

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5826822号
(P5826822)

(45) 発行日 平成27年12月2日 (2015. 12. 2)

(24) 登録日 平成27年10月23日 (2015. 10. 23)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 401/04 (2006. 01)

C O 7 D 401/04 C S P

C O 7 D 417/04 (2006. 01)

C O 7 D 417/04

C O 7 D 417/14 (2006. 01)

C O 7 D 417/14

A 6 1 K 31/4439 (2006. 01)

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/506 (2006. 01)

A 6 1 K 31/506

請求項の数 5 (全 57 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2013-504230 (P2013-504230)
 (86) (22) 出願日 平成23年4月11日 (2011. 4. 11)
 (65) 公表番号 特表2013-525288 (P2013-525288A)
 (43) 公表日 平成25年6月20日 (2013. 6. 20)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2011/055645
 (87) 国際公開番号 W02011/128304
 (87) 国際公開日 平成23年10月20日 (2011. 10. 20)
 審査請求日 平成26年4月8日 (2014. 4. 8)
 (31) 優先権主張番号 61/325, 094
 (32) 優先日 平成22年4月16日 (2010. 4. 16)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)
 (31) 優先権主張番号 10160189. 6
 (32) 優先日 平成22年4月16日 (2010. 4. 16)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 512137348
 バイエル・インテレクチュアル・プロパティ・ゲゼルシャフト・ミット・ベシュレンクテル・ハフツング
 Bayer Intellectual Property GmbH
 ドイツ40789モンハイム・アム・ライン、アルフレート・ノーベル・シュトラッセ10番
 (74) 代理人 100146318
 弁理士 岩瀬 吉和
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢敦

最終頁に続く

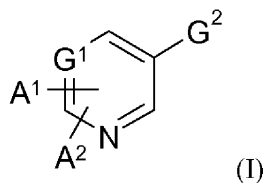
(54) 【発明の名称】 有害生物防除薬としての新規な複素環化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I) の化合物。

【化 1】

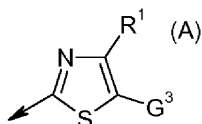


(I)

{ 式中、

A¹ および A² はそれぞれ独立に水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ アルキル、C₃ - C₆ シクロアルキルまたは C₁ - C₆ アルコキシであり、G¹ は N または C - A¹ であり、G² は、

【化 2】

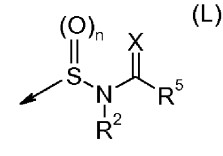
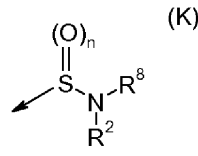
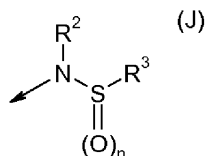
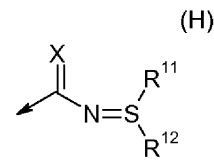
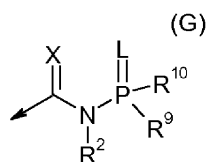
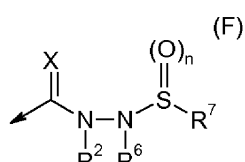
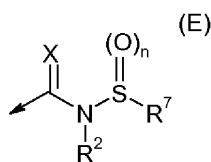


であり、矢印は隣接する環への結合を示しており、

R^1 は水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシまたは $C_1 - C_6$ ハロアルキルであり、

G^3 は、下記の群：

【化 3】



からの基であり、矢印は G^2 への結合を示し、

X は酸素または硫黄であり、

n は 1 または 2 であり、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、シアノ $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ $C_1 - C_6$ アルキル、ハロゲン置換されていても良い $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル、ハロゲン置換されていても良い $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル、ハロゲン置換されていても良い $C_3 - C_6$ シクロアルキルカルボニル、またはカチオンの群からの基であり、

R^3 および R^7 は、それぞれ独立に各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル - 又は $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル置換されていても良い $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - 又は $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルケニル（これらの環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい。）、並びに各場合でハロゲン -、シアノ -（アルキル部分でのものを含む）、ニトロ -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_6$ アルキルアミノ -、ジ（ $C_1 - C_6$ アルキル）アミノ -、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ アルコ

10

20

30

40

50

キシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_2 - C_6$ アルケニル -、 $C_2 - C_6$ アルキニル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル - 又はアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール - $C_1 - C_6$ アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_6$ アルキル又は $NR'R''$ (R' 及び R'' は、各々独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル及び $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニルから成る群より選択される基である。)

から成る群より選択される基であり、

10

R^2 および R^3 がそれらが結合している $N - S(O)_n$ 基とともに、飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ置換されていても良い 5 から 7 員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいても良く、

R^5 は各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル - 又は $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル置換されていても良い $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ及び $C_2 - C_6$ アルキニル、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - 又は $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル及び $C_3 - C_6$ シクロアルケニル [その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいてもよい。]、並びに、各場合でハロゲン -、シアノ - (アルキル部分でのものを含む)、ニトロ -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル、アミノ -、 $C_1 - C_6$ アルキルアミノ -、ジ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ -、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_2 - C_6$ アルケニル -、 $C_2 - C_6$ アルキニル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル - 又はアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、ヘテロアリール $C_1 - C_6$ アルキル又は $NR'R''$ (R' 及び R'' は、各々独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル及び $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニルから成る群より選択される基である。)

20

30

40

から成る群より選択される基であり、

R^8 は、水素、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル又は $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル - 置換されていても良い $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ及び $C_2 - C_6$ アルキニル、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - 又は $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルキル及び $C_3 - C_6$ シクロアルケニル [その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個の

50

ヘテロ原子を含んでいてもよい。]、並びに、各場合でハロゲン -、シアノ - (アルキル部分でのものを含む)、ニトロ -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_6$ アルキルアミノ -、ジ ($C_1 - C_6$ アルキル) アミノ -、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_2 - C_6$ アルケニル -、 $C_2 - C_6$ アルキニル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル - 又はアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール $C_1 - C_6$ アルキル、ヘテロアリール $C_1 - C_6$ アルキル又は $NR' R''$ (R' 及び R'' は、各々独立して水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルカルボニル及び $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニルから成る群より選択される基である。) から成る群より選択される基であり、

R^2 および R^5 が、それらが結合している $N - C(X)$ 基とともに飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い5から7員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

R^6 は水素または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^2 および R^6 が、それらが結合している窒素原子とともに、飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い5から7員環であっても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも1個の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

G^3 が (E) である場合には、 R^2 および R^7 がそれらが結合している $N - S(O)_n$ 基とともに、飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い5から7員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

G^3 が (F) である場合には、 R^6 および R^7 がそれらが結合している $N - S(O)_n$ 基とともに、飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い5から7員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

R^2 および R^8 がそれらが結合している窒素原子とともに、飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い5から7員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

L は酸素または硫黄であり、

R^9 および R^{10} はそれぞれ独立に、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_2 - C_6$ アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$

10

20

30

40

50

アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルオキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルケニルオキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_1 - C_6$ アルキルチオ、 $C_2 - C_6$ アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリール $C_1 - C_6$ アルコキシおよびヘテロアリール $C_1 - C_6$ アルキルチオの群からの各場合でハロゲン置換されていても良い基であり、

R^9 および R^{10} はそれらが結合しているリン原子とともに、飽和または不飽和およびハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い5から7員の環を形成していても良く、その環は酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および硫黄の群からの1個もしくは2個のヘテロ原子を含んでいても良く、

10

R^{11} および R^{12} はそれぞれ独立に、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、フェニルおよびフェニル $C_1 - C_6$ アルキルの群からの各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ アルキル -、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ - 置換されていても良い基であり、

ただし、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素から成る群より選択され、アリール（より大きな部分の一部となっているものを含む）は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルから成る群より選択され、

ヘテロアリール（より大きな部分の一部となっているものを含む）は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3 - トリアジニル、1, 2, 4 - トリアジニル、1, 3, 5 - トリアジニル、ベンゾフリル、ベンズイソフリル、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、ベンズイソチアゾリル、ベンゾキサゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンズイミダゾリル、2, 1, 3 - ベンゾキサジアゾール、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成る群より選択される。}

20

30

【請求項2】

請求項1に記載の式(I)の化合物であって、

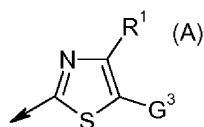
A^1 は、水素、ハロゲン又はシアノであり、

A^2 は水素であり、

G^1 は、N又は $C - A^1$ であり、

G^2 は、

【化4】



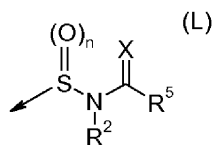
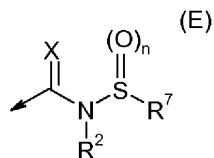
40

であり、矢印は隣接する環への結合を示しており、

R^1 は水素又は $C_1 - C_4$ アルキルであり、

G^3 は、下記の群：

【化 5】



10

からの基であり、矢印は G^2 への結合を示し、

X は酸素であり、

n は 2 であり、

R^2 は、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ $C_1 - C_4$ アルキル、ハロゲン置換されていても良い $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル、ハロゲン置換されていても良い $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、ハロゲン -、 $C_1 - C_4$ アルキル -、 $C_1 - C_4$ アルコキシ -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル - およびシアノ置換されていても良い $C_3 - C_6$ シクロアルキルカルボニル、またはカチオンの群からの基であり、

20

R^5 は、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、ジ ($C_1 - C_4$ アルキル) アミノ及びヘテロアリール - $C_1 - C_4$ アルキルから成る群より選択される基であり、

R^7 は、それぞれ独立に各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_4$ アルコキシ -、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル - 及び $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニル置換されていても良い $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_2 - C_4$ アルケニル、 $C_2 - C_4$ アルキニル、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_4$ アルキル -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル -、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - 又は $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - $C_1 - C_4$ アルキル及び $C_3 - C_6$ シクロアルケニル (これらの環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいても良い)、各場合でハロゲン -、シアノ - (アルキル部分でのものを含む)、ニトロ -、 $C_1 - C_4$ アルキル -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル -、 $C_1 - C_4$ アルコキシ -、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_4$ アルキルチオ -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_4$ アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_4$ アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_4$ ハロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_4$ アルキルアミノ -、ジ ($C_1 - C_4$ アルキル) アミノ -、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_4$ アルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル -、 $C_1 - C_4$ ハロアルコキシ - $C_1 - C_4$ アルキル -、 $C_2 - C_4$ アルケニル -、 $C_2 - C_4$ アルキニル -、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル又はアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール - $C_1 - C_4$ アルキルおよびヘテロアリール - $C_1 - C_4$ アルキル又は $NR' R''$ (R' 及び R'' は、各々独立して水素及び $C_1 - C_4$ アルキルから成る群より選択される基である。) から成る群より選択される基であり、但し、

30

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素から成る群より選択され、

アリール (より大きな部分の一部となっているものを含む) は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルから成る群より選択され、

40

50

ヘテロアリール（より大きな部分の一部となっているものを含む）は、ピリミジル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、イミダゾリル、チアゾリル及びフラニルから成る群より選択される、
前記化合物。

【請求項 3】

少なくとも 1 種類の請求項 1 又は 2 に記載の式（Ⅰ）の化合物および一般的な増量剤および／または界面活性剤を含む、有害生物を防除するための組成物。

【請求項 4】

有害生物の防除方法において、請求項 1 又は 2 に記載の式（Ⅰ）の化合物または請求項 3 に記載の組成物を該有害生物および／またはその生息場所に作用させることを特徴とする方法。

10

【請求項 5】

有害生物の防除における請求項 1 又は 2 に記載の式（Ⅰ）の化合物または請求項 3 に記載の組成物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本願は、新規なアミド類およびチオアミド類、その製造方法および節足動物、特に昆虫などの有害動物の防除におけるその使用に関するものである。

【背景技術】

20

【0002】

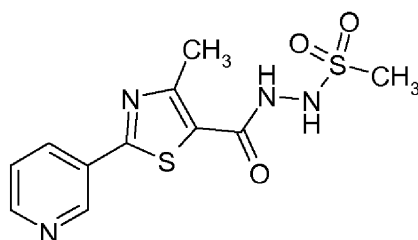
特定のアミド類およびチオアミド類が、殺虫活性化合物としてすでに知られている（DE 2 22 2 1 6 4 7、WO 2 0 0 9 / 1 4 9 8 5 8、WO 2 0 1 0 / 1 2 9 4 9 7 参照）。

【0003】

さらに、下記式の化合物：

【0004】

【化 1】



30

が知られているが（CAS登録番号 2 6 2 8 5 5 - 2 0 - 9）、それについての使用は報告されていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0005】

40

【特許文献 1】DE 2 22 2 1 6 4 7

【特許文献 2】WO 2 0 0 9 / 1 4 9 8 5 8

【特許文献 3】WO 2 0 1 0 / 1 2 9 4 9 7

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

現代の作物保護組成物は、例えばそれらの作用および可能な使用のレベル、期間および広さに関して多くの要求を満足するものでなければならない。毒性および他の有効成分または製剤補助剤との組み合わせ可能性についての問題は、有効成分の合成に必要な経費の問題と同様に、一定の役割を果たす。さらに、抵抗性が生じる可能性がある。これら全て

