^1H NMR (90 MHz, $\text{D}_6\text{-DMSO}$) δ ppm: 7.00 (s, 1H), 7.9 (s, 1H)。

【0343】

[5-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルの調製

【化 5 4】



30

40

【0344】

9.80 g (44.3 mmol) の 5-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)イソニコチン酸を 980 mL の tert-ブタノールに溶解させた溶液に、室温で、65 g の 4 Å モレキュラーシーブ、14.6 g (53.1 mmol) のジフェニルホスホリルアジド (DPPA) 及び 5.37 g (53.1 mmol) のトリエチルアミンを添加する。その反応混合物を 81°C で 23 時間攪拌し、次いで、4 Å モレキュラーシーブを濾過する。tert-ブタノールを減圧下で留去した後、その残渣を 500 mL の酢酸エチルと混合させ、250 mL の 2 N 塩酸、250 mL の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、250 mL の

50

水及び250 mLの塩化ナトリウム溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで脱水する。溶媒を減圧下で除去し、その残渣を、毎回15 mLの酢酸エチルで3回洗浄し、減圧下で乾燥させる。その酢酸エチル相をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン／EtOAc 4：1→2：1）で精製する。

【0345】

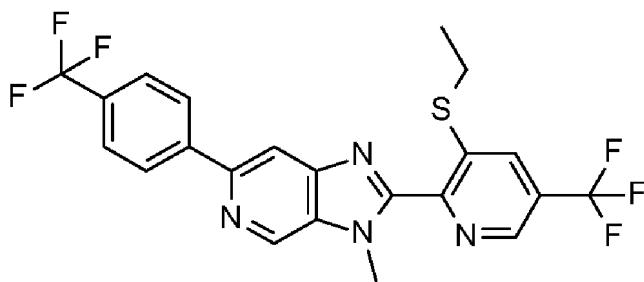
(¹H NMR (90 MHz, CDCl₃) δ ppm: 1.5 (s, 9H), 4.0 (s, 3H), 8.2 (s, 1H), 8.5 (s, 1H)。

【0346】

2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-[4-(トリフルオロメチル)-フェニル]イミダゾ[4,5-c]ピリジン (I-64) の調製

10

【化55】



20

【0347】

62 mg (0.58 mmol)の炭酸ナトリウムを1,2-ジメトキシエタンと水の(4：1)混合物2 mLに溶解させた溶液を、超音波浴の中で脱ガスし、73 mg (0.19 mmol)の6-クロロ-2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチルイミダゾ[4,5-c]ピリジン及び67 mg (0.35 mmol)の[4-(トリフルオロメチル)フェニル]ボロン酸を添加する。その容器にアルゴンを満たし、次いで、23 mg (20 μmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムを添加する。その混合物を、CEM Discoverマイクロ波オーブンの中で2時間10分間140℃に加熱し、次いで、追加の68 mg (59 μmol)のテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウムと混合させ、4時間140℃に加熱する。その反応混合物をセライト層で濾過し、酢酸エチルですすぎ洗う。溶媒を減圧下で除去した後、その残渣をシリカゲル上でのMPLC（勾配：酢酸エチル／シクロヘキサン）によってクロマトグラフ的に分離させる。その後、分取HPLC（勾配：H₂O／アセトニトリル）を用いた別のクロマトグラフ的分離を行う。このようにして、14 mg（純度99%、収率15%）の2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]イミダゾ[4,5-c]ピリジンが得られる。

30

【0348】

(log P (中性): 3.95; MH⁺: 483; ¹H NMR (400 MHz, D₆-DMSO) δ ppm: 9.275 (2.6); 9.271 (2.5); 8.943 (4.3); 8.584 (2.6); 8.580 (2.6); 8.318 (0.5); 7.701 (3.0); 7.680 (3.9); 7.548 (3.8); 7.527 (3.0); 7.410 (4.6); 3.890 (16.0); 3.329 (75.4); 3.140 (1.3); 3.122 (4.2); 3.104 (4.3); 3.086 (1.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.507 (140.3); 2.502 (179.9); 2.498 (134.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.281 (4.6); 1.263 (9.7); 1.245 (4.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6);

40

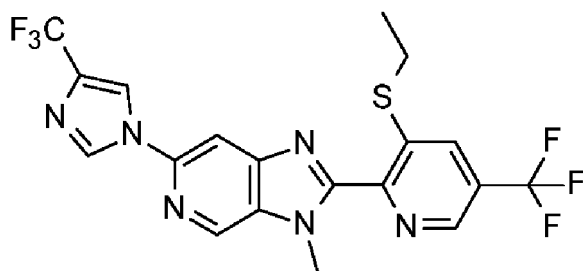
50

0.000 (84.0) ; -0.150 (0.4)。

【0349】

2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-[4-(トリフルオロメチル)-イミダゾール-1-イル]イミダゾ[4,5-c]ピリジン(I-74)の調製

【化56】



10

【0350】

アルゴン下、99mg (0.27mmol)の6-クロロ-2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチルイミダゾ[4,5-c]ピリジン、23μL (0.15mmol)のトランス-N,N'-ジメチルシクロヘキサン-1,2-ジアミン、6.8mg (36μmol)のヨウ化銅(I)、30mg (0.22mmol)の4-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾール及び64mg (0.46mmol)の炭酸カリウムを、脱ガスした1mLのトルエンに添加する。その容器を密閉し、そして、その反応混合物を、CEM Discoverマイクロ波反応器の中で4時間110℃に加熱する。室温まで冷却した後、酢酸エチルを添加し、その混合物をセライト層で濾過し、次いで、酢酸エチルですすぎ洗う。溶媒を減圧下で除去し、その残渣を、シリカゲル上でのMPLC(勾配：酢酸エチル/シクロヘキサン)によってクロマトグラフ的に分離させる。このようにして、22mg(純度100%、収率18%)の2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-[4-(トリフルオロメチル)イミダゾール-1-イル]イミダゾ[4,5-c]ピリジンが得られる。

20

30

【0351】

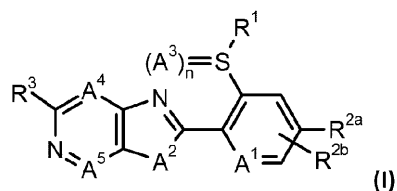
(log P(中性): 3.36; MH⁺: 473; ¹H NMR (600MHz, CD₃CN) δ ppm: 8.905 (3.0); 8.903 (3.0); 8.852 (1.6); 8.850 (1.6); 8.500 (1.9); 8.313 (1.5); 8.311 (2.1); 8.309 (1.4); 8.183 (1.7); 8.181 (1.7); 7.962 (3.4); 7.961 (3.4); 4.001 (16.0); 3.940 (0.4); 3.124 (1.1); 3.111 (3.4); 3.099 (3.5); 3.087 (1.2); 2.639 (0.7); 2.184 (55.7); 2.109 (1.2); 2.005 (2.2); 1.998 (195.7); 1.989 (2.7); 1.985 (1.8); 1.981 (10.0); 1.977 (18.2); 1.973 (26.5); 1.969 (18.0); 1.965 (9.0); 1.882 (1.2); 1.419 (0.4); 1.404 (0.7); 1.373 (0.6); 1.330 (4.1); 1.318 (9.0); 1.309 (1.6); 1.305 (5.2); 1.301 (3.4); 0.914 (0.6)。

40

【0352】

上記実施例と同様にして、及び、上記で記載した調製方法に準じて、式(I)で表される下記化合物を得ることができる。

【表 1】



式中、 A^3 は酸素であり、及び、その他の置換基は、それぞれ、下記表の中で定義されているとおりである：

Ex.	R^1	N	A^4	A^5	R^3	A^2	A^1	R^{2a}	R^{2b}
I-1	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-2	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-3	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-4	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	F	H
I-5	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	CF ₃	H
I-6	CH ₃	0	N	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-7	-(CH ₂) ₂ -SO ₂ -C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-8	i-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-9	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-10	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-11	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-12	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	F	H
I-13	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-14	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	3	H
I-15	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-16	i-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-17	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-18	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-19	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-20	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	F	H
I-21	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-22	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-23	-(CH ₂) ₂ -S-C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-24	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-25	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-26	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-27	オキセタン-3-イル	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	H
I-28	C ₂ H ₅	0	N	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-29	CF ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-30	CH ₃	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	CF ₃	H
I-31	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-32	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-33	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	H
I-34	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	Cl	H
I-35	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H

Ex.	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-36	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-37	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-38	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	5-Cl*
I-39	n-C ₃ H ₇	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-40	オキセタン-3-イル	0	CH	CH	CF ₃	O	CH	H	H
I-41	i-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-42	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-43	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-44	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	Cl	H
I-45	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-46	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-47	C ₂ H ₅	0	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	CF ₃	H
I-48	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-49	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-NHCOMe*
I-50	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-NHCOMe*
I-51	C ₂ H ₅	1	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-52	C ₂ H ₅	2	CH	CH	Cl	N-メチル	N	CF ₃	H
I-53	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-54	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-55	C ₂ H ₅	0	CH	CH	Cl	N-メチル	N	CF ₃	H
I-56	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CONH ₂	H
I-57	CH ₂ -CH ₂ F	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-58	CH ₂ -CH ₂ OH	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-59	CH ₂ -CH ₂ OH	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CF ₃	H
I-60	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CONH ₂	H
I-61	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-62	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	CH	H	3-Cl*
I-63	C ₂ H ₅	1	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	CF ₃	H

10

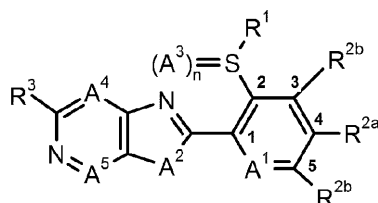
20

30

40

Ex.	R ¹	N	A ⁴	A ⁵	R ³	A ²	A ¹	R ^{2a}	R ^{2b}
I-64	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-CF ₃ (C ₆ H ₄)	N-メチル	N	CF ₃	H
I-65	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃) ^{ヒラ} ソール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-66	n-C ₃ H ₇	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-67	CH ₃	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-68	C ₂ H ₅	2	CH	CH	C ₂ F ₅	N-メチル	N	H	H
I-69	C ₂ H ₅	0	CH	CH	3-(CF ₃) ^{ヒラ} ソール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-70	C ₂ H ₅	0	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	3-CF ₃ *
I-71	n-C ₃ H ₇	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-72	C ₂ H ₅	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	CN	H
I-73	CH ₃	2	CH	CH	CF ₃	N-メチル	N	H	5-OMe*
I-74	C ₂ H ₅	0	CH	CH	4-(CF ₃) ^{イミタ} ソール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-75	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃) ^{イミタ} ソール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-76	C ₂ H ₅	2	CH	CH	4-(CF ₃) ^{ヒラ} ソール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H
I-77	C ₂ H ₅	2	CH	CH	3-(CF ₃) ^{ヒラ} ソール-1-イル	N-メチル	N	CF ₃	H

* これらの実施例において、R^{2b}は、3位又は5位で結合している：



【0353】

log P値は、「EEC Directive 79/831 Annex V. A8」に従い、逆相カラム（C18）でのHPLC（高性能液体クロマトグラフィー）によって測定する。温度：55℃。

【0354】

酸性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル（0.1%ギ酸含有）を使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH2.7で実施する。表中では、log P（HCOOH）と称されている。

【0355】

中性範囲内におけるLC-MSの測定は、溶離液として0.001モル炭酸水素アンモニウム水溶液及びアセトニトリルを使用し、10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配で、pH7.8で実施する。表中では、log P（中性）と称されている。

【0356】

較正は、 $\log P$ 値が知られている非分枝鎖アルカン-2-オン（3個～16個の炭素原子を有している）を用いて実施する（ $\log P$ 値は、連続する2種類のアルカノンの間の線形補間によって、保持時間に基づいて測定する）。

【0357】

選択された実施例に関するNMRデータは、慣習的な形態（ δ 値、多重項分裂、水素原子の数）で記載されているか、又は、NMRピークリストとして記載されている。

【0358】

その中でNMRスペクトルを記録した溶媒は、いずれの場合にも記載されている。

【0359】

NMRピークリスト法

選択された実施例の ^1H NMRデータは、 ^1H NMRピークリストの形態で記載されている。各シグナルピークに対して、最初に δ 値（ppm）が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関する δ 値-シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

【0360】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

δ_1 （強度 $_1$ ）； δ_2 （強度 $_2$ ）；...； δ_i （強度 $_i$ ）；...； δ_n （強度 $_n$ ）。

【0361】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ（cm）と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0362】