50

の理由のため、新規な作物保護組成物の研究は完全と考えることはできず、公知の化合物と比較して、少なくとも個々の側面に関して改善された特性を有する新規な化合物が常に必要とされている。

【 0 0 0 7 】

本発明の目的は、多様な面で農薬のスペクトラムを広げる化合物を提供することにある。

【課題を解決するための手段】

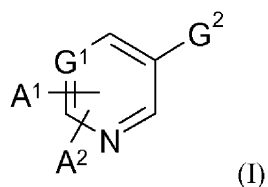
【 0 0 0 8 】

この目的および明瞭に記載されているわけではないが本明細書に記載の関連物から認識可能または誘導可能である別の目的が、新規な式 (I) の化合物ならびに式 (I) の化合物の塩および N - オキサイドによって達成される。

10

【 0 0 0 9 】

【化 2】



(I)

式中、

20

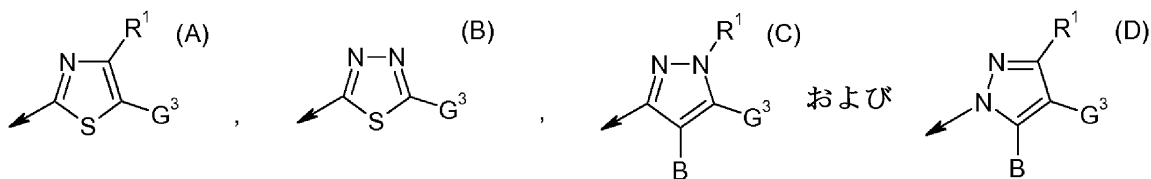
A¹ および A² はそれぞれ独立に水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、シクロアルキルまたはアルコキシであり、

G¹ は N または C - A¹ であり、

G² は、下記の群：

【 0 0 1 0 】

【化 3】



30

からの基であり、矢印は隣接する環への結合を示しており、

R¹ は複素環 (A) および (D) の場合に、水素、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオまたはハロアルキルであり、

R¹ は、複素環 (C) の場合に水素、アルキルまたはハロアルキルであり、

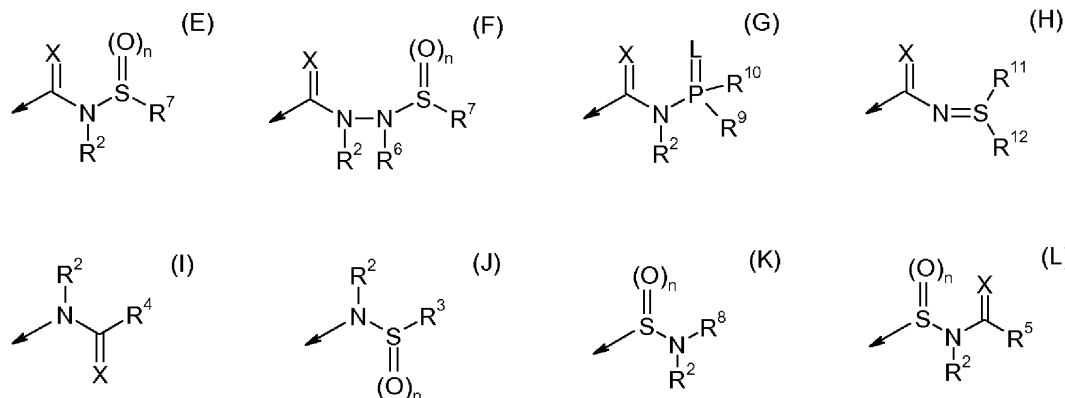
B は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオまたはアルコキシであり、

G³ は、下記の群：

40

【 0 0 1 1 】

【化 4】



10

からの基であり、矢印は G^2 への結合を示し、基 (E)、(F)、(G)、(H)、(K) および (L) は複素環 (A)、(B)、(C) および (D) と、基 (I) は複素環 (A) と、基 (J) は複素環 (A)、(C) および (D) 組み合わせることができ、

X は酸素または硫黄であり、

n は 1 または 2 であり、

R^2 は、水素、アルキル、ハロアルキル、シアノアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルケニル、アルコシアルキル、ハロゲン置換されていても良いアルキルカルボニル、ハロゲン置換されていても良いアルコシカルボニル、ハロゲン -、アルキル -、アルコキシ -、ハロアルキル - およびシアノ置換されていても良いシクロアルキルカルボニル、またはカチオン、例えば 1 価もしくは 2 価の金属イオンまたはアルキル - またはアリールアルキル置換されていても良いアンモニウムイオンの群からの基であり、

20

R^3 および R^7 は、それぞれ独立に各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルキニル、各場合で置換されていても良いシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニル (これらの環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいても良い)、各場合で置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていても良いアミノ基の群からの基であり、

R^2 および R^3 がそれらが結合している N - S(O)_n 基とともに、飽和または不飽和および置換されていても良い 4 から 8 員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいても良く、

30

R^4 および R^5 はそれぞれ独立に各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルコキシ、アルキニル、各場合で置換されていても良いシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルの群からの基であり、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子、各場合で置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていても良いアミノ基を含んでいても良く、

R^8 は、水素、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニル、アルコキシ、アルキニル、各場合で置換されていても良いシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルケニルの群からの基であり、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子、各場合で置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリールアルキルおよびヘテロアリールアルキルおよび置換されていても良いアミノ基を含んでいても良く、

40

R^2 および R^4 がそれらが結合している N - C(X) 基とともに 4 から 8 員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいても良い飽和または不飽和および置換されていても良く、

R^2 および R^5 が、それらが結合している N - C(X) 基とともに飽和または不飽和お

50

よび置換されていても良い4から8員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く。

【0012】

R⁶は水素またはアルキルであり、

R²およびR⁶が、それらが結合している窒素原子とともに、飽和または不飽和および置換されていても良い4から8員環であっても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1個の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

R²およびR⁷がそれらが結合している基(E)におけるN-S(O)_n基とともに、飽和または不飽和および置換されていても良い4から8員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

10

R⁶およびR⁷がそれらが結合しているN-S(O)_n基とともに、飽和または不飽和および置換されていても良い4から8員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

R²およびR⁸がそれらが結合している窒素原子とともに、飽和または不飽和および置換されていても良い4から8員環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く、

20

Lは酸素または硫黄であり、

R⁹およびR¹⁰はそれぞれ独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、シクロアルキル、シクロアルキルオキシ、シクロアルケニルオキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルキルチオ、アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールアルコキシおよびヘテロアリールアルキルチオの群からの各場合で置換されていても良い基であり、

R⁹およびR¹⁰はそれらが結合しているリン原子とともに、飽和または不飽和および置換されていても良い5から7員の環を形成していても良く、その環は酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および硫黄の群からの1個もしくは2個のヘテロ原子を含んでいても良く、

30

R¹¹およびR¹²はそれぞれ独立に、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニルおよびフェニルアルキルの群からの各場合で置換されていても良い基であり、

ただし、G¹がC-Hであり、G²が基(A)であり、R¹がメチルであり、nが2であり、Xが酸素であり、A¹、R²およびR⁶がそれぞれ水素である場合に、基(F)におけるR⁷はメチル以外である。

【発明を実施するための形態】

【0013】

40

さらに、下記に記載の方法によって、式(I)の新規化合物を得ることができるが見出された。

【0014】

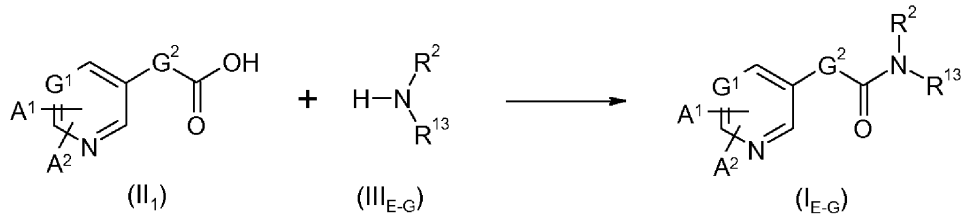
G³基に応じて、式(I)の化合物は、下位構造(I_E)から(I_L)に分けることができる。

【0015】

式(I_{E-G})の化合物は、例えば式(II₁)の複素環カルボン酸またはその酸塩化物を式(II_{E-G})のアミン誘導体を反応させることで製造することができる。

【0016】

【化5】

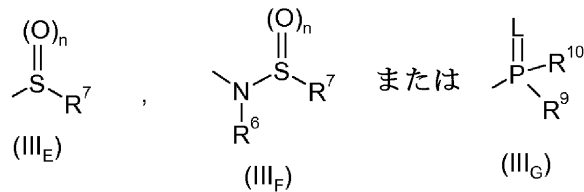


式中、R^{1 3} は

【0017】

10

【化6】



である。

【0018】

式(I_I)の化合物は、例えば式(II₂)の複素環アミン類を式(III_I)のカルボン酸またはその酸塩化物と反応させることで製造することができる。

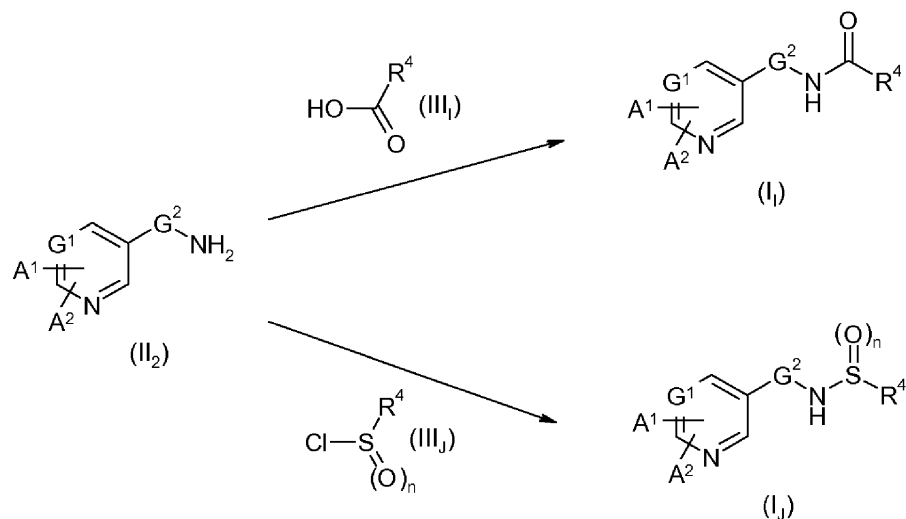
20

【0019】

式(I_J)の化合物は、例えば式(II₂)複素環アミン類を式(III_J)のスルホニルクロライドと反応させることで製造することができる。

【0020】

【化7】



30

式(I_K)の化合物は、例えば式(III₃)のスルホニルクロライドを式(III_K)のアミン類と反応させることで製造することができる。

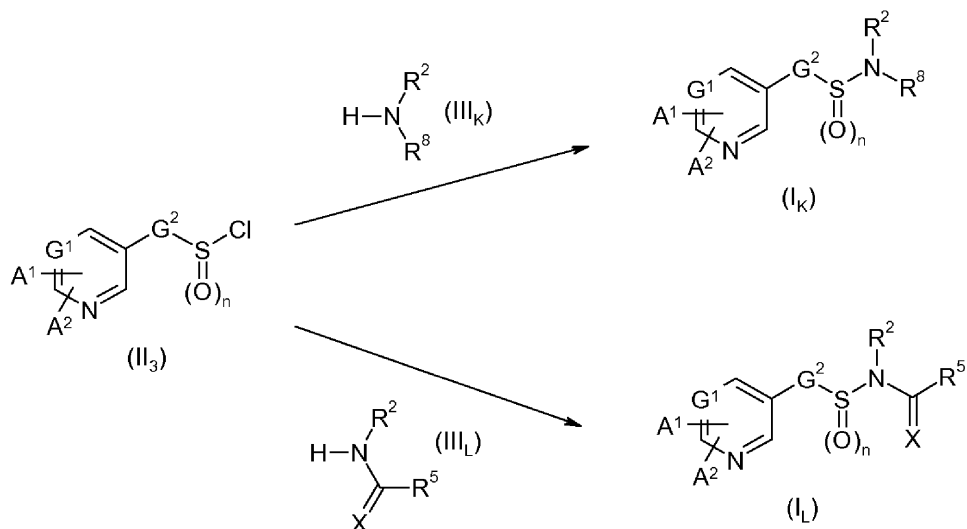
【0021】

式(I_L)の化合物を、例えば式(III₃)のスルホニルクロライドを式(III_L)のアミド類と反応させることで製造することができる。

【0022】

40

【化 8】



10

最後に、式 (I) の新規化合物は非常に顕著な生理特性を有し、特に農業、森林、貯蔵品および材料の保護ならびに衛生部門で遭遇する有害動物、特に昆虫、クモ類および線虫の防除に好適であることが見出された。

【 0 0 2 3 】

20

式 (I) の化合物の化合物は、適切な場合、置換基の性質に応じて、幾何異性体および/または光学活性異性体または異なる組成での相当する異性体混合物の形態のものであることができる。本発明は、純粋な異性体および異性体混合物の両方に関するものである。

【 0 0 2 4 】

本発明の化合物は、例えば D E 2 2 2 1 6 4 7 において他のアミド類について記載のように、金属錯体として存在しても良い。

【 0 0 2 5 】

式 (I) の化合物で示された基についての好ましい置換基および範囲について以下で説明する。

【 0 0 2 6 】

30

A¹ および A² はそれぞれ独立に水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルまたは C₁ - C₆ - アルコキシである。

【 0 0 2 7 】

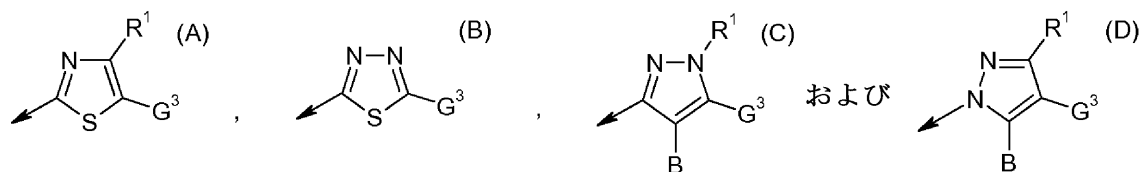
G¹ は N または C - A¹ である。

【 0 0 2 8 】

G² は、

【 0 0 2 9 】

【化 9】



40

の群からの基であり、矢印は隣接する環への結合を示す。

【 0 0 3 0 】

複素環 (A) および (D) の場合の R¹ は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルコキシまたは C₁ - C₆ - ハロアルキルである。

【 0 0 3 1 】

複素環 (C) の場合の R¹ は、水素、C₁ - C₆ - アルキルまたは C₁ - C₆ - ハロア

50

ルキルである。

【 0 0 3 2 】

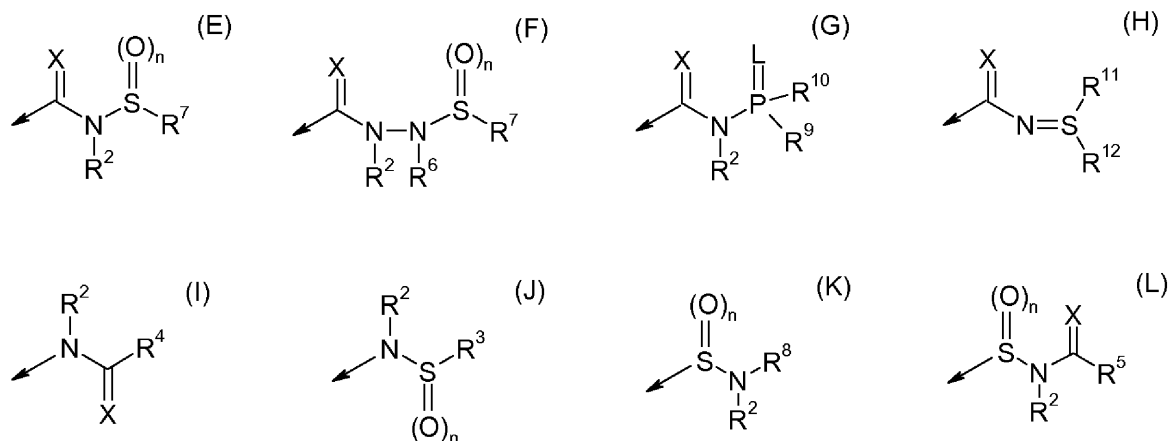
B は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシまたは $C_3 - C_6$ -シクロアルキルである。

【 0 0 3 3 】

G^3 は、

【 0 0 3 4 】

【 化 1 0 】



の群からの基であり、矢印は G^2 への結合であり、基 (E)、(F)、(G)、(H)、(K) および (L) は複素環 (A)、(B)、(C) および (D) と、基 (I) は複素環 (A) と、基 (J) は複素環 (A)、(C) および (D) と組み合わせることができ、

X は酸素または硫黄である。

【 0 0 3 5 】

n は 1 または 2 である。

【 0 0 3 6 】

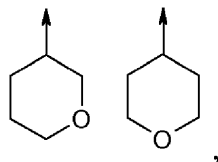
R^2 は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、シアノ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、ハロゲン置換されていても良い $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、ハロゲン置換されていても良い $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、ハロゲン-、 $C_1 - C_6$ -アルキル-、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ-、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル- およびシアノ置換されていても良い $C_3 - C_6$ -シクロアルキルカルボニル、またはカチオン、例えば 1 価もしくは 2 価の金属イオンまたは $C_1 - C_6$ -アルキル- またはアリール- $C_1 - C_6$ -アルキル置換されていても良いアンモニウムイオンの群からの基である。

【 0 0 3 7 】

R^3 および R^7 はそれぞれ独立に、各場合でハロゲン-、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ-、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ-、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ-、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ-、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル-、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルフィニル-、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル- および $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル置換されていても良い $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、各場合でハロゲン-、 $C_1 - C_6$ -アルキル-、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル-、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- または $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルケニル [これらの環は、硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの少なくとも 1 個のヘテロ原子を含んでいても良い (特に、

【 0 0 3 8 】

【化 1 1】



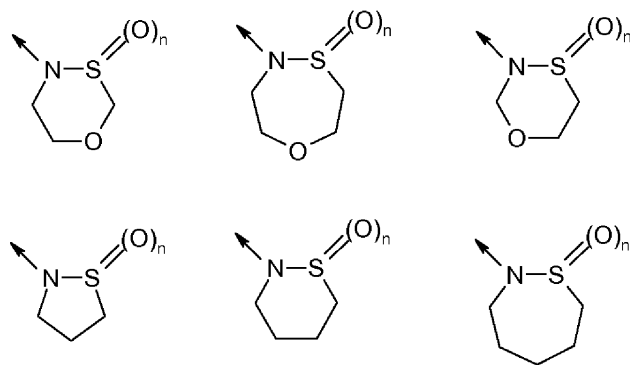
であり、矢印は各場合で基 (E)、(F) および (J) における硫黄原子への結合を示す。
)]、各場合でハロゲン -、シアノ - (アルキル部分でのものを含む)、ニトロ -、
 $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル -、
 $C_1 - C_6$ - アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ
 -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$
 C_6 - ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_6$ - ハ
 ロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ -、ジ ($C_1 - C_6$ -
 アルキル) アミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルコキ
 シカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$
 C_6 - ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_2 - C_6$ - アルケニル -、 $C_2 - C_6$ -
 アルキニル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - アル
 キルカルボニル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル - またはアミノカルボニル置換
 されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール - $C_1 - C_6$ - アルキル、ヘテロ
 アリール - $C_1 - C_6$ - アルキル、または $NR' R''$ (R' および R'' はそれぞれ独立に
 水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル
 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_1 - C_6$ - アルコ
 キシルカルボニルの群からの基である。) の群からの基である。

【 0 0 3 9 】

R^2 および R^3 は、それらが結合している $N - S(O)_n$ 基とともに、飽和もしくは不
 飽和でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$
 C_6 - アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い 5 から 7 員の環を形
 成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない)
 および窒素の群からの 1 以上の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニ
 ル基を含んでいても良く ; R^2 および R^3 は特に、それらが結合している $N - S(O)_n$
 基とともに、

【 0 0 4 0 】

【化 1 2】



の群からの基であっても良い (矢印はやはり、各場合で、 G^2 への結合を示すものである
))。

【 0 0 4 1 】

R^4 および R^5 はそれぞれ独立に、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ -、
 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキ
 ルチオ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニ

10

20

30

40

50

ル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル - または $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル置換されていても良い $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルおよび $C_2 - C_6$ - アルキニル、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - または $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルケニル（これらの環は、硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいても良い。）、各場合でハロゲン -、シアノ -（アルキル部分でのものを含む）、ニトロ -、 $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ -、ジ（ $C_1 - C_6$ - アルキル）アミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_2 - C_6$ - アルケニル -、 $C_2 - C_6$ - アルキニル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル - またはアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール - $C_1 - C_6$ - アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_6$ - アルキル、または $NR' R''$ （ R' および R'' はそれぞれ独立に水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルの群からの基である。）の群からの基である。
【0042】

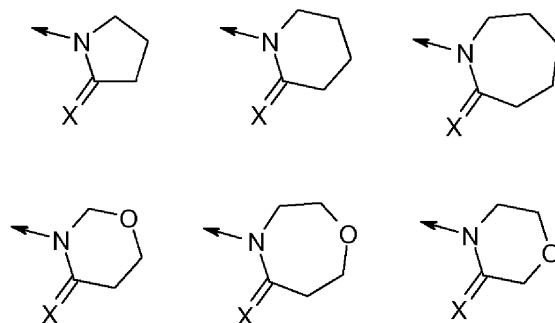
R^8 は、水素、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル - または $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル置換されていても良い $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、各場合でハロゲン -、 $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - または $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルケニル [これらの環は、硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいても良い。]、各場合でハロゲン -、シアノ -（アルキル部分でのものを含む）、ニトロ -、 $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ -、ジ（ $C_1 - C_6$ - アルキル）アミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_2 - C_6$ - アルケニル -、 $C_2 - C_6$ - アルキニル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_6$ - アルキル -、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル - またはアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール - $C_1 - C_6$ - アルキル、ヘテロアリール - $C_1 - C_6$ - アルキル、または $NR' R''$ （ R' および R'' はそれぞれ独立に水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルおよび $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルの群からの基である。）の群からの基である。

【 0 0 4 3 】

R^2 および R^4 はそれらが結合している N - C (X) 基とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン - 、 $C_1 - C_6$ - アルキル - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル - 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い5から7員の環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く； R^2 および R^4 は特に、それらが結合している N - C (X) 基とともに、

【 0 0 4 4 】

【 化 1 3 】



10

20

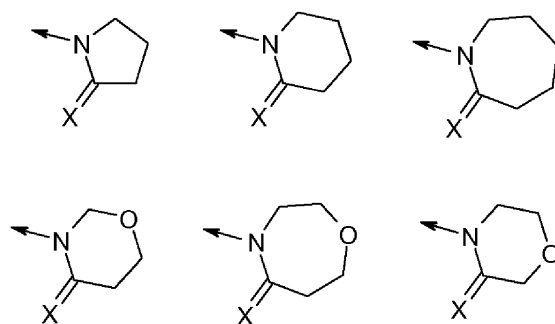
の群からの基であることができる（矢印はやはり各場合で、 G^2 への結合を示す。）。

【 0 0 4 5 】

R^2 および R^5 はそれらが結合している N - C (X) 基とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン - 、 $C_1 - C_6$ - アルキル - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル - 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い5から7員の環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く； R^2 および R^5 は特に、それらが結合している N - C (X) 基とともに、

【 0 0 4 6 】

【 化 1 4 】



30

40

の群からの基であることができる（矢印は各場合で、基 (L) における硫黄原子への結合を示す。）。

【 0 0 4 7 】

R^6 は水素または $C_1 - C_6$ - アルキルである。

【 0 0 4 8 】

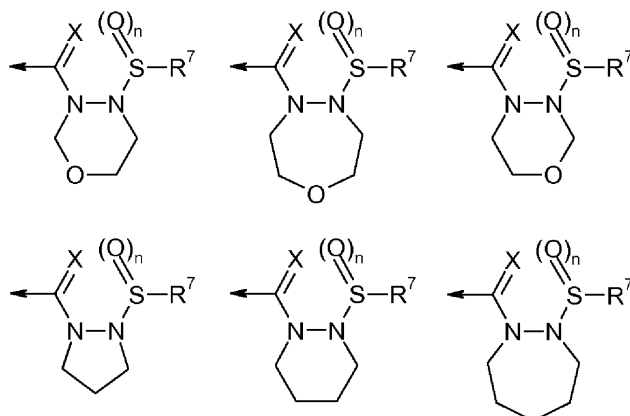
R^2 および R^6 はそれらが結合している窒素原子とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン - 、 $C_1 - C_6$ - アルキル - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル - 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い5から7員の環であっても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群か

50

らの少なくとも 1 個の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニル基を含むことができ ; R^2 および R^6 は特に、それらが結合している N - N 基とともに、

【 0 0 4 9 】

【 化 1 5 】



10

の群からの基であることができる (矢印はやはり、各場合で G^2 への結合を示す。)。

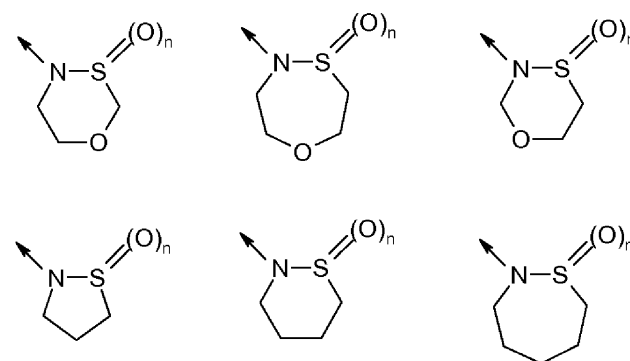
【 0 0 5 0 】

R^2 および R^7 は、 G^3 が (E) である場合、それらが結合している N - S (O) $_n$ 基とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン - 、 $C_1 - C_6$ - アルキル - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル - 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い 5 から 7 員の環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニル基を含むことができ ; R^2 および R^7 は特に、それらが結合している N - S (O) $_n$ 基とともに、