^1H NMRスペクトルの化学シフトを較正するために、テトラメチルシランを使用するか、及び／又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0363】

^1H NMRピークのリストは、従来の ^1H NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0364】

さらに、それらは、従来の ^1H NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明の対象の一部分を形成する）のシグナル及び／又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【0365】

溶媒及び／又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 ^1H NMRピークの本発明者らによるリストは、通常、溶媒のピーク、例えば、DMSO- d_6 中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【0366】

目標化合物の立体異性体のピーク及び／又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物（例えば、90%を超える純度を有する目標化合物）のピークよりも低い強度を有している。

【0367】

そのような立体異性体及び／又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副産物の指紋（by-product fingerprints）」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【0368】

目標化合物のピークを既知方法（Mestrelab C、ACDシミュレーション、さらに、

10

20

30

40

50

経験的に評価された期待値の使用)で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、 ^1H NMRの慣習的な解釈における関連するピークのピーキングに類似しているであろう。

【0369】

^1H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

【表 2】

Ex.	LOGP_ 中性	LOGP_ HCOOH	
I-1	3.77	3.86	実施例 1: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.544 (6.4); 8.335 (3.9); 8.314 (4.1); 7.568 (2.9); 7.563 (3.5); 7.534 (2.5); 7.529 (1.9); 7.513 (2.3); 7.508 (1.9); 3.323 (17.6); 2.671 (0.3); 2.631 (16.0); 2.524 (1.1); 2.511 (19.3); 2.507 (38.0); 2.502 (49.6); 2.498 (35.5); 2.493 (16.9); 2.075 (0.5); 0.008 (0.9); 0.000 (21.7); -0.008 (0.7)
I-2	3.48	3.52	実施例 2: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.283 (3.7); 8.960 (2.3); 8.958 (2.3); 8.334 (2.7); 8.328 (4.1); 4.030 (16.0); 3.323 (69.7); 3.181 (1.1); 3.162 (3.6); 3.144 (3.6); 3.126 (1.1); 2.891 (1.2); 2.731 (1.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.506 (64.4); 2.502 (83.6); 2.498 (61.3); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 1.234 (4.1); 1.215 (8.1); 1.197 (3.8); 0.008 (0.6); 0.000 (17.0); -0.008 (0.7)
I-3	3.16	3.22	実施例 3: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.290 (4.0); 8.947 (2.7); 8.316 (4.5); 8.267 (2.9); 7.953 (0.4); 4.059 (16.0); 4.019 (0.7); 3.327 (63.2); 3.036 (0.3); 2.965 (0.4); 2.892 (2.5); 2.882 (0.5); 2.870 (0.5); 2.732 (2.2); 2.673 (0.5); 2.580 (15.1); 2.507 (59.9); 2.503 (71.6); 2.499 (52.5); 2.330 (0.5); 2.078 (0.4); 1.234 (0.4); 0.000 (0.4)
I-4	2.65	2.70	実施例 4: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.833 (0.3); 9.210 (3.9); 8.226 (4.1); 8.082 (0.6); 7.993 (0.5); 7.608 (1.3); 7.593 (1.5); 7.587 (1.6); 7.572 (1.4); 7.411 (1.3); 7.405 (1.4); 7.386 (1.4); 7.380 (1.4); 7.244 (1.0); 7.238 (0.9); 7.222 (1.6); 7.216 (1.5); 7.201 (0.8); 7.195 (0.7); 3.785 (16.0); 3.325 (80.3); 2.875 (1.0); 2.863 (1.0); 2.671 (0.7); 2.667 (0.6); 2.506 (76.1); 2.502 (99.5); 2.498 (78.2); 2.464 (2.7); 2.329 (0.6); 2.075 (0.3); 0.000 (2.6)
I-5	3.26	3.30	実施例 5: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.249 (3.5); 8.267 (3.7); 7.787 (1.2); 7.778 (2.7); 7.768 (2.9); 7.749 (2.1); 7.729 (0.7); 3.807 (16.0); 3.324 (21.7); 2.671 (0.4); 2.557 (15.5); 2.524 (1.1); 2.511 (22.7); 2.507 (44.4); 2.502 (57.4); 2.498 (41.7); 2.493 (20.4); 2.329 (0.4); 0.008 (2.1); 0.000 (52.3); -0.009 (2.1)
I-6	2.74	2.75	実施例 6: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.182 (3.5); 7.526 (1.9); 7.523 (2.0); 7.459 (1.7); 7.445 (2.7); 7.403 (1.7); 7.400 (1.6); 7.390 (1.1); 7.386 (1.0); 3.927 (0.3); 3.770 (16.0); 2.978 (0.3); 2.494 (14.5); 2.222 (0.5); 2.152 (1.6); 1.966 (0.6); 1.958 (1.5); 1.954 (1.8); 1.950 (9.9); 1.946 (17.5); 1.942 (25.9); 1.938 (17.6); 1.934 (8.7); 1.387 (5.1); 1.269 (0.3); 1.212 (0.4); 0.005 (0.3); 0.000 (11.9); -0.006 (0.4)
I-7	2.67	2.72	実施例 7: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.411 (2.3); 9.408 (2.3); 9.379 (3.9); 9.333 (0.4); 8.751 (2.4); 8.746 (2.5); 8.460 (4.1); 8.316 (0.5); 7.903 (0.3); 4.391 (16.0); 4.199 (1.2); 4.147 (0.5); 4.138 (0.4); 4.121 (0.8); 4.114 (0.6); 4.107 (0.7); 4.100 (0.7); 4.088 (0.7); 4.068 (0.4); 3.976 (0.7); 3.854 (0.6); 3.843 (0.6); 3.833 (0.7); 3.829 (0.7); 3.819 (0.8); 3.803 (0.5); 3.795 (0.6); 3.556 (0.6); 3.543 (0.8); 3.531 (0.5); 3.523 (0.6); 3.518 (0.8); 3.510 (0.9); 3.494 (1.8); 3.477 (0.8); 3.468 (0.8); 3.464 (0.6); 3.455 (0.5); 3.443 (0.6); 3.429 (0.4); 3.325 (63.6); 3.260 (0.8); 3.257 (0.8); 3.241 (2.2); 3.238 (2.3); 3.223 (2.3); 3.219 (2.3); 3.201 (0.9); 2.676 (0.5); 2.671 (0.7); 2.667 (0.6); 2.524 (1.8); 2.511 (41.0); 2.506 (84.3); 2.502 (113.7); 2.498 (86.8); 2.493 (45.8); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 1.252 (4.4); 1.233 (9.5); 1.214 (4.3); 0.146 (0.4); 0.008 (2.7); 0.000 (79.8); -0.008 (4.6); -0.150 (0.4)
I-8	3.46	3.54	実施例 8: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.390 (2.1); 9.387 (2.1); 9.377 (3.6); 8.577 (2.1); 8.572 (2.2); 8.379 (3.7); 8.316 (0.6); 4.384 (16.0); 4.362 (0.4); 3.802 (0.3); 3.785 (0.9); 3.767 (1.3); 3.750 (0.9); 3.733 (0.4); 3.322 (86.4); 2.675 (1.0); 2.671 (1.4); 2.666 (1.0); 2.524 (3.7); 2.511 (79.1); 2.506 (160.9); 2.502 (213.1); 2.497 (155.9); 2.493 (76.9); 2.333 (1.0); 2.329 (1.4); 2.324 (1.0); 1.569 (6.3); 1.551 (6.2); 0.906 (6.4); 0.889 (6.3);

10

20

30

40

			0.146 (1.3); 0.008 (10.0); 0.000 (280.2); -0.008 (11.2); -0.150 (1.3)
I-9	3.64	3.66	实施例 9: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.544 (9.2); 8.314 (2.7); 8.311 (2.8); 8.294 (2.9); 8.291 (2.8); 7.739 (1.1); 7.735 (1.2); 7.719 (2.5); 7.715 (2.1); 7.701 (2.2); 7.697 (2.1); 7.646 (3.6); 7.627 (2.2); 7.464 (1.9); 7.462 (1.8); 7.444 (3.0); 7.426 (1.6); 7.424 (1.5); 3.322 (31.6); 3.155 (1.9); 3.136 (6.3); 3.118 (6.4); 3.100 (2.0); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.541 (0.6); 2.524 (2.7); 2.511 (49.3); 2.507 (97.6); 2.502 (126.8); 2.497 (89.7); 2.493 (42.1); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.324 (0.6); 2.075 (0.3); 1.360 (7.3); 1.341 (16.0); 1.323 (7.0); 0.146 (0.3); 0.008 (3.4); 0.000 (84.9); -0.009 (2.9); -0.150 (0.3)
I-10	2.08	2.15	实施例 10: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.271 (3.7); 8.267 (3.9); 8.137 (2.9); 8.132 (3.0); 7.975 (2.1); 7.954 (3.6); 7.900 (2.2); 7.895 (2.1); 7.880 (1.3); 7.874 (1.3); 6.870 (0.3); 3.977 (15.9); 3.748 (0.9); 3.444 (0.8); 3.327 (95.2); 2.967 (16.0); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.525 (1.4); 2.507 (54.5); 2.502 (70.2); 2.498 (50.6); 2.494 (24.6); 2.333 (0.3); 2.329 (0.4); 2.184 (0.5); 1.355 (3.8); 1.298 (0.9); 1.259 (1.2); 1.234 (0.6); 0.008 (2.1); 0.000 (54.1); -0.009 (2.3)
I-11	2.34	2.39	实施例 11: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.279 (0.6); 9.262 (3.9); 8.380 (0.5); 8.317 (0.5); 8.260 (4.2); 8.164 (2.8); 8.159 (3.4); 8.152 (0.5); 8.115 (1.7); 8.110 (1.5); 8.095 (2.1); 8.089 (1.9); 7.937 (3.4); 7.917 (3.0); 7.902 (0.8); 7.897 (0.9); 7.885 (0.5); 7.565 (0.4); 7.545 (0.6); 5.757 (1.6); 3.770 (0.5); 3.747 (16.0); 3.621 (0.4); 3.592 (1.6); 3.445 (15.1); 3.436 (2.1); 3.327 (141.8); 2.675 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.524 (4.2); 2.506 (141.2); 2.502 (182.5); 2.498 (131.5); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.324 (0.8); 1.298 (0.8); 1.259 (1.1); 1.235 (0.5); 1.166 (0.3); 0.008 (2.3); 0.000 (56.4); -0.008 (2.3)
I-12	1.83	1.88	实施例 12: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.272 (4.2); 8.266 (4.5); 8.036 (1.3); 8.023 (1.4); 8.015 (1.6); 8.002 (1.5); 7.966 (1.4); 7.959 (1.6); 7.944 (1.5); 7.937 (1.5); 7.706 (0.8); 7.699 (0.8); 7.685 (1.5); 7.678 (1.5); 7.664 (0.8); 7.657 (0.7); 3.973 (16.0); 3.336 (80.5); 2.958 (16.0); 2.678 (0.4); 2.549 (0.3); 2.509 (67.3); 2.337 (0.4)
I-13	2.34	2.44	实施例 13: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.285 (3.9); 8.280 (4.2); 8.088 (2.3); 8.066 (4.9); 8.060 (3.8); 8.009 (2.3); 8.004 (2.0); 7.988 (1.4); 7.983 (1.3); 3.973 (16.0); 3.327 (56.5); 3.313 (1.6); 3.294 (1.2); 3.279 (1.2); 3.261 (1.1); 3.242 (0.3); 2.905 (1.1); 2.886 (1.2); 2.871 (1.0); 2.853 (1.0); 2.671 (0.4); 2.507 (41.3); 2.502 (56.0); 2.498 (43.9); 2.329 (0.4); 1.150 (3.8); 1.132 (8.2); 1.113 (3.7); 0.000 (2.5)
I-14	2.63	2.67	实施例 14: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.289 (3.7); 8.430 (1.3); 8.412 (5.2); 8.288 (3.9); 8.287 (3.9); 8.180 (1.6); 8.159 (1.4); 3.772 (16.0); 3.493 (14.4); 3.324 (34.4); 2.524 (0.9); 2.511 (17.9); 2.506 (36.4); 2.502 (48.8); 2.497 (36.6); 2.493 (18.8); 0.008 (1.9); 0.000 (52.6); -0.008 (2.6)
I-15	1.92	1.95	实施例 15: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.295 (3.5); 9.139 (1.7); 9.135 (1.9); 9.127 (1.9); 9.123 (1.8); 8.579 (1.7); 8.575 (1.8); 8.559 (1.9); 8.555 (1.8); 8.300 (3.6); 8.298 (3.7); 8.021 (1.9); 8.009 (1.8); 8.001 (1.7); 7.989 (1.7); 3.867 (16.0); 3.794 (1.0); 3.775 (3.5); 3.757 (3.5); 3.738 (1.0); 3.327 (10.2); 2.526 (0.5); 2.521 (0.7); 2.512 (10.8); 2.508 (22.2); 2.503 (29.5); 2.499 (21.4); 2.494 (10.4); 1.209 (3.6); 1.191 (7.9); 1.172 (3.5); 0.008 (1.8); 0.000 (50.2); -0.009 (1.9)
I-16	3.21	3.26	实施例 16: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.588 (2.0); 9.585 (2.1); 9.314 (3.5); 8.780 (2.2); 8.776 (2.2); 8.331 (3.7); 8.316 (0.4); 4.409 (0.3); 4.392 (1.0); 4.375 (1.4); 4.357 (1.0); 4.340 (0.3); 3.914 (16.0); 3.322 (36.9); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.524 (2.0); 2.520 (3.2); 2.511 (42.6); 2.507 (88.2); 2.502 (118.2); 2.497 (86.9); 2.493 (42.9); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 1.260 (13.3); 1.243 (13.2); 0.146 (0.8); 0.008 (6.7); 0.000 (191.2); -0.009 (7.6); -0.150 (0.8)