20

【 0 0 5 1 】

【 化 1 6 】



30

の群からの基であることができる (矢印は各場合で、C (X) 基への結合を示す。)。

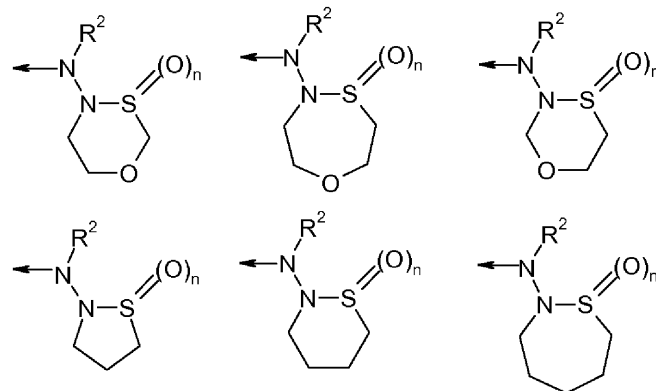
【 0 0 5 2 】

R^6 および R^7 は、 G^3 が (F) である場合、それらが結合している N - S (O) $_n$ 基とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン - 、 $C_1 - C_6$ - アルキル - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル - 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ置換されていても良い 5 から 7 員の環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素 (酸素原子同士は直接隣接してはならない) および窒素の群からの 1 以上の別のヘテロ原子および / または少なくとも 1 個のカルボニル基を含んでいても良く ; R^6 および R^7 は特に、それらが結合している N - S (O) $_n$ 基とともに、

40

【 0 0 5 3 】

【化 17】



10

の群からの基であることができる（矢印は書く場合で、C (X) 基への結合を示す。）。

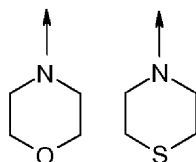
【0054】

R² および R⁸ は、それらが結合している窒素原子とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン -、C₁ - C₆ - アルキル -、C₁ - C₆ - ハロアルキル -、C₁ - C₆ - アルコキシ -、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ置換されていても良い5から7員の環を形成していても良く、その環は硫黄、酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および窒素の群からの1以上の別のヘテロ原子および/または少なくとも1個のカルボニル基を含んでいても良く； R² および R⁸ は特に、それらが結合している窒素原子とともに、

20

【0055】

【化 18】



の群からの基であることができる（矢印は書く場合で、基 (K) における硫黄原子への結合を示す。）。

30

【0056】

L は酸素または硫黄である。

【0057】

R⁹ および R¹⁰ はそれぞれ独立に各場合でハロゲン置換されていても良い C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルケニルオキシ、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₂ - C₆ - アルケニルチオ、フェノキシ、フェニルチオ、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリール - C₁ - C₆ - アルコキシおよびヘテロアリール - C₁ - C₆ - アルキルチオの群からの基である。

40

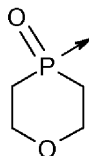
【0058】

R⁹ および R¹⁰ は、それらが結合しているリン原子とともに、飽和もしくは不飽和でハロゲン -、C₁ - C₆ - アルキル -、C₁ - C₆ - ハロアルキル -、C₁ - C₆ - アルコキシ -、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ置換されていても良い5から7員の環を形成していても良く、その環は酸素（酸素原子同士は直接隣接してはならない）および硫黄の群からの1個もしくは2個のヘテロ原子を含んでいても良く； R⁹ および R¹⁰ は特に、それらが結合しているリン原子とともに、下記の基：

【0059】

50

【化 19】



であることができる（矢印は基（G）における窒素原子への結合を示す。）。

【0060】

R¹¹ および R¹² はそれぞれ独立に、各場合でハロゲン -、C₁ - C₆ - アルキル -、C₁ - C₆ - ハロアルキル -、C₁ - C₆ - アルコキシ -、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ置換されていても良い C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、フェニルおよびフェニル - C₁ - C₆ - アルキルの群からの基である。

10

【0061】

式（I）の化合物で示された基についての特に好ましい置換基または範囲を下記に説明する。

【0062】

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

【0063】

A² は水素である。

20

【0064】

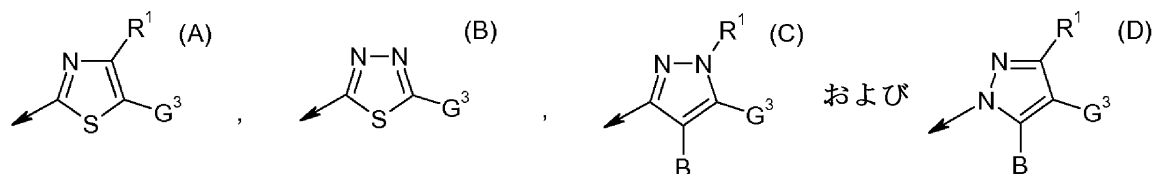
G¹ は N または C - A¹ であり、G¹ は特に N、C - H、C - F および C - Cl の群からの基である。

【0065】

G² は、

【0066】

【化 20】



30

の群からの基であり、矢印は隣接する環への結合を示す。

【0067】

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

【0068】

B は水素である。

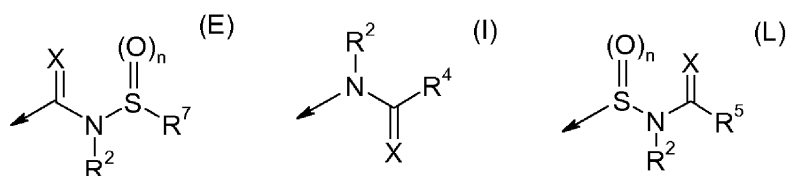
【0069】

G³ は、

40

【0070】

【化 21】



の群からの基であり、矢印は G² への結合を示し、基（E）および（L）は複素環（A）

50

、(B)、(C)および(D)と、基(I)は複素環(A)と組み合わせることができる。

【0071】

Xは酸素である。

【0072】

nは2である。

【0073】

R²は、水素、C₁-C₄-アルキルおよびC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ハロゲン置換されていても良いC₁-C₄-アルキルカルボニル、ハロゲン置換されていても良いC₁-C₄-アルコキシカルボニル、ハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルキル-およびシアノ置換されていても良いC₃-C₆-シクロアルキルカルボニル、またはカチオン、例えば1価もしくは2価の金属イオンまたはC₁-C₄-アルキル-またはアリール-C₁-C₄-アルキル置換されていても良いアンモニウムイオンの群からの基であり；R²は特には、水素、メチル、エチル、CH₂OCH₃、CH₂OCH₂CH₃、COCH₃、COCH₂CH₃、シクロプロピル、Na⁺、K⁺および⁺NMe₄の群からの基である。

10

【0074】

R⁴は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、ジ-C₁-C₄-アルキルアミノおよびヘテロアリール-C₁-C₄-アルキルの群からの基であり、R⁴は特にはメチル、エチル、イソプロピル、CH₂CF₃、CH₂CF₂CH₃、シクロプロピル、ジメチルアミノ、およびCH₂-(2-ピリミジル)の群からの基である。

20

【0075】

R⁵は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、ジ-C₁-C₄-アルキルアミノおよびヘテロアリール-C₁-C₄-アルキルの群からの基であり、R⁵は特にはメチル、エチル、イソプロピル、CH₂CF₃、CH₂CF₂CH₃、シクロプロピル、ジメチルアミノ、およびCH₂-(2-ピリミジル)の群からの基である。

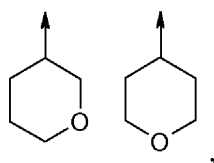
【0076】

R⁷は、各場合でハロゲン-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-、C₁-C₄-アルキルチオ-、C₁-C₄-ハロアルキルチオ-、C₁-C₄-アルキルスルフィニル-、C₁-C₄-ハロアルキルスルフィニル-、C₁-C₄-アルキルスルホニル-およびC₁-C₄-ハロアルキルスルホニル置換されていても良いC₁-C₄-アルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、各場合でハロゲン-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₁-C₄-アルコキシ-、C₁-C₄-ハロアルコキシ置換されていても良いC₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキルおよびC₃-C₄-シクロアルケニル[これらの環は硫黄、酸素(酸素原子同士は直接隣接してはならない)および窒素の群からの少なくとも1個のヘテロ原子を含んでいても良い(特には、

30

【0077】

【化22】



40

であり、矢印は書く場合で、基(E)における硫黄原子への結合を示す。)]、各場合でハロゲン-、シアノ-(アルキル部分でのものを含む)、ニトロ-、C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルキル-、C₃-C₆-シクロアルキル-、C₁-C₄-アル

50

コキシ -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ -、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ -、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルフィニル -、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル -、アミノ -、 $C_1 - C_4$ - アルキルアミノ -、ジ ($C_1 - C_4$ - アルキル) アミノ -、 $C_1 - C_4$ - アルキルカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_4$ - アルコキシカルボニルアミノ -、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル -、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル -、 $C_2 - C_4$ - アルケニル -、 $C_2 - C_4$ - アルキニル -、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル -、 $C_1 - C_4$ - アルキルカルボニル -、 $C_1 - C_4$ - アルコキシカルボニル - またはアミノカルボニル置換されていても良いアリール、ヘテロアリール、アリール - $C_1 - C_4$ - アルキルおよびヘテロアリール - $C_1 - C_4$ - アルキル、または $NR'R''$ (R' および R'' はそれぞれ独立に水素および $C_1 - C_4$ - アルキルの群からの基である。) の群からの基であり、 R^7 は特にはメチル、エチル、 i - プロピル、 CF_3 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CH_2CF_3 、シクロプロピル、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、フェニルおよびベンジルの群からの基である。

【0078】

好ましい定義において、別段の断りがない限り、

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

アリール (より大きい単位の一部としてのものを含む。例えばアリールアルキル) はフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの群から選択され、そして好ましくはフェニルであり、

ヘタリール (より大きい単位の一部としてのものを含む。例えばヘタリールアルキル) は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3 - トリアジニル、1, 2, 4 - トリアジニル、1, 3, 5 - トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンズイミダゾリル、2, 1, 3 - ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニルおよびインドリジニルの群から選択される。

【0079】

特に好ましい定義では、別段の断りがない限り、

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

アリール (より大きい単位の一部としてのものを含む。例えばアリールアルキル) は、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルの群から選択され、そして好ましくはフェニルであり、

ヘタリール (より大きい単位の一部としてのものを含む。例えばヘタリールアルキル) は、ピリミジル、オキサジアゾリル、オキサゾリル、ピラジニル、イミダゾリル、チアゾリルおよびフラニルの群から選択される。

【0080】

ハロゲン置換された基、例えばハロアルキルは、モノハロゲン化または最大数以下の可能な置換基で多ハロゲン化されている。多ハロゲン化の場合、そのハロゲン原子は同一であっても異なっても良い。この場合、ハロゲンはフッ素、塩素、臭素またはヨウ素、特にはフッ素、塩素または臭素である。

10

20

30

40

50

【 0 0 8 1 】

好ましいものおよび特に好ましいものは、それぞれ好ましいおよび特に好ましいと記載された置換基を有する化合物である。

【 0 0 8 2 】

アルキルまたはアルケニルなどの飽和または不飽和ヒドロカルビル基は各場合で、直鎖もしくは可能な範囲内で分岐していることができ、それには例えばアルコキシの場合のようにヘテロ原子との組み合わせも含まれる。

【 0 0 8 3 】

置換されていても良い基は、モノ置換または多置換されていることができ、多置換の場合の置換基は同一であっても異なっても良い。

10

【 0 0 8 4 】

G^2 が表すことができる基 (A)、(B)、(C) および (D) では、矢印は書く場合で、隣接する環への結合を示す。

【 0 0 8 5 】

一般的用語でまたは選好の範囲内での上記の基の定義または説明は、最終生成物およびそれに応じて原料および中間体に当てはまるものである。これらの基の定義は、所望に応じて互いに組み合わせることができる。すなわち個々の好ましい範囲間での組み合わせが含まれる。

【 0 0 8 6 】

本発明によれば、好ましいものとして上記で挙げた定義の組み合わせが存在する式 (I) の化合物が好ましいものである。

20

【 0 0 8 7 】

本発明によれば、特に好ましいものとして上記で挙げた定義の組み合わせが存在する式 (I) の化合物が特に好ましいものである。

【 0 0 8 8 】

本発明の化合物の強調される群において、 G^2 は基 (A) である。

【 0 0 8 9 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^2 は基 (B) である。

【 0 0 9 0 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^2 は基 (C) である。

30

【 0 0 9 1 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^2 は基 (D) である。

【 0 0 9 2 】

本発明の化合物の別の強調される基において、X は酸素である。

【 0 0 9 3 】

本発明の化合物の別の強調される基において、X は硫黄である。

【 0 0 9 4 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^1 は C - H である。

【 0 0 9 5 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^1 は C - F である。

40

【 0 0 9 6 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^1 は窒素である。

【 0 0 9 7 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 A^1 は水素である。

【 0 0 9 8 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 A^2 は水素である。

【 0 0 9 9 】

本発明の化合物の別の強調される基において、n は 2 である。

【 0 1 0 0 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 R^1 は水素である。

50

【 0 1 0 1 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 R^1 はメチルである。

【 0 1 0 2 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 R^1 はフッ素である。

【 0 1 0 3 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^3 は基 (E) である。

【 0 1 0 4 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^3 は基 (I) である。

【 0 1 0 5 】

本発明の化合物の別の強調される基において、 G^3 は基 (L) である。

10

【 0 1 0 6 】

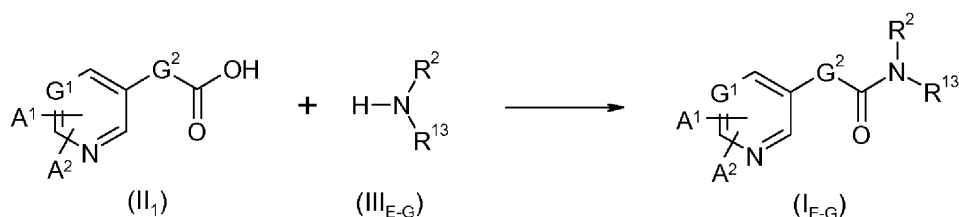
G^2 が基 (A) である本発明の式 (I) の化合物および相当する前駆体の製造について、下記の反応図式で説明する。

【 0 1 0 7 】

反応図式 1

【 0 1 0 8 】

【 化 2 3 】

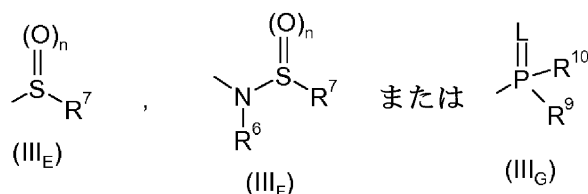


20

式中、 R^{1-3} は

【 0 1 0 9 】

【 化 2 4 】



30

である。

【 0 1 1 0 】

式 (I E - G) の化合物は、例えば式 (I I 1) の複素環カルボン酸または相当する酸塩化物を式 (I I I E - G) のアミン誘導体と反応させることで製造することができる。

【 0 1 1 1 】

原料として必要な G^2 が基 (A)、(B) および (C) を表す式 (I I 1) の酸は、は、WO 2 0 0 9 / 1 4 9 8 5 8 に記載の方法と同様にして製造することができる。

40

【 0 1 1 2 】

原料として必要な G^2 が基 (D) である式 (I I 1) の酸は、Journal of Heterocyclic Chemistry 1981, 18, 9-14 および Journal of Organic Chemistry 2004, 69, 5578-5587 で $G^1 = CH$ および $R^1 = H$ について記載の方法と同様にして製造することができる。

【 0 1 1 3 】

原料として必要な式 (I I I E - G) のアミン誘導体は公知であるか、基本的に公知の方法によって製造することができる。

【 0 1 1 4 】

50

活性化して例えば酸塩化物を得た後に（例えば *Bioorg & Med Chem Letters* 15, 4354 (2005) 参照）、または *DMAP*（ジメチルアミノピリジン；例えば、*J. Med. Chem.* 50, 3101 (2007) 参照）または *DCC*（ジシクロヘキシルカルボジイミド）の存在下に *HOBt*（1-ヒドロキシベンゾトリアゾール；例えば *J. Med. Chem.* 50, 3101 (2007) 参照）の存在下に *CDI*（カルボニルジイミダゾール；例えば *Bioorg & Med Chem* 9, 1543 (2001) 参照）、*EDC*（1-エチル-3-[3-ジメチルアミノプロピル]カルボジイミド塩酸塩）などの活性化試薬によって活性化した後に、適宜に金属水素化物（特には水素化ナトリウム）または *DBU*（ジアザビシクロウンデセン）などの塩基の存在下に、式（ II_1 ）の酸を式（ III_E ）のスルホンアミド類と反応させて、 X が酸素である式（ I_E ）の本発明の化合物を得ることができる。

10

【0115】

R^{13} について言及された別の基を、文献法によってまたはそれらの方法と同様にして、例えば *Chem. Letters* 36, 1370 (2007) または *J. Med. Chem.* 29, 1299 (1986) に従って式（ III_F ）の化合物を用いて、式（ II_1 ）の酸またはその酸塩化物から製造して式（ I_F ）の本発明の化合物を得ることができ、例えば *J. Org. Chem.* 72, 465 (2007) または *Phosphorus & Sulfur* 20, 93 (1984) に従って式（ III_G ）の化合物を用いて式（ I_G ）の本発明の化合物を得ることができる。

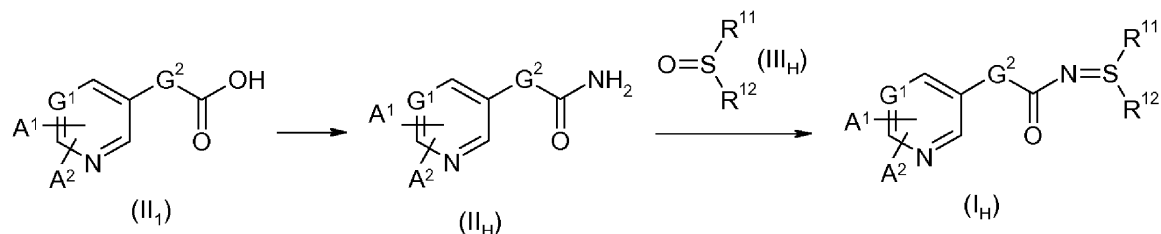
20

【0116】

反応図式 2

【0117】

【化25】



30

式（ I_H ）の化合物は、例えば文献法または同様の方法によって（例えば、*WO 2008/154528* 参照）式（ II_H ）の複素環カルボキサミドを式（ III_H ）のスルホキシドと反応させることで製造することができる。

【0118】

原料として必要な式（ II_H ）のカルボキサミドは、文献法または同様の方法によって、例えば *WO 2007/103755* または *US 2009/203657* に記載の方法に従って、酸（ II_1 ）またはその酸塩化物から製造することができる。

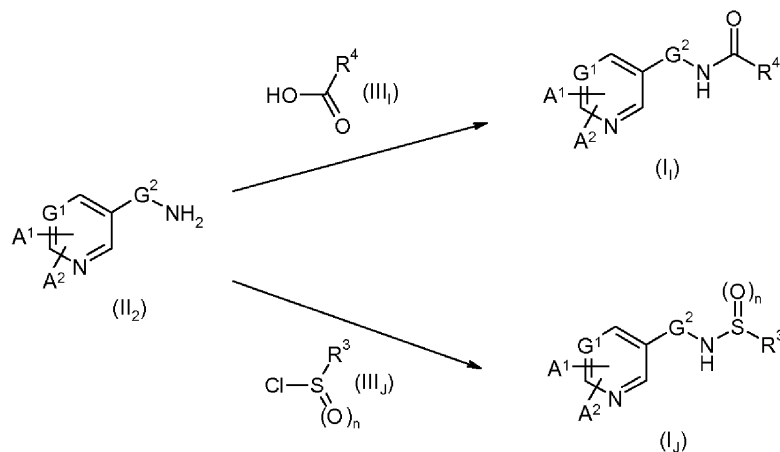
【0119】

反応図式 3

【0120】

40

【化 26】



10

Xが酸素である式(I_I)の化合物は、例えば式(II₂)の複素環アミンを式(I_I)のカルボン酸またはその酸塩化物と反応させることで製造することができる。

【0121】

原料として必要なG²が基(A)である式(II₂)の複素環アミンは、例えばUS 2006/14700、WO 2004/41813およびUS 4,528,291に記載の方法と同様にして製造することができる。

20

【0122】

原料として必要なG²が基(C)である式(II₂)の複素環アミンは、Bioorg. & Med. Chem. Lett. 1211-1214 (2000), J. Chem. Res. 227-249 (1992)およびSynth. Comm. 311-342 (1999)に記載の方法と同様にして製造することができる。

【0123】

原料として必要なG²が基(D)である式(II₂)の複素環アミンは、例えばJ. Het. Chem. 9-14 (1981)およびEur. J. Org. Chem. 695-709 (2004)に記載の方法と同様にして製造することができる。

30

【0124】

原料として必要な式(III_I)のカルボン酸は公知であるか、基本的に公知の方法によって製造することができる。

【0125】

式(III_I)の酸を酸塩化物に変換することができる。希釈剤、例えばジクロロメタンまたはテトラヒドロフラン中、そして塩基、例えばトリエチルアミンまたはジイソプロピルエチルアミンの存在下に式(II₂)のアミンとさらに反応させることで、Xが酸素である式(I_I)の本発明の化合物が得られる。式(I_I)の化合物は、カップリング剤、例えばEDC(1-エチル-3-[3-ジメチルアミノプロピル]カルボジイミド塩酸塩)、DCC(ジシクロヘキシルカルボジイミド)またはBOPCl(ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニルクロライド)の存在下に式(II₂)のアミンと反応させることで式(III_I)の酸から直接製造することもできる。

40

【0126】

式(I_J)の化合物は、例えばピリジンまたは水酸化ナトリウムなどの塩基の存在下に式(II₂)の複素環アミンを式(III_J)のスルホニルクロライドと反応させることで製造することができる(例えば、WO 2007/114532およびUS 2006/211603参照)。

【0127】

原料として必要な式(III_J)のクロロスルフィニルまたはクロロスルホニル誘導体は公知であるか、基本的に公知の方法によって製造することができる。

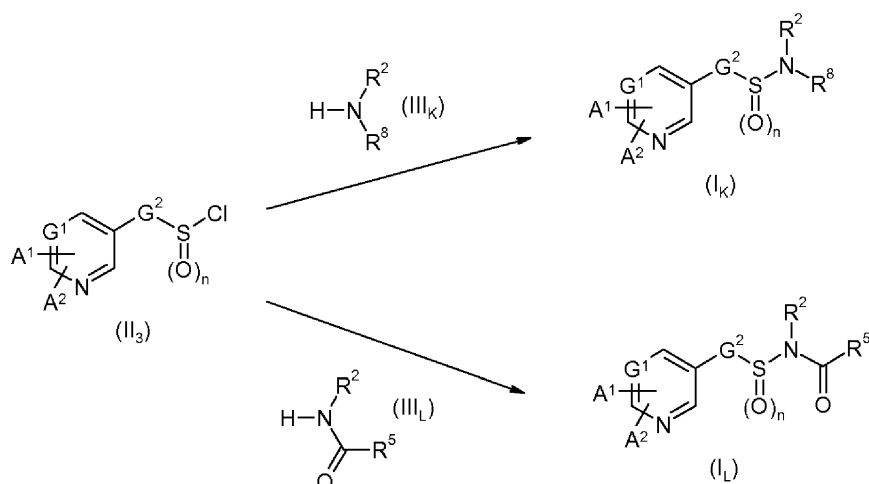
50

【 0 1 2 8 】

反応図式 4

【 0 1 2 9 】

【 化 2 7 】



10

式 (I_K) の化合物は、例えば US 6, 265, 411、WO 2007 / 114532 または US 6, 673, 817 に記載の方法と同様にして、適宜にピリジンまたはトリエチルアミンなどの塩基の存在下に、式 (II₃) のスルホニルクロライドを式 (II_K) のアミンと反応させることで製造することができる。

20

【 0 1 3 0 】

原料として必要な n が 2 であり、G² が基 (A) である式 (II₂) の複素環スルホニルクロライドは、例えば J. Het. Chem. 1017-1021 (1984), US 6, 555, 542 および US 2004 / 186134 に記載の方法と同様にして製造することができる。

【 0 1 3 1 】

原料として必要な n が 2 であり、G² が基 (B) である式 (II₂) の複素環スルホニルクロライドは、例えば J. Chem. Res. 768-769 (2003), Hetero. Com. 601-606 (2002), Eur. J. Med. Chem. 3340-3344 (2009), Heterocycles 2211-2224 (1983), Boll. Chim. Farma. 161-166 (2000) に記載の方法と同様にして製造することができる。

30

【 0 1 3 2 】

原料として必要な n が 2 であり、G² が基 (C) である式 (II₂) の複素環スルホニルクロライドは、例えば J. Het. Chem. 1017-1021 (1984) に記載の方法と同様にして製造することができる。

【 0 1 3 3 】

原料として必要な n が 2 であり、G² が基 (D) である式 (II₂) の複素環スルホニルクロライドは、例えば WO 2009 / 29439, US 6, 103, 708, WO 2005 / 97162, Bioorg. Med. Chem. 6628-6639 (2006), Heterocycles 1967-1974 (2007), Tet. Lett. 4026-4028 (2008), Russ. Chem. Bull. 2581-2584 (1996) に記載の方法と同様にして製造することができる。

40

【 0 1 3 4 】

原料として必要な式 (II_I) のアミンは、公知であるか基本的に公知である方法によって製造することができる。

【 0 1 3 5 】

50

Xが酸素である式(Ⅰ_L)の化合物は、例えば、水素化ナトリウムまたはn-ブチルリチウムなどの塩基の存在下に、US 2004/6143またはOrg. Let. 3458-3461(2009)に記載の方法と同様にして、式(Ⅰ_{I3})のスルホニルクロライドを式(Ⅰ_{IIL})のアミド類と反応させることで製造することができる。