10

20

30

40

I-17	2.87	2.94	实施例 17: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.204 (3.8); 8.228 (4.1); 7.627 (3.7); 7.618 (4.2); 7.536 (1.5); 7.517 (2.1); 7.433 (0.9); 7.422 (1.2); 7.413 (1.2); 7.403 (1.1); 7.392 (0.6); 3.768 (16.0); 3.327 (67.1); 2.986 (1.3); 2.968 (4.1); 2.950 (4.1); 2.931 (1.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.507 (57.2); 2.503 (74.4); 2.498 (54.2); 2.334 (0.3); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 1.180 (4.3); 1.161 (8.7); 1.143 (4.1); 0.146 (0.5); 0.008 (3.9); 0.000 (88.8); -0.007 (3.9); -0.150 (0.5)
I-18	2.11	2.13	实施例 18: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.255 (3.5); 8.253 (3.7); 8.251 (3.6); 8.156 (1.3); 8.153 (1.3); 8.138 (1.8); 8.134 (1.6); 8.020 (0.4); 8.017 (0.5); 8.002 (1.4); 7.998 (1.4); 7.984 (1.6); 7.979 (1.5); 7.976 (1.4); 7.971 (1.6); 7.957 (1.5); 7.953 (1.5); 7.938 (0.6); 7.934 (0.5); 7.878 (1.7); 7.875 (1.8); 7.860 (1.2); 7.857 (1.2); 3.728 (16.0); 3.526 (0.5); 3.509 (1.3); 3.490 (1.3); 3.473 (0.5); 3.330 (61.8); 2.671 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (25.5); 2.507 (50.6); 2.502 (65.3); 2.498 (46.3); 2.493 (21.9); 2.329 (0.4); 1.119 (3.5); 1.101 (7.8); 1.082 (3.4); 0.008 (0.6); 0.000 (15.4); -0.009 (0.6)
I-19	3.38	3.43	实施例 19: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.226 (3.9); 8.243 (4.1); 7.705 (0.9); 7.699 (1.3); 7.684 (1.6); 7.678 (2.9); 7.667 (3.6); 7.662 (2.3); 7.640 (3.4); 7.619 (1.8); 3.788 (16.0); 3.323 (25.4); 2.999 (1.2); 2.981 (4.0); 2.963 (4.1); 2.944 (1.3); 2.671 (0.4); 2.626 (0.3); 2.507 (47.1); 2.502 (61.4); 2.498 (45.8); 2.329 (0.4); 2.300 (0.5); 1.177 (4.3); 1.159 (8.9); 1.140 (4.1); 0.008 (1.9); 0.000 (45.5)
I-20	2.05	2.08	实施例 20: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.258 (4.1); 8.253 (4.3); 7.997 (1.5); 7.990 (2.5); 7.976 (2.4); 7.969 (3.3); 7.956 (1.7); 7.918 (1.1); 7.911 (0.9); 7.897 (1.6); 7.890 (1.4); 7.876 (0.7); 7.869 (0.6); 3.739 (16.0); 3.430 (15.0); 3.326 (81.6); 2.671 (0.7); 2.666 (0.6); 2.506 (84.7); 2.502 (108.3); 2.498 (84.4); 2.328 (0.7); 2.325 (0.5); 0.146 (0.6); 0.000 (128.1); -0.150 (0.6)
I-21	2.93	2.98	实施例 21: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.586 (2.4); 9.583 (2.5); 9.317 (4.1); 8.798 (2.5); 8.794 (2.6); 8.341 (4.3); 3.925 (16.0); 3.912 (1.3); 3.893 (3.6); 3.874 (3.7); 3.856 (1.1); 3.324 (30.3); 2.671 (0.5); 2.506 (56.1); 2.502 (72.8); 2.498 (55.3); 2.329 (0.5); 1.258 (3.8); 1.239 (8.2); 1.221 (3.7); 0.146 (0.4); 0.007 (3.2); 0.000 (79.6); -0.150 (0.4)
I-22	1.87	1.90	实施例 22: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.261 (3.9); 8.261 (4.1); 8.107 (1.6); 8.087 (2.0); 7.942 (0.8); 7.940 (1.0); 7.921 (1.7); 7.904 (2.1); 7.901 (2.4); 7.885 (2.2); 7.820 (1.2); 7.818 (1.3); 7.801 (1.6); 7.799 (1.6); 7.783 (0.6); 7.780 (0.7); 5.757 (1.1); 3.946 (16.0); 3.728 (0.5); 3.328 (59.2); 3.305 (1.0); 3.286 (1.1); 3.272 (1.1); 3.253 (1.1); 2.885 (1.1); 2.867 (1.2); 2.852 (1.0); 2.833 (1.0); 2.672 (0.3); 2.507 (37.2); 2.502 (48.9); 2.498 (35.7); 1.149 (3.9); 1.130 (8.2); 1.112 (3.7); 1.102 (0.4); 0.007 (1.5); 0.000 (35.2); -0.008 (1.5)
I-23	3.96	4.02	实施例 23: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.288 (4.1); 8.977 (2.7); 8.456 (2.7); 8.327 (4.3); 8.317 (0.4); 4.033 (16.0); 3.395 (2.0); 3.377 (2.7); 3.357 (2.4); 3.327 (77.5); 2.720 (2.3); 2.701 (2.8); 2.682 (2.2); 2.672 (0.7); 2.579 (1.5); 2.560 (4.6); 2.542 (4.9); 2.523 (3.2); 2.507 (65.1); 2.502 (87.7); 2.498 (70.2); 2.329 (0.6); 2.075 (0.9); 1.233 (0.6); 1.152 (4.7); 1.133 (9.3); 1.115 (4.4); 0.000 (3.7)
I-24	2.32	2.39	实施例 24: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.241 (3.7); 8.588 (1.6); 8.585 (1.8); 8.577 (1.7); 8.574 (1.8); 8.279 (3.8); 8.090 (1.5); 8.087 (1.6); 8.069 (1.7); 8.066 (1.8); 7.638 (1.6); 7.627 (1.6); 7.618 (1.5); 7.606 (1.5); 3.975 (16.0); 3.324 (34.0); 3.041 (1.1); 3.022 (3.7); 3.004 (3.8); 2.986 (1.2); 2.672 (0.3); 2.525 (0.8); 2.507 (40.5); 2.503 (55.3); 2.498 (43.4); 2.329 (0.4); 1.218 (4.0); 1.199 (8.3); 1.181 (3.9); 0.008 (1.5); 0.000 (45.1)
I-25	2.97	3.08	实施例 25: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.217 (3.6); 8.235 (3.9); 7.564 (2.9); 7.560 (3.0); 7.555 (3.0); 7.544 (3.5); 7.460 (2.0); 7.455 (1.8); 7.440 (1.4); 7.435 (1.3); 3.791 (16.0); 3.323 (28.6); 2.671

10

20

30

40

			(0.3); 2.506 (48.4); 2.502 (56.6); 2.498 (37.8); 2.329 (0.4); 1.398 (0.8); 0.008 (2.5); 0.000 (64.5); -0.008 (2.5)	
I-26	2.76	2.81	実施例 26: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.389 (2.0); 9.386 (2.0); 9.366 (3.5); 8.849 (2.2); 8.845 (2.1); 8.370 (3.7); 6.870 (0.5); 5.756 (0.4); 4.452 (0.5); 4.347 (15.7); 4.018 (0.6); 3.995 (0.4); 3.326 (80.4); 3.151 (16.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.2); 2.511 (28.7); 2.507 (56.3); 2.502 (72.6); 2.498 (52.3); 2.494 (25.3); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.3); 2.183 (0.8); 1.355 (5.8); 1.233 (0.6); 0.008 (1.2); 0.000 (33.6); -0.009 (1.3)	
I-27	1.84	1.87	実施例 27: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.253 (3.5); 8.275 (3.8); 8.273 (3.7); 8.257 (1.5); 8.254 (1.4); 8.237 (1.8); 8.234 (1.7); 8.038 (0.5); 8.035 (0.6); 8.020 (1.5); 8.016 (1.6); 8.001 (1.5); 7.998 (1.3); 7.984 (1.2); 7.980 (1.4); 7.965 (1.6); 7.961 (1.7); 7.946 (0.7); 7.942 (0.6); 7.903 (0.9); 7.895 (2.1); 7.892 (2.0); 7.877 (1.4); 7.873 (1.3); 7.567 (0.4); 7.547 (0.6); 5.756 (8.2); 5.231 (0.7); 5.226 (0.6); 5.216 (0.5); 5.211 (1.3); 5.205 (0.5); 5.196 (0.7); 5.190 (0.8); 5.175 (0.4); 4.802 (2.1); 4.783 (4.1); 4.763 (2.6); 4.673 (2.9); 4.657 (3.1); 4.639 (2.0); 3.746 (16.0); 3.732 (0.5); 3.602 (0.5); 3.594 (0.5); 3.325 (51.0); 2.676 (0.3); 2.671 (0.4); 2.524 (1.2); 2.511 (26.7); 2.507 (53.3); 2.502 (69.4); 2.498 (49.5); 2.493 (23.4); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 1.760 (0.5); 1.236 (0.7); 1.190 (0.3); 0.000 (2.3)	10
I-28	3.22	3.29	実施例 28: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.561 (4.9); 8.983 (2.2); 8.362 (2.2); 8.359 (2.2); 4.075 (16.0); 4.032 (0.3); 4.022 (0.4); 3.323 (56.4); 3.202 (1.1); 3.184 (3.5); 3.165 (3.5); 3.147 (1.1); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.511 (33.1); 2.507 (65.1); 2.502 (84.7); 2.498 (61.6); 2.494 (30.1); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 1.355 (0.7); 1.252 (4.0); 1.233 (8.3); 1.215 (3.7); 0.008 (2.6); 0.000 (63.4); -0.008 (2.5)	20
I-29	2.93	3.04	実施例 29: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.302 (3.5); 8.962 (1.6); 8.959 (1.8); 8.951 (1.8); 8.947 (1.8); 8.457 (1.3); 8.437 (1.4); 8.334 (3.7); 7.856 (1.7); 7.845 (1.7); 7.836 (1.6); 7.824 (1.6); 4.092 (16.0); 3.329 (37.7); 2.526 (0.6); 2.512 (14.7); 2.508 (30.1); 2.504 (40.6); 2.499 (31.1); 2.495 (16.5); 0.000 (1.9)	
I-30	2.36	2.41	実施例 30: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.307 (3.8); 8.443 (2.9); 8.305 (4.0); 8.190 (6.5); 4.008 (15.9); 3.327 (62.6); 2.995 (16.0); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.511 (28.7); 2.507 (57.0); 2.502 (75.3); 2.498 (56.9); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 0.000 (3.6)	
I-31	3.86	3.94	実施例 31: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.283 (3.4); 8.955 (2.1); 8.952 (2.1); 8.347 (2.1); 8.343 (2.2); 8.334 (3.8); 4.021 (16.0); 3.324 (17.5); 3.137 (2.1); 3.119 (3.6); 3.101 (2.2); 2.892 (1.6); 2.732 (1.3); 2.672 (0.4); 2.525 (0.7); 2.512 (20.3); 2.507 (42.4); 2.503 (57.6); 2.498 (43.7); 2.494 (22.9); 2.329 (0.4); 1.607 (1.2); 1.588 (2.4); 1.570 (2.5); 1.552 (1.4); 0.961 (4.2); 0.943 (8.6); 0.924 (3.8); 0.008 (1.3); 0.000 (42.0); -0.009 (2.2)	30
I-32	3.32	3.37	実施例 32: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.580 (2.3); 9.577 (2.3); 9.316 (3.9); 8.796 (2.4); 8.792 (2.4); 8.350 (4.1); 7.903 (0.5); 7.898 (0.5); 7.547 (0.5); 5.756 (2.2); 3.923 (16.0); 3.898 (2.3); 3.883 (1.8); 3.878 (2.4); 3.873 (1.8); 3.859 (2.3); 3.775 (0.8); 3.323 (27.3); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.0); 2.511 (25.7); 2.507 (52.2); 2.502 (69.6); 2.498 (51.6); 2.493 (26.0); 2.329 (0.4); 2.324 (0.3); 1.737 (1.1); 1.718 (1.9); 1.699 (2.0); 1.680 (1.2); 1.013 (4.1); 1.002 (0.9); 0.995 (8.4); 0.976 (3.8); 0.000 (9.4); -0.008 (0.4)	
I-33	2.11	2.12	実施例 33: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.315 (3.7); 8.969 (1.6); 8.966 (1.8); 8.958 (1.8); 8.954 (1.7); 8.556 (1.6); 8.552 (1.7); 8.536 (1.8); 8.532 (1.7); 8.319 (4.0); 7.938 (1.7); 7.926 (1.6); 7.918 (1.6); 7.906 (1.5); 4.318 (16.0); 3.552 (0.9); 3.533 (1.0); 3.519 (1.1); 3.500 (1.1); 3.481 (0.3); 3.324 (25.2); 3.031 (1.1); 3.012 (1.2); 2.998 (1.0); 2.979 (1.0); 2.507 (37.9); 2.503 (49.7); 2.499 (37.5); 1.303 (3.8); 1.285 (8.0); 1.266 (3.7); 0.000	40

			(5.3)	
I-34	4.41	4.38	实施例 34: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.332 (3.7); 8.517 (4.3); 8.515 (4.4); 8.272 (3.7); 8.251 (3.9); 7.627 (0.5); 7.623 (0.6); 7.614 (0.4); 7.597 (0.5); 7.575 (0.4); 7.566 (0.4); 7.556 (0.4); 7.542 (2.9); 7.538 (3.4); 7.509 (2.4); 7.504 (1.7); 7.488 (2.1); 7.483 (1.8); 3.321 (35.3); 2.680 (0.4); 2.675 (0.9); 2.671 (1.2); 2.666 (0.8); 2.662 (0.4); 2.610 (16.0); 2.524 (3.5); 2.511 (65.6); 2.506 (129.9); 2.502 (168.9); 2.497 (120.0); 2.493 (56.5); 2.337 (0.4); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.324 (0.8); 2.320 (0.4); 1.355 (1.2); 1.328 (0.4); 1.207 (0.3); 1.189 (0.7); 1.168 (2.5); 1.160 (2.3); 1.145 (0.4); 1.058 (0.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000 (97.2); -0.009 (3.2); -0.150 (0.4)	
I-35	4.07	4.03	实施例 35: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.334 (5.6); 8.540 (6.8); 8.538 (6.7); 8.234 (2.7); 8.231 (2.8); 8.214 (3.0); 8.211 (2.8); 7.693 (1.0); 7.690 (1.0); 7.673 (2.6); 7.669 (2.1); 7.655 (2.3); 7.651 (2.2); 7.621 (3.9); 7.602 (2.0); 7.440 (1.8); 7.437 (1.8); 7.420 (3.0); 7.402 (1.5); 7.399 (1.4); 3.323 (126.5); 3.130 (2.0); 3.112 (6.6); 3.093 (6.7); 3.075 (2.1); 2.680 (0.5); 2.675 (1.1); 2.671 (1.5); 2.666 (1.1); 2.662 (0.5); 2.524 (4.8); 2.511 (84.8); 2.506 (166.1); 2.502 (215.2); 2.497 (153.7); 2.493 (72.9); 2.333 (1.0); 2.329 (1.4); 2.324 (1.0); 1.333 (7.5); 1.315 (16.0); 1.297 (7.2); 0.008 (1.0); 0.000 (28.0); - 0.009 (0.9)	10
I-36	2.64	2.67	实施例 36: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.577 (2.7); 9.575 (2.7); 9.320 (4.2); 8.825 (2.8); 8.822 (2.8); 8.347 (4.5); 7.902 (0.7); 7.897 (0.7); 7.886 (0.4); 7.566 (0.3); 7.546 (0.5); 5.757 (1.3); 4.018 (1.1); 3.934 (16.0); 3.700 (15.4); 3.325 (73.6); 2.671 (0.7); 2.506 (74.4); 2.502 (95.9); 2.498 (76.5); 2.328 (0.6); 1.258 (0.3); 1.236 (1.0); 1.169 (0.8); 0.000 (2.4)	20
I-37	3.10	3.17	实施例 37: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.392 (2.2); 9.388 (2.3); 9.369 (3.8); 8.726 (2.3); 8.721 (2.4); 8.385 (3.9); 8.316 (0.5); 4.362 (16.0); 3.627 (0.9); 3.608 (1.1); 3.594 (1.1); 3.575 (1.0); 3.324 (136.2); 3.117 (1.0); 3.098 (1.2); 3.084 (1.0); 3.065 (0.9); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.9); 2.507 (127.4); 2.502 (169.6); 2.498 (129.7); 2.333 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.9); 1.330 (3.8); 1.312 (8.1); 1.293 (3.6); 0.146 (0.9); 0.008 (7.7); 0.000 (196.4); -0.150 (0.9)	
I-38	2.63	2.68	实施例 38: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.273 (3.9); 8.266 (4.2); 8.141 (2.4); 8.120 (3.8); 8.105 (2.9); 8.100 (3.4); 8.055 (2.4); 8.049 (2.0); 8.033 (1.5); 8.028 (1.3); 7.904 (0.8); 7.899 (0.7); 7.894 (0.5); 7.887 (0.5); 7.697 (0.3); 7.568 (0.5); 7.548 (0.8); 7.528 (0.3); 3.763 (16.0); 3.530 (0.6); 3.513 (1.3); 3.495 (1.4); 3.476 (0.6); 3.357 (0.5); 3.328 (61.7); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.3); 2.507 (57.0); 2.502 (75.7); 2.498 (56.3); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 2.325 (0.3); 1.125 (3.8); 1.107 (8.1); 1.088 (3.6); 0.000 (0.6)	30
I-39	3.45	3.52	实施例 39: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.386 (2.2); 9.383 (2.3); 9.374 (3.8); 8.774 (2.3); 8.769 (2.3); 8.316 (0.4); 8.302 (3.8); 5.756 (0.4); 4.362 (16.0); 3.637 (0.5); 3.616 (0.9); 3.605 (0.6); 3.596 (0.6); 3.585 (1.0); 3.564 (0.6); 3.322 (68.3); 2.993 (0.6); 2.981 (0.7); 2.973 (0.7); 2.961 (1.1); 2.949 (0.7); 2.941 (0.7); 2.928 (0.6); 2.676 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.511 (49.6); 2.506 (97.4); 2.502 (127.7); 2.497 (95.5); 2.493 (49.9); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.324 (0.6); 2.029 (0.5); 2.010 (0.7); 1.994 (0.8); 1.975 (0.7); 1.956 (0.4); 1.804 (0.4); 1.789 (0.6); 1.783 (0.5); 1.770 (0.6); 1.757 (0.4); 1.754 (0.4); 1.146 (3.8); 1.128 (8.0); 1.109 (3.6); 0.146 (0.8); 0.008 (8.1); 0.000 (174.8); -0.008 (10.0); -0.150 (0.8)	
I-40	3.10	3.15	实施例 40: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.347 (4.8); 8.561 (5.7); 8.293 (2.2); 8.291 (2.3); 8.274 (2.4); 8.271 (2.3); 7.668 (1.0); 7.665 (1.1); 7.647 (2.2); 7.630 (1.4); 7.627 (1.3); 7.480 (1.7); 7.460 (2.8); 7.442 (1.3); 7.179 (2.9); 7.159 (2.6); 6.870 (1.5); 6.647 (0.8); 5.165 (3.3); 5.147 (6.3); 5.130 (3.6); 4.804 (0.5); 4.788 (1.2); 4.771 (1.9); 4.755 (1.2); 4.738 (0.4); 4.512 (3.8); 4.496 (6.3); 4.480 (3.3); 3.328 (53.8); 2.672 (0.6); 2.507 (73.4);	40

			2.503 (93.5); 2.499 (70.8); 2.330 (0.6); 2.183 (2.4); 1.355 (16.0); 1.233 (0.9); 1.182 (0.6); 0.008 (3.2); 0.000 (57.9)
I-41	3.73	3.80	実施例 41: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.277 (3.9); 8.989 (2.5); 8.456 (2.5); 8.453 (2.5); 8.345 (0.3); 8.333 (4.2); 7.954 (0.5); 4.021 (0.4); 4.003 (1.1); 3.988 (16.0); 3.949 (0.4); 3.932 (1.0); 3.916 (1.4); 3.899 (1.1); 3.883 (0.4); 3.325 (35.1); 2.892 (3.7); 2.732 (3.3); 2.672 (0.3); 2.507 (40.5); 2.503 (53.7); 2.499 (41.6); 2.330 (0.4); 1.235 (14.8); 1.219 (14.7); 0.008 (1.4); 0.000 (30.8)
I-42	3.39	3.46	実施例 I-42: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.881 (0.4); 9.213 (3.4); 8.238 (3.6); 8.236 (3.6); 8.136 (0.4); 8.085 (0.7); 7.683 (0.3); 7.639 (2.8); 7.634 (2.9); 7.572 (2.4); 7.552 (3.7); 7.504 (0.5); 7.499 (0.5); 7.483 (2.1); 7.478 (2.0); 7.462 (1.4); 7.457 (1.3); 6.870 (0.4); 3.779 (16.0); 3.618 (0.4); 3.608 (0.3); 3.602 (1.0); 3.585 (0.4); 3.325 (20.2); 3.098 (0.6); 3.067 (1.2); 3.048 (3.9); 3.030 (4.0); 3.016 (0.9); 3.012 (1.3); 2.877 (1.1); 2.865 (1.1); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.4); 2.520 (2.1); 2.511 (30.1); 2.507 (61.5); 2.502 (81.2); 2.498 (58.8); 2.493 (28.4); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.183 (0.7); 1.776 (0.4); 1.769 (0.4); 1.760 (1.2); 1.752 (0.4); 1.744 (0.4); 1.355 (5.3); 1.245 (0.8); 1.236 (0.4); 1.226 (1.7); 1.218 (0.5); 1.208 (0.8); 1.193 (4.1); 1.175 (8.7); 1.156 (3.9); 0.146 (0.4); 0.008 (2.9); 0.000 (88.8); -0.009 (3.1); -0.150 (0.4)
I-43	2.61	2.69	実施例 I-43: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.259 (3.8); 8.259 (4.0); 8.123 (6.1); 8.118 (3.1); 8.107 (2.5); 8.102 (1.5); 7.945 (2.9); 7.939 (0.8); 7.929 (0.7); 7.923 (2.3); 5.757 (11.4); 3.742 (16.0); 3.600 (0.7); 3.581 (2.2); 3.563 (2.2); 3.545 (0.7); 3.329 (38.9); 2.671 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (23.7); 2.507 (48.0); 2.502 (63.6); 2.498 (47.5); 2.494 (24.1); 2.329 (0.4); 1.146 (3.7); 1.128 (8.2); 1.109 (3.6); 0.008 (0.3); 0.000 (9.3); -0.008 (0.4)
I-44	2.36	2.45	実施例 I-44: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.270 (3.8); 8.317 (0.5); 8.273 (4.1); 8.022 (2.9); 8.016 (3.1); 7.986 (2.2); 7.966 (3.6); 7.905 (2.1); 7.899 (1.9); 7.884 (1.3); 7.879 (1.2); 3.969 (16.0); 3.377 (1.0); 3.359 (1.3); 3.344 (1.9); 3.329 (150.3); 3.307 (0.6); 2.945 (1.1); 2.927 (1.2); 2.912 (1.0); 2.893 (0.9); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.524 (3.1); 2.507 (141.2); 2.502 (185.0); 2.498 (135.5); 2.333 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.179 (3.8); 1.160 (8.2); 1.142 (3.7); 0.008 (2.3); 0.000 (70.9); -0.009 (2.6); -0.150 (0.3)
I-45		2.53	実施例 I-45: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.295 (3.9); 8.364 (3.2); 8.342 (3.4); 8.292 (4.1); 7.347 (3.4); 7.325 (3.3); 4.015 (1.0); 3.987 (16.0); 3.922 (15.6); 3.910 (1.3); 3.733 (1.0); 3.714 (3.4); 3.695 (3.4); 3.677 (1.0); 3.506 (0.3); 3.331 (66.6); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (58.9); 2.503 (75.4); 2.498 (56.9); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 2.087 (2.0); 1.234 (0.8); 1.203 (3.6); 1.185 (7.9); 1.166 (3.5); 0.008 (2.1); 0.000 (43.3)
I-46	2.92	2.98	実施例 I-46: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.269 (4.1); 8.592 (1.8); 8.590 (1.9); 8.581 (1.9); 8.578 (1.8); 8.306 (4.3); 8.094 (1.7); 8.092 (1.7); 8.074 (1.9); 8.071 (1.8); 7.955 (0.8); 7.642 (1.6); 7.631 (1.6); 7.622 (1.5); 7.610 (1.5); 3.979 (16.0); 3.334 (9.6); 3.046 (1.2); 3.027 (3.8); 3.009 (3.9); 2.991 (1.3); 2.893 (4.9); 2.734 (4.4); 2.509 (22.7); 2.505 (28.6); 2.501 (21.4); 1.220 (4.2); 1.202 (8.6); 1.184 (4.1); 0.000 (4.6)
I-47	4.02	4.10	実施例 I-47: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.308 (3.5); 8.964 (2.1); 8.961 (2.1); 8.355 (3.9); 8.353 (3.9); 8.341 (2.2); 8.338 (2.2); 8.317 (0.3); 4.030 (16.0); 3.328 (183.2); 3.184 (1.1); 3.165 (3.5); 3.147 (3.6); 3.129 (1.1); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.8); 2.525 (2.5); 2.520 (3.8); 2.511 (53.3); 2.507 (109.8); 2.502 (147.2); 2.498 (110.1); 2.494 (55.4); 2.334 (0.7); 2.329 (1.0); 2.325 (0.7); 1.235 (4.2); 1.217 (8.3); 1.198 (3.8); 0.146 (1.1); 0.008 (8.0); 0.000 (229.8); -0.009 (9.5); -0.150 (1.1)
I-48	2.64	2.70	実施例 I-48: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.337 (2.2); 9.324 (2.3); 9.295 (4.0); 8.366 (2.9); 8.353 (2.8); 8.273 (4.3); 5.757 (0.8); 3.919 (16.0); 3.894 (0.7); 3.879 (1.3); 3.862 (1.3); 3.327 (92.4); 2.676