【0136】

原料として必要な式(Ⅰ_{IIL})のアミドは、公知であるか基本的に公知の方法によって製造することができる。

【0137】

Xが硫黄である式(Ⅰ_{E-H})、(Ⅰ_I)および(Ⅰ_L)の化合物は、チオネート化試薬との反応により、Xが酸素である相当する式(Ⅰ_{E-H})、(Ⅰ_I)および(Ⅰ_L)の化合物から製造することができる。使用されるスルフィド化剤(チオネート化試薬)は好ましくはリン試薬であり、例えば五硫化ニリン(P₂S₅)、五硫化ニリン/ピリジン(P₂S₅/Py)、五硫化ニリン/トリエチルアミン(P₂S₅/NEt₃)、五硫化ニリン/炭酸水素ナトリウム(P₂S₅/NaHCO₃「シェーレン(Scheeren's)試薬」)またはより好ましくは2,4-ビス(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン「ローソン試薬(LR)」、2,4-ビス(4-フェノキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン「ベロー(Belleau's)試薬(BR)」または2,4-ビス(4-フェニルチオフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタンである。

【0138】

N-オキサイドは、例えば式(Ⅰ)の化合物をmCPBA(メタクロロ過安息香酸)と反応させることで得ることができる。式(Ⅰ)の化合物の塩は、式(Ⅰ)の化合物を式RXの化合物(Xは、例えば塩素または臭素などのハロゲンであり、Rは例えば、各場合で置換されていても良いアルキル、アルケニルまたはアルキニル基である。)と反応させることで得ることができる。

【0139】

植物が良好な耐性を示し、恒温動物毒性の面で好ましく、環境適合性の高い本発明の有効成分は、植物および植物器官を保護し、収穫量を増加させ、収穫物の品質を向上させ、有害動物、特に農業、園芸、畜産、森林、庭園およびレジャー施設、貯蔵製品および材料の保護、そして衛生部門で遭遇する昆虫、クモ類、蠕虫および軟体動物を防除するのに好適である。それらは好ましくは、作物保護組成物として用いることができる。それらは、通常のように感受性かつ抵抗性の動物種に対して、さらには全てもしくは一部の発達段階に対して活性である。上記の病害生物には、下記のものがある。

【0140】

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

【0141】

クモ(Arachnida)綱から、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、アセリア・シェルドニ(Aceria sheldoni)、アクロプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アンフィテトラニクス・ヴィエネンシス(Amp hitetranychus viennensis)、アルガス属種(Argas spp.)、ボーフィラス属種(Boophilus spp.)、ブレビパルプス属種(Brevipalpus spp.)、ブリオビア・プラエティオサ(Bryobia praetiosa)、コリオプテス属種(Chorioptes spp.)、デルマニサス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、エオテトラニクス属種(Eotetranychus spp.)、エピトリメルス・ピリ(Epitrim

10

20

30

40

50

erus pyri)、エウテトラニクス属種(Eutetranychus spp.)、エリオフィエス属種(Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属種(Hemitarsonemus spp.)、ヒアロンマ属種(Hyalomma spp.)、イクソデス属種(Ixodes spp.)、ラトロデクツス・マクタンズ(Latrodectus mactans)、メタテトラニクス属種(Metatetranychus spp.)、ヌフェルサ属種(Nuphersa spp.)、オリゴニクス属種(Oligonychus spp.)、オルニトドロス属種(Ornithodoros spp.)、パノニカス属種(Panonychus spp.)、フィロコプトルタ・オレイボラ(Phyllocoptruta oleivora)、ポリファゴタルソネムス・ラタス(Polyphagotarsonemus latus)、ソロプテス属種(Psoroptes spp.)、リピセファラス属種(Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属種(Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属種(Sarcoptes spp.)、スコルピオ・マウルス(Scorpio maurus)、ステノタルソネムス属種(Stenotarsonemus spp.)、タルソネムス属種(Tarsonemus spp.)、テトラニカス属種(Tetranychus spp.)、ヴァサテス・リコベルシキ(Vasates lycopersici)。

【0142】

ニマイガイ(Bivalva)綱からは、例えば、ドレイセナ属種(Dreissena spp.)。

【0143】

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

【0144】

鞘翅(Coleoptera)目から、例えば、アカントセリデス・オブテクツス(Acanthoscelides obtectus)、アドレタス属種(Adoretus spp.)、アゲラスティカ・アルニ(Agelastica alni)、アグリオテス属種(Agriotes spp.)、アムフィマロン・ソルスチチアリス(Amphimallon solstitialis)、アノビウム・プンクタツム(Anobium punctatum)、アノプロフォラ属種(Anoplophora spp.)、アンソノマス属種(Anthonomus spp.)、アンスレナス属種(Anthrenus spp.)、アポゴニア属種(Apogonia spp.)、アトマリア属種(Atomaria spp.)、アタゲナス属種(Attagenus spp.)、ブルキディウス・オブテクタス(Bruchidius obtectus)、ブルーカス属種(Bruchus spp.)、セウトリンカス属種(Ceutorhynchus spp.)、クレオヌス・メンディクス(Cleonus mendicus)、コノデルス属種(Conoderus spp.)、コスモポリテス属種(Cosmopolites spp.)、コステリトラ・ジーランドイカ(Costelytra zealandica)、クルクリオ属種(Curculio spp.)、クリプトリンカス・ラパチ(Cryptorhynchus lapathi)、デルメステス属種(Dermestes spp.)、ジアブロティカ属種(Diabrotica spp.)、ファウスティヌス・クバエ(Faustinus cubae)、ギビウム・ブシロイデス(Gibbium psylloides)、ヘテロニカス・アラトル(Heteronychus arator)、ヒラモルファ・エレガンス(Hylamorphia elegans)、ヒロトルベス・バユルス(Hylotrupes bajulus)、ヒペラ・ポスティカ(Hypera postica)、ハイPOSEネムス属種(Hypothenemus spp.)、ラクノステルナ・コンサンギニア(Lachnosterna consanguinea)、レプチノタルサ・デセムリネータ(Leptinotarsa decemlineata)、リソロプトルス・オリゾフィルス(Lissorhopterus oryzophilus)、リクス属種(L

10

20

30

40

50

ixus spp.)、リクツス属種 (Lyctus spp.)、メリゲテス・アエネアス (Meligethes aeneus)、メロロンタ・メロロンタ (Melolontha melolontha)、ミグドルス属種 (Migdolus spp.)、モノカムス属種 (Monochamus spp.)、ナウパクツス・キサソグラフス (Naupactus xanthographus)、ニプツス・ホロレウクス (Niptus hololeucus)、オリクテス・リノセロス (Oryctes rhinoceros)、オリザエフィルス・スリナメンシス (Oryzaephilus surinamensis)、オチオリンクス・スルカツス (Otiorrhynchus sulcatus)、オキシセトニア・ジユクンダ (Oxycetonia jucunda)、フェドン・コクレアリアエ (Phaedon cochleariae)、フィロファガ属種 (Phyllophaga spp.)、ポピリア・ジャポニカ (Popillia japonica)、プレムノトリペス属種 (Premnotrypes spp.)、プシリオデス・クリソセファラ (Psylliodes chrysocephala)、プチナス属種 (Ptinus spp.)、リゾビウス・ヴェントラリス (Rhizobius ventralis)、リゾペルタ・ドミニカ (Rhizophorthera dominica)、シトフィラス属種 (Sitophilus spp.)、スフェノフォラス属種 (Sphenophorus spp.)、ステルネクス属種 (Sternechus spp.)、シンフィレテス属種 (Symphyletes spp.)、テネブリオ・モリター (Tenebrio molitor)、トリボリウム属種 (Tribolium spp.)、トロゴデルマ属種 (Trogoderma spp.)、チキアス属種 (Tychius spp.)、キシロトレカス属種 (Xylotrechus spp.)、ザブラス属種 (Zabrus spp.)。

10

20

【0145】

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

【0146】

革翅目 (Dermaptera) から、例えばフォルフィクラ・アウリクラリア (Forficula auricularia)。

【0147】

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

30

【0148】

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

40

50

、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)、タンニア属種 (*Tannia* spp.)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、ウォールファルチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.)。

【0149】

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

10

【0150】

蠕虫綱 (*helminth*) から、例えば、アンシロストーマ・デュオデナール (*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストーマ・ケイラニクム (*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストーマ・ブラジリエンシス (*Ancylostoma braziliensis*)、アンシロストーマ属種 (*Ancylostoma* spp.)、アスカリス・ルブリコイデス (*Ascaris lumbricoides*)、アスカリス属種 (*Ascaris* spp.)、ブルギア・カライイ (*Brugia malayi*)、ブルギア・ティモリ (*Brugia timori*)、ブノストムム属種 (*Bunostomum* spp.)、カベルティア属種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属種 (*Clonorchis* spp.)、クーペリア属種 (*Cooperia* spp.)、ディクロコエリウム属種 (*Dicrocoelium* spp.)、ジクチオルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、ジフィロピスリウム・レイタム (*Diphyllobothrium latum*)、ドラカンキュラス・メディネンシス (*Dracunculus medinensis*)、エチノコッカス・グラニューロサス (*Echinococcus granulosus*)、エチノコッカス・マルチロキュラリス (*Echinococcus multilocularis*)、エンテロビウス・ベルミクラリス (*Enterobius vermicularis*)、ファキオラ属種 (*Faciola* spp.)、ヘモンクス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)、ヒメノレプシス・ナナ (*Hymenolepis nana*)、ヒョストロングス属種 (*Hyostrongylus* spp.)、ロア・ロア (*Loa Loa*)、ネマトディルス属種 (*Nematodirus* spp.)、エソファゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オピスソルキス属種 (*Opisthorchis* spp.)、オンコセルカ・ボブバルス (*Onchocerca volvulus*)、オステルタギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラゴニウムス属種 (*Paragonimus* spp.)、スキスオソメン属種 (*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロニロイデス属種 (*Strongyloides* spp.)、タエニア・サギナータ (*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム (*Taenia solium*)、トリキネラ・スピラリス (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナティバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトーヴィ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソーニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・シュードプシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリキュリス・トリキュリア (*Trichuris trichuria*)、バンクロフト糸条虫 (*Wuchereria bancrofti*)。

20

30

40

【0151】

アイメリア (*Eimeria*) のような原虫を防除することも可能である。

50

【0152】

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

【0153】

同翅 (*Homoptera*) 目から、例えば、アキルトシポン属種 (*Acyrthosipon* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノスケナ属種 (*Agonosцена* spp.)、アレウローデス属種 (*Aleurodes* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロスリンクス属種 (*Aleurothrixus* spp.)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、アヌラフィス・カルドゥイ (*Anuraphis cardui*)、アオニディエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、アフアノスティグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属種 (*Aphis* spp.)、アルボリディア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アスピディエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピディオトウス属種 (*Aspidiotus* spp.)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルサム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア属種 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウデウス・ヘリクリシ (*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*)、カリギボナ・マルギナータ (*Calligypona marginata*)、カルネオセファラ・フルギーダ (*Carneocephala fulgida*)、ケラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、ケルコピダエ (*Cercopidae*)、ケロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシフォン・フラガエフォリ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピシス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキ (*Chlorita onukii*)、クロマフィス・ジュグランディコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカルデュリナ・ムビラ (*Cicadulina*

10

20

30

40

50

mbila)、ココミティルス・ハリ(Coccomytilus halli)、コクス属種(Coccus spp.)、クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、ダルブルス属種(Dalbulus spp.)、ディアロイローデス属種(Dialeurodes spp.)、ディアフォリーナ属種(Diaphorina spp.)、ディアスピス属種(Diaspis spp.)、ドロシカ属種(Drosicha spp.)、ディサフィス属種(Dysaphis spp.)、ディスマニコックス属種(Dysmicoccus spp.)、エンボアスカ属種(Empoasca spp.)、エリオソマ属種(Eriosoma spp.)、エリスロニューラ属種(Erythroneura spp.)、ユーセリス・ビロバタス(Euscelis bilobatus)、ゲオコッカス・コフェアエ(Geococcus coffeae)、ホマロディスカ・コアグラータ(Homalodisca coagulata)、ヒアロプテルス・アルンディニス(Hyalopterus arundinis)、イセリア属種(Icerya spp.)、イディオケルス属種(Idiocerus spp.)、イディオスコプス属種(Idioscopus spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス(Laodelphax striatellus)、レカニウム属種(Lecanium spp.)、レピドサフェス属種(Lepidosaphes spp.)、リパフィス・エリシミ(Lipaphis erysimi)、マクロシフム属種(Macrosiphum spp.)、マハナルヴァ・フィムブリオラタ(Mahanarva fimbriolata)、メラナフィス・サッカリ(Melanaphis sacchari)、メトカルフィエラ属種(Metcalfiella spp.)、メトポロフィウム・ディロズム(Metopolophium dirhodum)、モネリア・コスタリス(Monellia costalis)、モネリオプシス・ペカニス(Monelliopsis pecanisi)、ミズス属種(Myzus spp.)、ナソノビア・リビスニグリ(Nasonovia ribisnigri)、ネホテティクス属種(Nephotettix spp.)、ニラバルバータ・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)、パラベミシア・ミリカエ(Parabemisia myricae)、パトリオーザ属種(Paratrioza spp.)、パルラトリア属種(Parlatoria spp.)、ペンフィガス属種(Pemphigus spp.)、ペレグリヌス・マイデイス(Peregrinus maidis)、フェナコッカス属種(Phenacoccus spp.)、フロエオミズス・パセリニイ(Phloeomyzus passerinii)、フォロドン・フミリ(Phorodon humuli)、フィロクセラ属種(Phylloxera spp.)、ピナスピス・アスピディストラエ(Pinnaspis aspidistrae)、プラノコッカス属種(Planococcus spp.)、プロトパルピナリア・ピリフォルミス(Protopulvinaria pyriformis)、シュードオーラカスピス・ペンタゴナ(Pseudaulacaspis pentagona)、シュードコッカス属種(Pseudococcus spp.)、プシラ属種(Psylla spp.)、プテロマルス属種(Pteromalus spp.)、ピリラ属種(Pyrilla spp.)、クアドラスピディオツス属種(Quadraspidiotus spp.)、ケサーダ・ギガス(Quesada gigas)、ラストロコッカス属種(Rastrococcus spp.)、ロパロシファム属種(Rhopalosiphum spp.)、サイセティア属種(Saissetia spp.)、スカホイデス・ティタヌス(Scaphoides titanus)、スキザフィス・グラミナム(Schizaphis graminum)、セレナスピツス・アルティキュラツス(Selenaspis articulatus)、ソガータ属種(Sogatata spp.)、ソガテラ・フリシフェラ(Sogatella furcifera)、スガトーデス属種(Sogatodes spp.)、スティクトセファラ・フェスティナ(Stictoccephala festina)、テナラファラ・マレイエンシス(Tenala

phara malayensis)、チノカリス・カリアエフォリアエ(Tinocal-
lis caryaefoliae)、トマスビス属種(Tomaspis spp.
)、トキシプテラ属種(Toxoptera spp.)、トリアロイロデス・バボラリ
オルム(Trialeurodes vaporariorum)、トリオーザ属種(T-
rioza spp.)、チフロシバ属種(Typhlocyba spp.)、ユナブ
シス属種(Unaspis spp.)、ビテウス・ビティフォリ(Viteus vi-
tifolii)。