10

20

30

40

			(0.6); 2.671 (0.8); 2.667 (0.6); 2.507 (88.5); 2.502 (113.9); 2.498 (86.6); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 2.325 (0.6); 1.243 (3.6); 1.224 (7.4); 1.206 (3.4); 0.146 (0.6); 0.008 (6.3); 0.000 (128.4); -0.150 (0.6)
I-49	1.99	2.05	実施例 I-49: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11.328 (3.1); 9.295 (4.3); 8.532 (1.7); 8.509 (4.8); 8.487 (4.4); 8.465 (1.5); 8.318 (0.6); 8.304 (4.7); 3.876 (16.0); 3.847 (0.7); 3.658 (1.1); 3.639 (3.5); 3.621 (3.5); 3.602 (1.1); 3.331 (78.4); 2.892 (0.3); 2.676 (1.0); 2.672 (1.3); 2.668 (1.0); 2.565 (0.4); 2.507 (157.3); 2.503 (200.0); 2.498 (150.8); 2.344 (0.8); 2.334 (1.0); 2.329 (1.4); 2.169 (15.8); 1.989 (1.1); 1.234 (0.5); 1.184 (3.8); 1.175 (1.3); 1.166 (8.3); 1.148 (3.7); 0.008 (0.9); 0.000 (19.7)
I-50	2.27	2.39	実施例 I-50: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10.770 (2.6); 9.256 (3.9); 8.290 (1.9); 8.277 (4.3); 8.268 (2.5); 8.242 (0.7); 8.115 (3.0); 8.093 (2.4); 8.063 (0.4); 4.456 (1.9); 4.038 (0.6); 4.020 (0.7); 3.979 (16.0); 3.332 (83.1); 2.966 (1.2); 2.948 (4.0); 2.929 (4.1); 2.911 (1.3); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (62.3); 2.503 (81.2); 2.498 (61.4); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 2.184 (1.9); 2.119 (15.2); 1.989 (2.6); 1.193 (0.7); 1.172 (4.5); 1.154 (9.1); 1.135 (4.2); 0.008 (2.6); 0.000 (55.6); -0.008 (3.1)
I-51		2.48	実施例 I-51: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.259 (4.5); 9.210 (2.4); 9.198 (2.5); 8.278 (4.7); 8.276 (4.8); 8.226 (3.2); 8.214 (3.1); 5.757 (2.5); 3.965 (0.7); 3.946 (0.8); 3.932 (0.8); 3.920 (0.7); 3.914 (0.8); 3.795 (16.0); 3.375 (0.6); 3.356 (0.8); 3.328 (59.8); 3.305 (0.3); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.2); 2.511 (27.2); 2.507 (56.1); 2.502 (75.0); 2.498 (55.5); 2.494 (27.5); 2.334 (0.4); 2.329 (0.5); 2.325 (0.4); 1.264 (3.7); 1.245 (7.9); 1.227 (3.8); 0.008 (1.2); 0.000 (39.0); -0.008 (1.4)
I-52	2.51	2.61	実施例 I-52: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.321 (2.5); 8.780 (3.9); 8.736 (2.6); 7.746 (3.8); 3.824 (1.3); 3.809 (16.0); 3.799 (3.9); 3.787 (1.3); 2.141 (2.3); 1.965 (10.4); 1.957 (0.4); 1.944 (3.9); 1.940 (5.2); 1.937 (3.8); 1.933 (2.0); 1.297 (3.8); 1.285 (7.6); 1.273 (3.7); 0.000 (3.3)
I-53		3.12	実施例 I-53: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.242 (3.5); 8.270 (3.7); 8.119 (0.4); 8.064 (2.9); 8.042 (3.1); 7.123 (3.3); 7.101 (3.1); 4.012 (16.0); 3.959 (0.4); 3.909 (1.6); 3.899 (16.0); 3.332 (95.1); 2.942 (1.2); 2.923 (3.9); 2.905 (3.9); 2.887 (1.3); 2.677 (0.4); 2.672 (0.6); 2.668 (0.4); 2.525 (1.6); 2.511 (32.5); 2.507 (64.4); 2.503 (84.3); 2.499 (63.2); 2.334 (0.4); 2.330 (0.6); 2.325 (0.4); 1.990 (0.8); 1.175 (0.5); 1.144 (4.1); 1.126 (8.6); 1.107 (4.0); 0.008 (2.3); 0.000 (60.3); -0.008 (3.0)
I-54	3.07	3.16	実施例 I-54: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.293 (3.9); 8.987 (2.7); 8.490 (2.7); 8.335 (4.1); 5.757 (0.6); 4.713 (1.2); 4.699 (2.4); 4.685 (1.2); 4.595 (1.1); 4.581 (2.3); 4.567 (1.3); 4.041 (16.0); 3.581 (1.1); 3.567 (2.2); 3.553 (1.1); 3.521 (1.2); 3.507 (2.2); 3.493 (1.1); 3.327 (105.4); 2.671 (0.8); 2.506 (88.1); 2.502 (120.1); 2.498 (96.8); 2.333 (0.6); 2.329 (0.8); 1.234 (0.4); 0.146 (0.4); 0.008 (2.7); 0.000 (84.4); -0.150 (0.4)
I-55	3.01	3.12	実施例 I-55: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.956 (3.9); 8.953 (4.0); 8.942 (2.0); 8.940 (2.0); 8.317 (2.1); 7.904 (3.7); 7.902 (3.7); 3.950 (16.0); 3.332 (109.0); 3.172 (1.0); 3.154 (3.3); 3.135 (3.4); 3.117 (1.0); 2.676 (0.3); 2.672 (0.5); 2.667 (0.4); 2.525 (1.2); 2.520 (1.8); 2.512 (26.2); 2.507 (53.9); 2.503 (71.3); 2.498 (52.0); 2.494 (25.3); 2.334 (0.3); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.251 (0.5); 1.232 (5.1); 1.214 (7.9); 1.195 (3.5); 1.103 (0.3); 0.000 (6.1)
I-56	1.56	1.61	実施例 I-56: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.502 (3.9); 9.497 (3.4); 9.306 (4.1); 8.900 (4.0); 8.895 (3.4); 8.645 (1.9); 8.322 (4.5); 8.057 (1.9); 3.892 (16.0); 3.843 (1.3); 3.825 (3.8); 3.806 (3.7); 3.788 (1.1); 3.332 (180.7); 2.676 (0.9); 2.672 (1.1); 2.667 (0.8); 2.507 (135.9); 2.503 (156.6); 2.498 (111.5); 2.334 (0.9); 2.330 (1.0); 2.325 (0.7); 1.298 (0.5); 1.259 (1.0); 1.235 (5.5); 1.217 (8.5); 1.198 (3.8); 0.000 (14.4); -0.062 (0.6)
I-57	2.82	2.89	実施例 I-57: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO):

10

20

30

40

			δ = 9.596 (2.3); 9.593 (2.2); 9.330 (3.8); 9.320 (0.5); 8.830 (2.3); 8.826 (2.2); 8.353 (4.1); 4.994 (1.0); 4.982 (1.5); 4.969 (1.1); 4.877 (1.0); 4.865 (1.5); 4.852 (1.2); 4.493 (1.1); 4.480 (1.5); 4.468 (1.0); 4.427 (1.2); 4.414 (1.5); 4.402 (1.0); 3.957 (16.0); 3.947 (1.6); 3.919 (0.4); 3.813 (0.3); 3.328 (182.7); 2.676 (0.7); 2.671 (1.0); 2.667 (0.7); 2.663 (0.4); 2.524 (3.6); 2.511 (61.5); 2.507 (120.1); 2.502 (156.5); 2.498 (114.9); 2.493 (57.0); 2.333 (0.7); 2.329 (1.0); 2.325 (0.7); 2.074 (0.5); 1.235 (0.6); 0.008 (2.3); 0.000 (63.1); -0.008 (2.5)
I-58		2.19	实施例 I-58: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.553 (2.2); 9.550 (2.2); 9.320 (3.9); 8.786 (2.4); 8.781 (2.4); 8.336 (4.1); 5.755 (1.0); 5.119 (1.2); 5.106 (2.9); 5.093 (1.3); 4.066 (1.6); 4.052 (3.3); 4.038 (2.1); 3.919 (16.0); 3.869 (1.1); 3.855 (2.7); 3.842 (2.5); 3.828 (0.9); 3.400 (0.4); 3.393 (0.4); 3.384 (0.5); 3.345 (268.1); 3.309 (0.6); 2.672 (0.4); 2.526 (1.1); 2.512 (22.7); 2.508 (46.1); 2.503 (61.2); 2.499 (45.2); 2.494 (22.6); 2.330 (0.4); 0.000 (0.6)
I-59	2.31	2.41	实施例 I-59: ¹ H-NMR (600.1 MHz, CD ₃ CN): δ = 9.085 (2.6); 8.843 (1.4); 8.842 (1.6); 8.840 (1.5); 8.333 (1.7); 8.331 (1.6); 8.165 (2.9); 5.447 (1.4); 3.979 (16.0); 3.725 (0.9); 3.715 (2.8); 3.705 (2.9); 3.695 (1.0); 3.459 (0.9); 3.449 (1.8); 3.439 (0.8); 3.177 (2.4); 3.167 (4.3); 3.157 (2.2); 2.145 (5.7); 1.957 (0.5); 1.953 (0.6); 1.949 (3.0); 1.945 (5.2); 1.941 (7.5); 1.937 (5.0); 1.933 (2.5)
I-60	1.76	1.77	实施例 I-60: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.262 (4.0); 8.968 (3.2); 8.963 (3.3); 8.415 (1.6); 8.354 (3.0); 8.350 (3.1); 8.303 (4.3); 7.862 (1.6); 4.008 (16.0); 3.331 (33.2); 3.113 (1.1); 3.095 (3.7); 3.076 (3.8); 3.058 (1.2); 2.508 (35.4); 2.504 (46.2); 2.499 (34.8); 1.246 (4.0); 1.228 (8.5); 1.209 (3.9); 0.008 (1.7); 0.000 (46.1); -0.008 (2.2)
I-61	2.63	2.71	实施例 I-61: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.343 (3.7); 8.973 (1.6); 8.969 (1.8); 8.961 (1.8); 8.957 (1.8); 8.559 (1.6); 8.555 (1.7); 8.539 (1.8); 8.535 (1.8); 8.347 (4.0); 8.345 (4.0); 7.941 (1.7); 7.929 (1.6); 7.921 (1.6); 7.909 (1.6); 4.320 (16.0); 3.561 (1.0); 3.542 (1.0); 3.528 (1.1); 3.509 (1.1); 3.490 (0.3); 3.330 (33.2); 3.048 (1.1); 3.030 (1.2); 3.015 (1.0); 2.997 (1.0); 2.677 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.525 (1.3); 2.507 (56.6); 2.503 (75.2); 2.499 (56.4); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 1.301 (3.8); 1.282 (8.2); 1.264 (3.7); 0.146 (0.5); 0.008 (4.0); 0.000 (110.8); -0.008 (5.6); -0.150 (0.5)
I-62	2.15	2.17	实施例 I-62: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.207 (3.4); 8.318 (0.5); 8.194 (3.7); 8.192 (3.6); 8.062 (1.6); 8.059 (1.7); 8.042 (2.2); 8.039 (2.2); 7.947 (1.8); 7.928 (2.7); 7.908 (1.6); 7.735 (2.0); 7.732 (2.1); 7.716 (1.8); 7.713 (1.7); 3.742 (16.0); 3.593 (1.0); 3.574 (3.5); 3.556 (3.6); 3.537 (1.2); 3.329 (74.8); 2.676 (0.7); 2.671 (0.9); 2.667 (0.7); 2.662 (0.4); 2.525 (2.4); 2.520 (3.6); 2.511 (50.5); 2.507 (105.6); 2.502 (140.5); 2.498 (101.4); 2.493 (48.8); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.324 (0.6); 2.086 (0.7); 1.235 (1.3); 1.184 (4.0); 1.166 (9.0); 1.147 (3.9); 1.140 (0.6); 0.146 (0.7); 0.008 (5.0); 0.000 (161.5); -0.009 (5.9); -0.150 (0.7)
I-63	3.62	3.75	实施例 I-63: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.396 (5.6); 8.728 (2.2); 8.723 (2.3); 8.416 (4.1); 8.414 (3.9); 8.318 (0.5); 4.362 (16.0); 3.635 (0.9); 3.617 (1.0); 3.602 (1.1); 3.583 (1.0); 3.332 (165.3); 3.134 (1.0); 3.116 (1.2); 3.101 (1.0); 3.083 (1.0); 2.676 (0.8); 2.672 (1.1); 2.667 (0.8); 2.525 (2.6); 2.511 (62.1); 2.507 (126.3); 2.503 (165.5); 2.498 (121.7); 2.494 (60.8); 2.334 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.8); 1.327 (3.7); 1.308 (8.1); 1.290 (3.6); 0.146 (0.4); 0.008 (3.1); 0.000 (96.0); -0.008 (4.1); -0.150 (0.4)
I-64	3.95	3.93	实施例 I-64: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.275 (2.6); 9.271 (2.5); 8.943 (4.3); 8.584 (2.6); 8.580 (2.6); 8.318 (0.5); 7.701 (3.0); 7.680 (3.9); 7.548 (3.8); 7.527 (3.0); 7.410 (4.6); 3.890 (16.0); 3.329 (75.4); 3.140 (1.3); 3.122 (4.2); 3.104 (4.3); 3.086 (1.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.507 (140.3); 2.502 (179.9); 2.498 (134.5); 2.334 (0.9); 2.329 (1.2); 2.325 (0.9); 1.281 (4.6); 1.263 (9.7); 1.245 (4.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.6); 0.000

10

20

30

40

			(84.0); -0.150 (0.4)
I-65	4.31	4.37	实施例 I-65: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.217 (3.1); 9.076 (4.1); 9.074 (4.1); 8.959 (2.3); 8.956 (2.3); 8.334 (2.3); 8.318 (1.7); 8.288 (3.7); 8.211 (4.1); 8.209 (4.1); 5.758 (1.1); 4.005 (16.0); 3.328 (226.4); 3.189 (1.1); 3.171 (3.5); 3.153 (3.6); 3.134 (1.1); 2.676 (2.7); 2.671 (3.8); 2.667 (2.8); 2.525 (9.3); 2.520 (14.6); 2.511 (211.4); 2.507 (434.4); 2.502 (573.8); 2.498 (421.2); 2.493 (209.9); 2.333 (2.7); 2.329 (3.7); 2.324 (2.8); 1.258 (0.3); 1.243 (4.1); 1.225 (8.8); 1.206 (3.9); 1.148 (0.3); 0.146 (1.3); 0.008 (9.7); 0.000 (308.8); -0.008 (13.1); -0.150 (1.4)
I-66	3.42	3.50	实施例 I-66: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.243 (3.5); 8.317 (0.4); 8.274 (3.7); 8.069 (2.9); 8.047 (3.1); 7.116 (3.3); 7.094 (3.2); 4.017 (0.4); 4.000 (16.0); 3.893 (15.8); 3.329 (74.5); 2.884 (2.3); 2.867 (3.7); 2.848 (2.4); 2.676 (0.7); 2.671 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.3); 2.511 (50.8); 2.507 (105.0); 2.502 (139.6); 2.498 (102.9); 2.494 (51.4); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.496 (1.2); 1.478 (2.4); 1.460 (2.5); 1.442 (1.4); 0.875 (4.2); 0.857 (8.4); 0.838 (3.7); 0.008 (0.8); 0.000 (28.2); -0.008 (1.2)
I-67	2.70	2.75	实施例 I-67: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 10.028 (0.5); 9.850 (0.4); 9.268 (0.7); 9.248 (3.0); 8.317 (1.0); 8.302 (0.7); 8.262 (3.1); 8.236 (0.6); 8.194 (0.5); 8.119 (1.3); 8.097 (0.7); 8.026 (2.6); 8.004 (2.6); 7.996 (0.5); 7.978 (0.6); 7.181 (0.8); 7.159 (0.6); 7.133 (2.8); 7.111 (2.7); 4.442 (2.5); 4.071 (13.8); 4.017 (3.3); 4.014 (3.6); 3.959 (1.9); 3.910 (16.0); 3.329 (346.6); 2.881 (1.4); 2.869 (1.4); 2.676 (1.7); 2.671 (2.3); 2.667 (1.7); 2.525 (5.8); 2.511 (128.4); 2.507 (263.1); 2.502 (348.1); 2.498 (256.2); 2.494 (127.6); 2.422 (14.2); 2.334 (1.7); 2.329 (2.3); 2.325 (1.7); 1.989 (0.9); 1.234 (0.3); 1.175 (0.5); 0.146 (0.4); 0.008 (3.2); 0.000 (99.9); -0.008 (3.8); -0.150 (0.5)
I-68	2.46	2.50	实施例 I-68: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.319 (4.1); 9.142 (1.6); 9.139 (1.9); 9.130 (1.8); 9.126 (1.9); 8.582 (1.6); 8.578 (1.8); 8.562 (1.9); 8.558 (1.9); 8.328 (4.3); 8.024 (1.7); 8.012 (1.7); 8.003 (1.6); 7.991 (1.6); 3.870 (16.0); 3.802 (1.0); 3.783 (3.5); 3.765 (3.6); 3.746 (1.1); 3.333 (44.0); 2.676 (0.3); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (56.6); 2.503 (74.8); 2.499 (56.9); 2.330 (0.5); 1.209 (3.7); 1.191 (8.1); 1.172 (3.6); 0.008 (1.1); 0.000 (28.7)
I-69	4.32	4.37	实施例 I-69: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.080 (4.3); 9.078 (4.2); 8.959 (2.4); 8.956 (2.4); 8.873 (1.8); 8.871 (2.0); 8.867 (2.1); 8.865 (1.8); 8.337 (2.4); 8.334 (2.4); 8.181 (4.2); 8.180 (4.2); 7.062 (2.5); 7.056 (2.5); 4.007 (16.0); 3.330 (22.5); 3.189 (1.1); 3.170 (3.7); 3.152 (3.7); 3.133 (1.2); 2.677 (0.3); 2.672 (0.5); 2.668 (0.3); 2.526 (1.2); 2.512 (26.3); 2.508 (53.3); 2.503 (70.1); 2.499 (51.8); 2.495 (26.3); 2.330 (0.4); 2.326 (0.3); 2.077 (0.6); 1.244 (4.0); 1.225 (8.7); 1.207 (3.9); 0.008 (1.3); 0.000 (37.3); -0.008 (1.8)
I-70	3.24	3.29	实施例 I-70: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.272 (4.0); 9.057 (2.0); 9.044 (2.1); 8.309 (4.2); 8.135 (2.8); 8.122 (2.7); 4.021 (0.4); 3.846 (16.0); 3.328 (22.9); 2.736 (1.1); 2.717 (3.4); 2.699 (3.5); 2.680 (1.3); 2.507 (37.7); 2.503 (49.4); 2.499 (37.9); 1.990 (1.3); 1.397 (1.1); 1.193 (0.3); 1.176 (0.7); 1.158 (0.4); 0.985 (4.0); 0.966 (8.1); 0.948 (3.8); 0.008 (1.7); 0.000 (44.7); -0.008 (2.1)
I-71		2.93	实施例 I-71: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.293 (4.1); 8.368 (3.1); 8.345 (3.3); 8.299 (4.3); 7.342 (3.4); 7.320 (3.2); 5.758 (0.9); 4.017 (0.4); 3.985 (16.0); 3.918 (15.5); 3.716 (2.2); 3.701 (1.9); 3.696 (2.5); 3.692 (1.8); 3.677 (2.2); 3.330 (25.0); 2.676 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.507 (54.4); 2.503 (69.4); 2.499 (51.7); 2.330 (0.5); 2.326 (0.3); 1.668 (1.1); 1.649 (2.0); 1.630 (2.0); 1.611 (1.2); 1.235 (0.7); 0.993 (4.1); 0.974 (8.2); 0.956 (3.7); 0.000 (2.4)
I-72	2.26	2.32	实施例 I-72: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ = 9.581 (3.0); 9.576 (3.0); 9.312 (4.1); 9.070 (3.3); 9.065 (3.2); 8.716 (1.0); 8.704 (0.9); 8.335 (4.3); 8.091 (0.4); 7.660 (0.6); 7.645 (0.8); 7.641 (0.7); 7.626