【0154】

ハチ(Hymenoptera)目から、例えば、アタリア属種(Athalia s-
pp.)、ディプリオン属種(Diprion spp.)、ホブロキャンパ属種(Ho-
plocampa spp.)、ラシウス属種(Lasius spp.)、モノモリウ
ム・ファラオニス(Monomorium pharaonis)およびベスパ属種(Vespa
spp.)。

10

【0155】

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

【0156】

シロアリ(Isoptera)目から、例えば、レティキュリテルメス属種(Reti-
culitermes spp.)およびオドントテルメス属種(Odontoterm-
es spp.)。

20

【0157】

チョウ(Lepidoptera)目から、例えば、アクロニクタ・メジャー(Acr-
onicta major)、アエディア・リユーコメラス(Aedia leucom-
elas)、アグロチス属種(Agrotis spp.)、アラバマ・アルギラセア(A-
labama argillacea)、アンティカルシア属種(Anticarsia
spp.)、バラスラ・ブラッシカエ(Barathra brassicae)、
ブキュラトリクス・スルベリエラ(Bucculatrix thurberiella)
、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、カコエシア・ボ
ダナ(Cacoecia podana)、カプア・レティクラーナ(Capua re-
ticulana)、カルボカブサ・ポモネラ(Carpocapsa pomonel-
la)、ケイマトビア・ブルマータ(Cheimatobia brumata)、チロ
属種(Chilo spp.)、コリストネウラ・フミフェラナ(Choristone-
ura fumiferana)、クリシア・アンビグエラ(Clysia ambig-
uella)、クナファロケルス属種(Cnaphalocerus spp.)、エア
リアス・インスラナ(Earias insulana)、エフェスチア・クエフニエラ
(Ephestia kuehniella)、ユープロクティス・クリソロエア(Eu-
proctis chrysorrhoea)、ユークソア属種(Euxoa spp.)
、フェルティア属種(Feltia spp.)、ガレリア・メロネラ(Galler-
ia mellonella)、ヘリコベルパ属種(Helicoverpa spp.)
、ヘリオシス属種(Heliothis spp.)、ホフマノフィラ・シュードスブ
レテラ(Hofmannophila pseudospretella)、ホモナ・マ
グナニマ(Homona magnanima)、ヒボノメウタ・パデラ(Hypono-
meuta padella)、ラフィグマ属種(Laphygma spp.)、リソ
コレティス・ブランカルデラ(Lithocolletis blancardella)
、リトファン・アンテナータ(Lithophane antennata)、ロクサ
グロティス・アルピコスタ(Loxagrotis albicosta)、リマントリ
ア属種(Lymantria spp.)、マラコソマ・ニューストリア(Malaco-
soma neustria)、マメストラ・ブラッシカエ(Mamestra bra-
ssicae)、モキス・レバンダ(Mocis repanda)、ミチムナ・セバラ

30

40

50

ータ (*Mythimna separata*)、オリア属種 (*Oria spp.*)、オウレマ・オリゼア (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、ペクチノフォラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、フィロクニスティス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、ピエリス属種 (*Pieris spp.*)、ブルテラ・キシロステラ (*Plutella xylostella*)、プロデニア属種 (*Prodenia spp.*)、シュードアレティア属種 (*Pseudaletia spp.*)、シュードブルシア・インクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubilalis*)、スポドプテラ種 (*Spodoptera spp.*)、テルメシア・ゲマトリス (*Thermesia gemmatalis*)、ティネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、ティネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリクス・ビリダナ (*Tortrix viridana*)、トリコブルシア属種 (*Trichoplusia spp.*)。

【0158】

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

【0159】

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

【0160】

コムカデ (*Symphyla*) 目から、例えば、スクティゲレラ・インマクラタ (*Scutigerebella immaculata*)。

【0161】

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

【0162】

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

【0163】

植物性寄生性線虫として、例えば、アングイナ属種 (*Anguina spp.*)、アフエレンコイデス属種 (*Aphelenchoides spp.*)、ベロノアイムス属種 (*Belonoaimus spp.*)、ブルサフェレンカス属種 (*Bursaphelenchus spp.*)、ディチレンカス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、グロボデラ属種 (*Globodera spp.*)、ヘリオコチレンク

10

20

30

40

50

ス属種 (*Helioctylenchus* spp.)、ヘテロデラ属種 (*Heterodera* spp.)、ロンギドラス属種 (*Longidorus* spp.)、メロイドジン属種 (*Meloidogyne* spp.)、プラティレンカス属種 (*Pratylenchus* spp.)、ラドフォラス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンキウス属種 (*Rotylenchus* spp.)、トリコドラス属種 (*Trichodorus* spp.)、チレンコリンキウス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、チレンキュラス属種 (*Tylenchulus* spp.)、チレンキュラス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.) が挙げられる。

【0164】

10

本発明の化合物は、ある一定の濃度または施用量で、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤または植物の性質を改善する薬剤として、または殺微生物剤として、例えば殺菌剤、抗真菌薬、殺細菌剤、殺ウィルス剤（ウィロイドに対する薬剤を含む）として、またはMLO（マイコプラズマ様微生物）およびRLO（リケッチア様微生物）に対する薬剤として用いることもできる。それらは、別の有効成分の合成における中間体および前駆体として用いることもできる。

【0165】

その有効成分は、液剤、乳濁液、水和剤、水系および油系懸濁液、粉剤、ダスト剤、ペースト、可溶性粉末、可溶性粒剤、散布用粒剤、懸濁乳濁濃縮液、有効成分を含浸させた天然物質、有効成分を含浸させた合成物質、肥料およびポリマー基材中のマイクロカプセルなどの一般的な製剤に変換することができる。

20

【0166】

これらの製剤は、公知の方法で、例えば、適宜に界面活性剤、すなわち乳化剤および/または分散剤および/または発泡剤を用いて、有効成分と増量剤、即ち、液体溶媒および/または固体担体とを混和することで製造される、その製剤は、好適なプラントその他で、施用の前または施用時に調製される。

【0167】

使用される補助剤は、組成物自体および/またはそれに由来する製剤（例えば噴霧液、種子粉衣）に対して、ある種の技術的特性および/または特定の生理特性を与える上で好適な物質であることができる。代表的な補助剤には、増量剤、溶媒および担体などがある。

30

【0168】

好適な増量剤は、例えば、水、極性および非極性の液体有機化学物質、例えば芳香族および非芳香族系の炭化水素基（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、クロロベンゼン類など）、アルコール類および多価アルコール類（置換、エーテル化および/またはエステル化されていても良い）、ケトン類（アセトン、シクロヘキサノンなど）、エステル類（脂肪およびオイルなど）および（ポリ）エーテル類、置換されていないおよび置換されたアミン類、アミド類、ラクタム類（N-アルキルピロリドン類など）およびラクトン類、スルホン類およびスルホキシド類（ジメチルスルホキシドなど）の群からのものである。

40

【0169】

使用される増量剤が水である場合、例えば、補助溶媒として有機溶媒を用いることも可能である。有用な液体溶媒には実質的には、キシレン、トルエンまたはアルキルナフタレン類などの芳香族、クロロベンゼン類、クロロエチレン類または塩化メチレンなどの塩素化芳香族および塩素化脂肪族炭化水素基、シクロヘキサノンまたはパラフィン類などの脂肪族炭化水素基、例えば石油留分、鉱油および植物油、ブタノールもしくはグリコールなどのアルコール類およびそれらのエーテル類およびエステル類、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトンもしくはシクロヘキサノンなどのケトン類、ジメチルスルホキシドなどの強極性溶媒および水などがある。

【0170】

50

有用な固体担体には、

例えば、アンモニウム塩およびカオリン類、粘土類、タルク、チョーク、石英、アタパ
ルガイト、モンモリロナイトまたは珪藻土などの天然岩粉および微粉碎シリカ、アルミナ
およびシリケート類などの合成岩粉などがあり；粒剤用の有用な固体担体には、例えば方
解石、大理石、軽石、海泡石およびドロマイトなどの破碎および分別された天然岩石なら
びに無機および有機ミールの合成顆粒および紙、おがくず、ヤシ殻、トウモロコシ穂軸お
よびタバコ茎などの有機材料の顆粒などがあり；有用な乳化剤および／または発泡剤には、
例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエ
ーテル類、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
、硫酸アルキル類、アリールスルホネート類およびタンパク質加水分解物などのノニオン
系およびアニオン系乳化剤などがあり；好適な分散剤は、ノニオン系および／またはイオ
ン性物質、例えばアルコール - P O E - および／または - P O P - エーテル類、酸および
／または P O P - P O E エステル類、アルキルアリールおよび／または P O P - P O E エ
ーテル類、脂肪 - および／または P O P - P O E 付加物、P O E - および／または P O P
- 多価アルコール誘導体、P O E - および／または P O P - ソルビタン - または - 糖付加
物、硫酸アルキルもしくはアリール類、アルキル - またはアリールスルホネート類および
リン酸アルキルもしくはアリール類または相当する P O - エーテル付加物の群からのもの
である。さらに好適なものは、オリゴマーまたはポリマー、例えばビニル系モノマーから
、アクリル酸から、E O および／または P O から誘導されたもの単独または例えば（ポリ
）アルコール類もしくは（ポリ）アミン類と組み合わせたものである。リグニンおよびそ
れのスルホン酸誘導体、未変性および変性セルロース、芳香族および／または脂肪族スル
ホン酸類、さらにはホルムアルデヒドとの付加物を用いることも可能である。

10

20

【 0 1 7 1 】

カルボキシメチルセルロース、粉末、顆粒またはアラビアガム、ポリビニルアルコール
およびポリビニルアセテートなどのラテックスの形態での天然および合成ポリマー類、ま
たはケファリン類およびレシチン類などの天然リン脂質および合成リン脂質などの粘着付
与剤を製剤で用いることができる。

【 0 1 7 2 】

無機顔料、例えば酸化鉄、酸化チタンおよびブルシアンブルーなどの色素およびアリザ
リン染料、アゾ染料および金属フタロシアニン染料などの有機染料および鉄、マンガ
ン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの微量栄養素を用いることが可能
である。

30

【 0 1 7 3 】

別の添加剤は、芳香剤、無機物または野菜、変性されていても良いオイル類、ロウ類お
よび鉄、マンガ
ン、ホウ素、銅、コバルト、モリブデンおよび亜鉛の塩などの栄養素（微
量栄養素など）であることができる。

【 0 1 7 4 】

別の成分は、低温安定剤などの安定剤、保存剤、酸化防止剤、光安定剤または化学的お
よび／または物理的安定性を改善する他の薬剤であることができる。

【 0 1 7 5 】

40

適切であれば、製剤およびそれから誘導される使用形態は、さらに別の補助剤を含ん
でいても良い。そのような添加剤の例には、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、チキ
ソトロップ剤、浸透剤、保持促進剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、保湿剤、展着剤などが
ある。概して有効成分は、製剤目的に一般的に使用されるあらゆる固体もしくは液体添加
剤と組み合わせることができる。

【 0 1 7 6 】

有用な保持促進剤には、例えば、スルホコハク酸ジオクチルなどの動的表面張力を低下
させるか、ヒドロキシプロピルグアールポリマーなどの粘弾性を高める全ての物質などがあ
る。

【 0 1 7 7 】

50

本発明の文脈での有用な浸透剤は、代表的には活性農芸化学化合物の植物中への浸透を改善するのに用いられる全ての物質である。この文脈で、浸透剤は、（一般的には水系）施用液からおよび／または噴霧コーティングから植物の角質層に浸透することで、角質層での有効成分の移動性を高める能力によって定義される。文献（Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152）に記載の方法を用いて、この特性を確認することができる。例としては、例えばヤシ脂肪族エトキシレート（10）またはイソトリデシルエトキシレート（12）などのアルコールアルコキシレート類、菜種油メチルエステルもしくは大豆油メチルエステル類などの脂肪酸エステル類、タローアミンエトキシレート（15）などの脂肪族アミンアルコキシレート類または硫酸アンモニウムまたはリン酸水素二アンモニウムなどのアンモニウム塩および／またはホスホニウム塩などがある。