10

20

30

40

			(0.6); 3.916 (16.0); 3.872 (1.3); 3.854 (3.8); 3.835 (3.9); 3.817 (1.4); 3.736 (0.6); 3.694 (0.7); 3.626 (0.8); 3.613 (0.8); 2.671 (1.0); 2.506 (105.6); 2.502 (135.4); 2.498 (103.6); 2.333 (0.7); 2.329 (0.9); 1.989 (0.7); 1.298 (0.6); 1.252 (4.0); 1.234 (9.7); 1.215 (3.9); 1.193 (0.3); 1.175 (0.5); 0.000 (3.0)
I-73	2.20	2.25	実施例 I-73: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.297 (3.6); 9.268 (0.9); 9.255 (0.6); 9.208 (0.4); 8.404 (3.2); 8.382 (3.4); 8.317 (0.4); 8.298 (3.9); 8.238 (0.6); 8.119 (0.8); 8.106 (0.4); 8.097 (0.9); 8.084 (0.4); 8.024 (0.5); 8.022 (0.5); 7.996 (0.4); 7.975 (0.4); 7.352 (3.6); 7.330 (3.5); 7.181 (0.8); 7.159 (0.8); 7.087 (0.4); 7.069 (0.4); 7.067 (0.4); 5.758 (2.8); 4.564 (1.5); 4.442 (3.0); 4.115 (0.7); 4.015 (4.7); 3.988 (16.0); 3.931 (15.4); 3.909 (3.9); 3.568 (0.8); 3.544 (14.4); 3.331 (131.8); 2.676 (0.7); 2.672 (0.9); 2.667 (0.7); 2.525 (2.7); 2.511 (52.5); 2.507 (106.0); 2.503 (139.4); 2.498 (102.4); 2.494 (51.6); 2.334 (0.6); 2.329 (0.9); 2.325 (0.7); 1.259 (0.5); 1.234 (1.5); 0.000 (5.6)
I-74	3.36	3.49	実施例 I-74: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 8.905 (3.0); 8.903 (3.0); 8.852 (1.6); 8.850 (1.6); 8.500 (1.9); 8.313 (1.5); 8.311 (2.1); 8.309 (1.4); 8.183 (1.7); 8.181 (1.7); 7.962 (3.4); 7.961 (3.4); 4.001 (16.0); 3.940 (0.4); 3.124 (1.1); 3.111 (3.4); 3.099 (3.5); 3.087 (1.2); 2.639 (0.7); 2.184 (55.7); 2.109 (1.2); 2.005 (2.2); 1.998 (195.7); 1.989 (2.7); 1.985 (1.8); 1.981 (10.0); 1.977 (18.2); 1.973 (26.5); 1.969 (18.0); 1.965 (9.0); 1.882 (1.2); 1.419 (0.4); 1.404 (0.7); 1.373 (0.6); 1.330 (4.1); 1.318 (9.0); 1.309 (1.6); 1.305 (5.2); 1.301 (3.4); 0.914 (0.6)
I-75	2.84	2.94	実施例 I-75: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.582 (2.6); 9.107 (4.5); 8.797 (2.6); 8.794 (2.8); 8.761 (3.5); 8.668 (2.9); 8.361 (4.6); 8.314 (0.3); 5.754 (2.9); 3.939 (1.0); 3.920 (3.5); 3.897 (16.0); 3.883 (1.4); 3.316 (65.0); 2.675 (0.8); 2.671 (1.1); 2.666 (0.9); 2.506 (121.1); 2.502 (165.0); 2.497 (131.6); 2.333 (0.7); 2.328 (1.1); 2.324 (0.9); 1.988 (0.8); 1.272 (3.7); 1.253 (8.2); 1.235 (4.5); 1.175 (0.4); 0.146 (0.5); 0.008 (3.6); 0.000 (102.8); -0.150 (0.5)
I-76	3.73	3.84	実施例 I-76: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.334 (1.1); 9.333 (1.2); 9.331 (1.2); 9.329 (1.1); 9.015 (1.4); 9.014 (1.7); 8.867 (2.5); 8.865 (2.3); 8.751 (1.2); 8.750 (1.3); 8.747 (1.3); 8.287 (2.6); 8.286 (2.3); 8.036 (1.9); 5.446 (0.6); 3.879 (0.9); 3.867 (16.0); 3.855 (3.0); 3.842 (0.9); 2.129 (16.5); 1.964 (0.3); 1.955 (0.9); 1.951 (1.2); 1.947 (9.5); 1.943 (17.4); 1.939 (24.5); 1.935 (16.4); 1.931 (8.6); 1.313 (3.1); 1.300 (6.6); 1.288 (3.1); 1.270 (0.6); 0.005 (0.6); 0.000 (19.1); -0.006 (0.7)
I-77	3.81	3.90	実施例 I-77: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN): δ= 9.333 (1.3); 9.332 (1.5); 9.330 (1.5); 8.871 (3.2); 8.869 (3.1); 8.750 (1.6); 8.748 (1.6); 8.736 (1.3); 8.734 (1.4); 8.731 (1.4); 8.730 (1.2); 8.250 (3.0); 8.249 (3.0); 6.869 (1.7); 6.865 (1.7); 5.446 (0.7); 3.884 (1.1); 3.871 (4.7); 3.869 (16.0); 3.859 (3.6); 3.847 (1.1); 2.133 (5.1); 1.956 (0.3); 1.952 (0.4); 1.948 (3.5); 1.944 (6.3); 1.940 (9.0); 1.936 (6.1); 1.932 (3.2); 1.314 (3.5); 1.302 (7.5); 1.290 (3.6); 1.285 (0.4); 1.267 (0.5); 0.000 (5.6)

10

20

30

【0370】

使用実施例

ネコノミ (Ctenocephalides felis) - インビトロ接触試験

試験管にコーティングするために、9 mg の活性成分を、最初に、1 mL のアセトン p . a . に溶解させ、次いで、アセトン p . a . を用いて希釈して所望の濃度とする。オービタルシェーカー上で回転及び振動させる（揺動回転 30 rpm で 2 時間）ことによって 250 μL の該溶液を 25 mL 容試験管の内壁及び底面に均一に分配させる。900 ppm の活性成分溶液及び 44 . 7 cm² の内表面で、均一に分配されたと仮定すれば、5 μg / cm² の面積基準薬量が達成される。

40

【0371】

溶媒を蒸発させた後、該試験管に 5 ~ 10 匹の成体ネコノミ (Ctenocephalides felis) を生息させ、孔が開けられているプラスチック製蓋で密閉し、室温及び周囲湿度で、水平位でインキュベートする。48 時間経過した後、効力を求める。この目的のために、該試験管を垂直に立て、トントンと叩いてネコノミを試験管の底に落とす。試験管の底で動かないままにいるか又は動きがギクシャクとしているネコノミは、

50

死んでいるか又は死にかけていると考えられる。

【0372】

この試験において、ある物質が、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で少なくとも80%の効力を達成すれば、その物質は、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのネコノミが死んだか又は死にかけていることを意味する。0%の効力は、損傷を受けたネコノミが無かったことを意味する。

【0373】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、 $5\mu\text{g}/\text{cm}^2$ の施用量で、100%の効力を示す： I-18、I-21。

【0374】

オウシマダニ (*Boophilus microplus*) - 注入試験 (BOOPMI inj)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLの溶媒と混合させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0375】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (*Boophilus microplus*) の腹部に1μLの該活性成分溶液を注入する。その動物をシャーレの中に移し、人工気象室 (climate-controlled room) の中で維持する。

【0376】

その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室 (climate-controlled cabinet) の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無かったことを意味し；0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

【0377】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20μgの施用量で、80%の効力を示す： I-21。

【0378】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - 経口試験 (CTECFE)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させる。クエン酸塩を添加したウシ血液で希釈して、所望の濃度とする。

【0379】

頂部と底部がガーゼで閉じられているチャンバーの中に、餌を与えていない約20匹の成体ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を入れる。下端部がパラフィルムで閉じられている金属製円筒を該チャンバーの上に配置する。該円筒は、血液/活性成分調製物を含んでおり、これは、パラフィルム膜を通してネコノミによって摂取され得る。

【0380】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのネコノミが死んだことを意味し；0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0381】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、90%効力を示す： I-21。

【0382】

ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) 試験 (LUCICU)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチ

10

20

30

40

50

ルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0383】

約20匹のヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*) のL1幼虫を、馬肉の挽肉及び所望濃度の活性成分調製物を含んでいる被験容器の中に移す。

【0384】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのヒツジキンバエ幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだヒツジキンバエ幼虫が無かったことを意味する。

【0385】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-18、I-21。

10

【0386】

イエバエ (*Musca domestica*) 試験 (MUSCDO)

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性成分の適切な配合物を製造するために、10mgの活性成分を0.5mLのジメチルスルホキシドと混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0387】

砂糖溶液と所望濃度の活性成分配合物で処理されたスポンジを含んでいる容器に、10匹の成体イエバエ (*Musca domestica*) を生息させる。

【0388】

2日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのイエバエが死んだことを意味し；0%は、死んだイエバエが無かったことを意味する。

20

【0389】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、95%の効力を示す： I-21。

【0390】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験 (MYZUPE)

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

30

【0391】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0392】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

40

【0393】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I-10、I-13、I-18、I-22、I-23、I-24、I-43、I-44、I-48、I-52。

【0394】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： I-4、I-12、I-14、I-17、I-18、I-19、I-21、I-38、I-42、I-45、I-46、I-49、I-50、I-51、I-56、I-61、I-68。

【0395】

50

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20 g / ha の施用量で、90 % の効力を示す： I - 39。

【0396】

マスタードビートル (Phaedon cochleariae) - 噴霧試験 (PHA ECO)

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1000 ppm の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

10

【0397】

ハクサイ (Brassica pekinensis) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、マスタードビートル (mustard beetle) (Phaedon cochleariae) の幼虫を寄生させる。

【0398】

7 日間経過した後、効力 (%) を求める。100 % は、全てのマスタードビートル幼虫が死んだことを意味し；0 % は、死んだマスタードビートル幼虫が無かったことを意味する。

20

【0399】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： I - 2、I - 3、I - 4、I - 5、I - 10、I - 12、I - 13、I - 14、I - 18、I - 19、I - 21、I - 22、I - 24、I - 25、I - 26、I - 28、I - 29、I - 31、I - 36、I - 37、I - 38、I - 39、I - 41、I - 42、I - 43、I - 44、I - 45、I - 46、I - 47、I - 48、I - 49、I - 50、I - 51、I - 52、I - 53、I - 54、I - 55、I - 61、I - 68、I - 73。

【0400】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / ha の施用量で、83 % の効力を示す： I - 30、I - 63。

30

【0401】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、100 % の効力を示す： I - 11。

【0402】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / ha の施用量で、83 % の効力を示す： I - 17。

【0403】

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験 (SPODFR)

40

溶媒： 78.0 重量部のアセトン

1.5 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1000 ppm の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0404】

トウモロコシ (Zea mays) の葉のディスクに所望濃度の活性成分配合物を噴霧し、乾燥後、ツマジロクサヨトウ (armyworm) (Spodoptera fru

50

g i p e r d a) の幼虫を寄生させる。

【0405】

7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し；0%は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

【0406】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I-2、I-21、I-26、I-37、I-39、I-42、I-46、I-47、I-54、I-61、I-63、I-68。

【0407】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、83%の効力を示す： I-14、I-19、I-48。

【0408】

ナミハダニ (Tetranychus urticae) - 噴霧試験；OP抵抗性 (TETRUR)

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0409】

全ての成育段階のナミハダニ (greenhouse red spider mite) (Tetranychus urticae) が発生しているインゲンマメ (Phaseolus vulgaris) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分配合物を噴霧する。

【0410】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し；0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【0411】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I-68。

【0412】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： I-2、I-13、I-19、I-22、I-28、I-42、I-44、I-53。

【0413】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、90%の効力を示す： I-48。

【0414】

モモアカアブラムシ (Myzus persicae) - 噴霧試験 (MYZUPE)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、1000ppmの濃度で当該配合物溶液に添加する。

【0415】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に発生しているピーマン (*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を噴霧することによって処理する。

【0416】

6日間経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0417】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100ppmの施用量で97%の効力を示す： I-11。

【0418】

サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) 試験

溶媒： 125.0重量部のアセトン

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記量の溶媒と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0419】

容器に、砂、活性成分溶液、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*) の卵/幼虫の懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、植物が成長する。根では、こぶが形成される。

【0420】

14日間経過した後、こぶの形成によって殺線虫効力(%)を求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し；0%は、処理された植物のこぶの数が処理されていない対照のこぶの数に相当することを意味する。

【0421】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-68。

【0422】

比較実施例：

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 接触試験 (MYZUPE c

)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び/又は浸透剤(ナタネ油メチルエステル)を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

【0423】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に発生している1葉期のピーマン (*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の裏面に噴霧することによって処理する。

【0424】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0425】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

【0426】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 層透過 (translami

10

20

30

40

50

n a r) 試験 (M Y Z U P E t)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤（ナタネ油メチルエステル）を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

【0427】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が重度に発生している1葉期のピーマン (*Capsicum annuum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の上面に噴霧することによって処理する。

【0428】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0429】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

【0430】

ワタアブラムシ (Aphis gossypii) - 接触試験 (APHIGO c)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤（ナタネ油メチルエステル）を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1000ppmの濃度でピペットで量って添加する。

【0431】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) が重度に発生している1葉期のワタ (*Gossypium hirsutum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の裏面に噴霧することによって処理する。

【0432】

所望の期間が経過した後、殺虫率(%)を求める。100%は、全てのワタアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだワタアブラムシが無かったことを意味する。

【0433】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO2013018928の既知化合物と比較して、優れた効力を示す(表を参照されたい)。

【0434】

ワタアブラムシ (Aphis gossypii) - 層透過 (translaminar) 試験 (APHIGO t)

溶媒： 7重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて1000ppmの濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤（ナタネ油メチルエステル）を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、10

10

20

30

40

50

0 0 p p m の濃度でピペットで量って添加する。

【0 4 3 5】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) が重度に発生している 1 葉期のワタ (*Gossypium hirsutum*) 植物を、所望濃度の該活性成分配合物を葉の上面に噴霧することによって処理する。

【0 4 3 6】

所望の期間が経過した後、殺虫率 (%) を求める。1 0 0 % は、全てのワタアブラムシが死んだことを意味し、0 % は、死んだワタアブラムシが無かったことを意味する。

【0 4 3 7】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO 2 0 1 3 0 1 8 9 2 8 の既知化合物と比較して、優れた効力を示す (表を参照されたい)。

【0 4 3 8】

ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) 試験 (NEPHCI)

溶媒: 7 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1 0 0 0 p p m の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤 (ナタネ油メチルエステル) を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1 0 0 0 p p m の濃度でピペットで量って添加する。

【0 4 3 9】

イネ植物 (*Oryza sativa*, var. *Balilla*) を所望濃度の該活性成分配合物を噴霧することによって処理し、次いで、ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*) の幼虫を寄生させる。

【0 4 4 0】

所望の期間が経過した後、殺虫率 (%) を求める。1 0 0 % は、全てのツマグロヨコバイが死んだことを意味し; 0 % は、死んだツマグロヨコバイが無かったことを意味する。

【0 4 4 1】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO 2 0 1 3 0 1 8 9 2 8 の既知化合物と比較して、優れた効力を示す (表を参照されたい)。

【0 4 4 2】

トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) 試験 (NILALU)

溶媒: 7 重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤: アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1 重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、乳化剤を含有している水を用いて 1 0 0 0 p p m の濃度とする。さらなる試験濃度を得るために、該調製物を乳化剤を含有している水で希釈する。アンモニウム塩及び／又は浸透剤 (ナタネ油メチルエステル) を添加することが必要な場合、それらは、いずれも、完成した当該配合物溶液を希釈した後、1 0 0 0 p p m の濃度でピペットで量って添加する。

【0 4 4 3】

イネ植物 (*Oryza sativa*, var. *Balilla*) を所望濃度の該活性成分配合物を噴霧することによって処理し、次いで、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) の L 3 幼虫を寄生させる。

【0 4 4 4】

所望の期間が経過した後、食害 (%) を求める。1 0 0 % は、食害が見られないことを意味し; 0 % は、処理された植物に対する食害が処理されていない対照に対する食害に相当することを意味する。

10

20

30

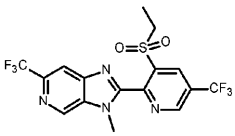
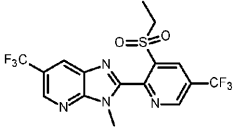
40

50

【 0 4 4 5 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、WO 2 0 1 3 0 1 8 9 2 8 の既知化合物と比較して、優れた効力を示す（表を参照されたい）。

【表 3】

物 質	構 造	動 物 種	濃 度	効力 (%) dat*	
Ex. I-21		MYZUPE c	2.4 g/ha	85	14 dat
		MYZUPE t	12 g/ha	98	14 dat
		MYZUPE t	2.4 g/ha	90	14 dat
		APHIGO c	2.4 g/ha	98	7 dat
		APHIGO t	2.4 g/ha	65	7 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	90	14 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	95	21 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	100	34 dat
		NILALU	4 ppm	90	21 dat
		NILALU	4 ppm	100	28 dat
Ex. 5 WO2013018928 から既知		MYZUPE c	2.4 g/ha	50	14 dat
		MYZUPE t	12 g/ha	0	14 dat
		MYZUPE t	2.4 g/ha	0	14 dat
		APHIGO c	2.4 g/ha	15	7 dat
		APHIGO t	2.4 g/ha	0	7 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	0	14 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	0	21 dat
		NEPHCI	0.16 ppm	0	34 dat
		NILALU	4 ppm	35	21 dat
		NILALU	4 ppm	20	28 dat

* dat = 処理後日数 (日)

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2015/052351

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D471/04 C07D498/04 C07D473/40 C07D213/74 C07D213/73
A01N43/90

ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2012/086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; TAKYO HAYATO [JP]) 28 June 2012 (2012-06-28) cited in the application claims 1,12,14,15; examples -----	1-19
X	WO 2013/018928 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; TAKAHASHI MASAKI [JP]) 7 February 2013 (2013-02-07) cited in the application claims 1,10,15-20; examples -----	1-19
A	EP 0 079 083 A1 (WELLCOME FOUND [GB]) 18 May 1983 (1983-05-18) claims 1,10; compounds I,II page 10, last paragraph; example 40 ----- -/-	1-19

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 February 2015

Date of mailing of the international search report

09/03/2015

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Ladenburger, Claude

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2015/052351

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	W0 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 8 January 2015 (2015-01-08) cited in the application claims 1,9,14,15; examples P5,P18; table V12 Schemata 14,15, Seite 39; examples P4E,P13B -----	1-19

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2015/052351

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012086848	A1	28-06-2012	AR 084588 A1 29-05-2013 CA 2822919 A1 28-06-2012 CN 103261170 A 21-08-2013 EP 2655337 A1 30-10-2013 JP 2013136519 A 11-07-2013 KR 20130140125 A 23-12-2013 TW 201234965 A 01-09-2012 US 2014018373 A1 16-01-2014 US 2014364444 A1 11-12-2014 WO 2012086848 A1 28-06-2012
WO 2013018928	A1	07-02-2013	AR 087467 A1 26-03-2014 AU 2012290923 A1 09-01-2014 CA 2844241 A1 07-02-2013 CN 103717598 A 09-04-2014 EP 2739624 A1 11-06-2014 JP 2014005263 A 16-01-2014 KR 20140068920 A 09-06-2014 TW 201321363 A 01-06-2013 US 2014194290 A1 10-07-2014 WO 2013018928 A1 07-02-2013
EP 0079083	A1	18-05-1983	AR 241247 A1 31-03-1992 AU 9030682 A 19-05-1983 DD 205904 A5 11-01-1984 DK 499582 A 11-05-1983 EP 0079083 A1 18-05-1983 ES 8401486 A1 01-03-1984 ES 8503351 A1 01-06-1985 FI 823846 A 11-05-1983 GB 2113675 A 10-08-1983 GR 76746 A1 30-08-1984 IE 56478 B1 14-08-1991 MC 1491 A 12-09-1983 NO 823732 A 11-05-1983 PH 22764 A 12-12-1988 PT 75820 A 01-12-1982 US 4603139 A 29-07-1986
WO 2015000715	A1	08-01-2015	NONE

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/052351

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

INV. C07D471/04 C07D498/04 C07D473/40 C07D213/74 C07D213/73
A01N43/90

ADD.

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

C07D A01N

Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 2012/086848 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; TAKYO HAYATO [JP]) 28. Juni 2012 (2012-06-28) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,12,14,15; Beispiele -----	1-19
X	WO 2013/018928 A1 (SUMITOMO CHEMICAL CO [JP]; TAKAHASHI MASAKI [JP]) 7. Februar 2013 (2013-02-07) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,10,15-20; Beispiele -----	1-19
A	EP 0 079 083 A1 (WELLCOME FOUND [GB]) 18. Mai 1983 (1983-05-18) Ansprüche 1,10; Verbindungen I,II Seite 10, letzter Absatz; Beispiel 40 ----- -/-	1-19

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen
 ☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

27. Februar 2015

Abschließendes Datum des internationalen Recherchenberichts

09/03/2015

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Ladenburger, Claude

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP2015/052351

C. (Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X,P	W0 2015/000715 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]) 8. Januar 2015 (2015-01-08) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,9,14,15; Beispiele P5,P18; Tabelle V12 Schemata 14,15, Seite 39; Beispiele P4E,P13B -----	1-19

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2015/052351

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2012086848 A1	28-06-2012	AR 084588 A1	29-05-2013
		CA 2822919 A1	28-06-2012
		CN 103261170 A	21-08-2013
		EP 2655337 A1	30-10-2013
		JP 2013136519 A	11-07-2013
		KR 20130140125 A	23-12-2013
		TW 201234965 A	01-09-2012
		US 2014018373 A1	16-01-2014
		US 2014364444 A1	11-12-2014
		WO 2012086848 A1	28-06-2012
WO 2013018928 A1	07-02-2013	AR 087467 A1	26-03-2014
		AU 2012290923 A1	09-01-2014
		CA 2844241 A1	07-02-2013
		CN 103717598 A	09-04-2014
		EP 2739624 A1	11-06-2014
		JP 2014005263 A	16-01-2014
		KR 20140068920 A	09-06-2014
		TW 201321363 A	01-06-2013
		US 2014194290 A1	10-07-2014
		WO 2013018928 A1	07-02-2013
EP 0079083 A1	18-05-1983	AR 241247 A1	31-03-1992
		AU 9030682 A	19-05-1983
		DD 205904 A5	11-01-1984
		DK 499582 A	11-05-1983
		EP 0079083 A1	18-05-1983
		ES 8401486 A1	01-03-1984
		ES 8503351 A1	01-06-1985
		FI 823846 A	11-05-1983
		GB 2113675 A	10-08-1983
		GR 76746 A1	30-08-1984
		IE 56478 B1	14-08-1991
		MC 1491 A	12-09-1983
		NO 823732 A	11-05-1983
		PH 22764 A	12-12-1988
		PT 75820 A	01-12-1982
		US 4603139 A	29-07-1986
WO 2015000715 A1	08-01-2015	KEINE	

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 473/40 (2006.01)		C 0 7 D 473/40	C S P	
A 6 1 K 31/437 (2006.01)		A 6 1 K 31/437		
A 0 1 P 7/02 (2006.01)		A 0 1 P 7/02		
A 0 1 P 7/04 (2006.01)		A 0 1 P 7/04		
A 0 1 P 5/00 (2006.01)		A 0 1 P 5/00		
A 0 1 N 43/90 (2006.01)		A 0 1 N 43/90	1 0 4	
C 0 7 D 213/73 (2006.01)		A 0 1 N 43/90	1 0 3	
		C 0 7 D 213/73		
		A 0 1 N 43/90	1 0 5	

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

(74)代理人 100137213
弁理士 安藤 健司

(74)代理人 100143823
弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100151448
弁理士 青木 孝博

(74)代理人 100183519
弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483
弁理士 川寄 洋祐

(74)代理人 100203035
弁理士 五味渕 琢也

(74)代理人 100185959
弁理士 今藤 敏和

(74)代理人 100160749
弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255
弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100202267
弁理士 森山 正浩

(74)代理人 100146318
弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812
弁理士 城山 康文

(72)発明者 フィッシャー, リュディガー
ドイツ国、5 0 2 5 9・プルハイム、ツー・デン・フースフェレン・2 3

(72)発明者 アリグ, ベルント
ドイツ国、5 3 6 3 9・ケーニッヒスヴィンター、イム・ロートシーフェン・7

(72)発明者 イルク, ケルスティン

- ドイツ国、5 0 6 7 0 ・ケルン、ノイッサー・ヴァル・3 2
- (72)発明者 マルサム, オルガ
ドイツ国、5 1 5 0 3 ・レスラート、フォア・デム・クロスターホーフ・1 9
- (72)発明者 ジェルゲン, ウルリッヒ
ドイツ国、4 0 8 8 2 ・ラーティンゲン、フェスター・シュトラッセ・3 7
- (72)発明者 タルベルク, アンドレアス
ドイツ国、4 2 7 8 1 ・ハーン、ジントーシュトラッセ・8 6
- (72)発明者 リー, ジュン
ドイツ国、3 0 6 2 7 ・ハノーファー、ノーベルリング・4 2
- (72)発明者 ツェルシュ, セルゲイ
ウクライナ国、0 7 4 0 0 ・プロバルイ、コロレンコ・ストリート・6 4、アパートメント・1 1
8
- (72)発明者 アールト, アレクサンドル
ドイツ国、5 1 3 7 3 ・レーバークーゼン、ハウプトシュトラッセ・9 4
- Fターム(参考) 4C055 AA01 BA02 BA13 CA02 CA42 DA52
4C065 AA05 BB04 CC01 DD02 EE02 HH03 JJ01 KK05 KK09 LL01
PP08
4C072 AA01 BB02 CC03 CC11 EE03 FF09 GG01 HH02 HH07
4C086 AA01 AA02 AA03 CB05 CB22 MA01 MA04 NA14 ZB37
4H011 AC01 AC04 BA01 BB08 BB10 BC03 BC06 DA16 DD03