10

【0178】

製剤は、0.01から98重量%の有効成分、好ましくは0.5から90%を含む。

【0179】

本発明の有効成分は、その市販の製剤で、そしてその製剤から調製される使用形態で、殺虫剤、誘引剤、滅菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、薬害軽減剤、肥料または情報物質などの他の有効成分との混合物として存在させることができる。

【0180】

除草剤、肥料、成長調節剤、薬害軽減剤、情報物質、または植物の性質を改善するための薬剤などの他の公知の有効成分との混合物も可能である。

20

【0181】

殺虫剤として用いる場合、本発明の有効成分は、その市販製剤で、そしてその製剤から調製される使用形態で、共力剤との混合物として存在させることもできる。共力剤は、その共力剤自体が活性である必要はなく、有効成分の作用を高める化合物である。

【0182】

殺虫剤として使用する場合、本発明の有効成分は、その市販製剤で、そしてその製剤から調製される使用形態で、植物の環境、植物部分の表面上または植物組織での使用後に有効成分の分解を防止する阻害剤との混合物として存在させることもできる。

【0183】

市販製剤から調製される使用形態の有効成分含有量は、広い範囲で変動し得るものである。施用形態の有効成分濃度は、0.00000001から95重量%の有効成分、好ましくは0.00001から1重量%であることができる。

30

【0184】

当該化合物は、その使用形態に適した一般的な方法で施用する。

【0185】

本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することができる。植物はこの場合、望ましいおよび望ましくない野生植物または作物（天然作物を含む。）のような全ての植物および植物集団を意味するものと理解される。作物は、従来の品種改良および至適化法によって、またはバイオテクノロジーおよび遺伝子工学法によって、またはこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であることができ、遺伝子導入植物を含み、植物育種家の権利によって保護され得るおよび保護され得ない植物品種を含む。植物部分は、芽、葉、花および根のような植物の全ての地上および地下部分および器官を意味するものと理解すべきであり、例として、葉、針葉、茎、幹、花、子実体、果実および種子、そして根、塊茎および地下茎などがある。また、植物部分には、収穫物ならびに栄養増殖物および生殖増殖物、例えば、苗木、塊茎、地下茎、挿し木および種子などもある。

40

【0186】

植物および植物部分の有効成分による本発明の処理は、直接行うか、通例の処理方法、例えば、浸漬、噴霧、蒸発、霧化、散布、塗布、注入によって、増殖物の場合、特に種子の場合は、1以上のコーティングを塗布することによって、周辺、生息環境または保存場

50

所に成分を作用させることによって行う。

【0187】

すでに上述したように、本発明に従って、全ての植物および植物部分を処理することが可能である。好ましい実施形態では、野生植物種および植物栽培品種、または異種交配もしくはプロトプラスト融合のような従来の生物育種方法によって得られたもの、ならびにこれらの部分を処理する。さらに好ましい実施形態では、遺伝子工学、適切な場合は、従来の方法と組み合わせて得られた遺伝子導入植物および植物品種（遺伝的改変生物）、ならびにこれらの部分を処理する。「部分」、「植物の部分」および「植物部分」という用語については、すでに上記で説明している。

【0188】

より好ましくは、それぞれ市販されているか使用されている植物品種の植物を、本発明に従って処理する。植物品種とは、従来の品種改良、突然変異誘発または組換えDNA技術によって得られた、新規な特徴（「形質」）を有する植物を意味するものと理解される。これらは、栽培品種、生物型または遺伝子型であることができる。

【0189】

植物種または植物品種ならびにそれらの場所および成長条件（土壌、天候、生育期間、栄養）によっては、本発明の処理は、超加算的（「相乗」）効果をもたらすこともある。例えば、可能性としては、施用量の低減および/または活性スペクトルの拡大および/または本発明に従って使用することができる物質および組成物の活性の向上、植物成長の改善、高温もしくは低温に対する耐性の向上、干魃または水もしくは土壌の塩分のレベルに対する耐性向上、開花能の向上、収穫の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、収穫物の品質向上および/または栄養価の上昇、収穫物の貯蔵期間延長および/または加工性の向上などがあり、それは通常予想される効果を超えるものである。

【0190】

本発明に従って好ましく処理されるべき遺伝子導入植物または植物品種（遺伝子工学によって得られるもの）には、遺伝子組み換えによって、これらの植物に特に有利で有用な特性（形質）を付与する遺伝物質が与えられた全ての植物などがある。このような特性の例には、植物成長の改善、高温または低温に対する耐性向上、干魃または水もしくは土壌の塩分のレベルに対する耐性の向上、開花能の向上、収穫の簡易化、成熟の加速、収穫高の増大、収穫物の品質の向上および/または栄養価の上昇、収穫物の貯蔵期間の延長および/または加工性の向上がある。このような特性のさらなる、特に強調される例は、昆虫、ダニ、植物病原性真菌、細菌および/またはウイルスのような有害動物および有害微生物に対する植物の防御力の向上、ならびにある種の除草活性有効成分に対する植物の耐性向上である。遺伝子導入植物の例としては、穀物（小麦、米）、トウモロコシ、大豆、ジャガイモ、甜菜、トマト、エンドウ豆および他の植物種、綿、タバコ、菜種のような重要作物、および果物植物（リンゴ、ナシ、かんきつ類およびブドウの果実）などがあり、特に強調されるべきものはトウモロコシ、大豆、ジャガイモ、綿、タバコおよび菜種である。特に強調される形質は、植物中で形成される毒素、特に、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）由来の遺伝物質によって（例えば、遺伝子CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3BbおよびCryIF、ならびにこれらの組み合わせによって）植物中で形成される毒素による、昆虫、クモ類、線虫、ナメクジおよびカタツムリに対する植物の防御力の向上である（以下、「Bt植物」と称する）。また、特に重視される形質は、全身獲得抵抗性（SAR）、システミン、フィトアレキシン類、エリシター類および耐性遺伝子、および対応して発現したタンパク質および毒素による真菌、細菌およびウイルスに対する植物の防御力の向上である。さらに特に重視される形質は、ある種の活性除草成分、例えば、イミダゾリノン類、スルホニル尿素類、グリホサートまたはホスフィノトリシンに対する植物の耐性の増大である（例えば、「PAT」遺伝子）。所望の対象形質を付与する遺伝子は、遺伝子導入植物中で相互に組み合わせて存在させることも可能である。「Bt植物」の例としては、YI

10

20

30

40

50

ELD GARD (登録商標) (例えばトウモロコシ、綿、大豆)、KnockOut (登録商標) (例えばトウモロコシ)、StarLink (登録商標) (例えばトウモロコシ)、Bollgard (登録商標) (綿)、Nucotn (登録商標) (綿) および NewLeaf (登録商標) (ジャガイモ) の商品名で販売されているトウモロコシ品種、綿品種、大豆品種およびジャガイモ品種などがある。除草剤耐性植物の例として、Roundup Ready (登録商標) (グリホサートに対する耐性、例えばトウモロコシ、綿、大豆)、Liberty Link (登録商標) (ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば菜種)、IMI (登録商標) (イミダゾリノン類に対する耐性) および STS (登録商標) (スルホニル尿素に対する耐性、例えばトウモロコシ) の商品名で販売されているトウモロコシ品種、綿品種および大豆品種がある。言及することができる除草剤耐性植物 (除草剤耐性を与えるために従来 방식으로品種改良された植物) には、Clearfield (登録商標) (例えばトウモロコシ) の名称で販売されている品種などがある。当然のことながら、これらの記述は、これらの遺伝形質または現在もなお開発されるべき、そして将来開発されおおよそ / または市場に出回ることになる遺伝形質を有する植物品種についても当てはまる。

10

【0191】

上記で挙げた植物は、一般式 (I) の化合物および / または本発明による有効成分混合物を用いて特に有利な方法で、本発明に従って処理することができる。有効成分または混合物についての上述の好ましい範囲は、これら植物の処理にも適用される。特に強調されるものは、本明細書に具体的に記載された化合物または混合物による植物の処理である。

20

【0192】

本発明の有効成分は、植物、衛生および貯蔵製品の有害生物に対して作用するだけでなく、カタダニ、軟ダニ、キュウセンヒゼンダニ、ハダニ、ハエ (刺咬および舐め)、寄生性ハエ幼虫、シラミ、毛ジラミ、咬むシラミおよびノミなどの動物寄生生物 (外寄生生物または内部寄生生物) に対する動物薬部門でも作用する。これらの寄生生物には下記のものなどがある。

【0193】

シラミ目 (Anoplura) からのもの、例えば、ヘマトピナス属種 (Haematopinus spp.)、リノグナサス属種 (Linognathus spp.)、ペディキュラス属種 (Pediculus spp.)、フチラス属種 (Phthirus spp.)、ソレノポテス属種 (Solenopotes spp.)。

30

【0194】

ハジラミ目 (Mallophaga) ならびにマルツノハジラミ亜目 (Amblycerina) およびホソツノハジラミ亜目 (Ischnocerina) からのもの、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.)、ウエルネッキエラ属種 (Werneckiella spp.)、レピケントロン属種 (Lepikentron spp.)、ダマリナ属種 (Damalina spp.)、トリコデクテス属種 (Trichodectes spp.) およびフェリコラ属種 (Felicola spp.)。

40

【0195】

双翅目 (Diptera)、およびならびにネマトセリナ亜目 (Nematocerina) およびブラキセリナ亜目 (Brachycerina) からのもの、例えば、イーデス属種 (Aedes spp.)、アノフェレス属種 (Anopheles spp.)、キュレックス属種 (Culex spp.)、シムリウム属種 (Simulium spp.)、ユーシムリウム属種 (Eusimulium spp.)、フレボトムス属種 (Phlebotomus spp.)、ルツゾミヤ属種 (Lutzomyia spp.)、キュリコイデス属種 (Culicoides spp.)、クリソプス属種 (Chrysops spp.)、ヒボミトラ属種 (Hybomitra spp.)、アチロータス属種 (Atylotus spp.)、タバヌス属種 (Tabanus s

50

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

10

【0196】

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

20

【0197】

カメムシ目 (*Heteropterida*) からのもの、例えば、シメックス属種 (*Cimex* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロンギラス属種 (*Panstrongylus* spp.)。

【0198】

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

30

【0199】

アカリ亜綱 (*Acarina*) (*Acarina*) ならびにメタスチグマタ目 (*Metastigmata*) およびメソスチグマタ目 (*Mesostigmata*) からのもの、例えば、アルガス属種 (*Argas* spp.)、オルニトドラス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、イクソデス属種 (*Ixodes* spp.)、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、ブーフィラス属種 (*Boophilus* spp.)、デルマセントール属種 (*Dermacentor* spp.)、ヘモフィサリス属種 (*Haemophysalis* spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、リピセファラス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニサス属種 (*Dermanyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)、ニューモニサス属種 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストーマ属種 (*Sternostoma* spp.) およびバロア属種 (*Varroa* spp.)。

40

【0200】

ケダニ目 (*Actiniedida*) (プロスチグマタ (*Prostigmata*)) およびコナダニ目 (*Acaridida*) (アスチグマタ (*Astigmata*)) からのもの、例えば、アカラピス属種 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属種 (*Cheyletiella* spp.)、オルニソケイレチア属種 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属種 (*Myobia* spp.)、プソレルゲーツ属種 (*Psorergates* spp.)、デモデックス属種 (*Demodex* sp

50

p.)、トロンビキュラ属種 (*Trombicula* spp.)、リストロホラス属種 (*Listrophorus* spp.)、アカラス属種 (*Acarus* spp.)、チロファガス属種 (*Tyrophagus* spp.)、カログリファス属種 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属種 (*Hypodectes* spp.)、プテロリカス属種 (*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属種 (*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属種 (*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.)。

10

【0201】

式 (I) の本発明の有効成分は、例えばウシ、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ブタ、ロバ、ラクダ、バッファロー、ウサギ、ニワトリ、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウおよびミツバチ等の農業用家畜、例えばイヌ、ネコ、愛玩鳥、観賞魚等などの他のペット、そして例えばハムスター、モルモット、ラットおよびマウス等の実験動物を攻撃する節足動物を防除するのに好適である。これらの節足動物の防除は、死亡例を低減し、(肉、ミルク、羊毛、皮、卵、蜂蜜等の)生産性低下を軽減を意図したものであることから、本発明の有効成分を用いることで、さらに経済的かつ簡易に動物を飼育することが可能となる。

【0202】

本発明の有効成分は、獣医学および畜産の部門で公知の方法で、錠剤、カプセル、頓服、水薬、粒剤、ペースト、ボラス、飼料を介した方法もしくは坐剤の形態での腸内投与により、例えば注射 (筋肉注射、皮下注射、静脈注射、腹腔内注射など)、インプラントなどの非経口投与によって、経鼻投与によって、例えば浸漬または液浸、噴霧、滴下 (pouring on) および点投与 (spotting on)、洗浄および散粉の形での皮膚投与によって、さらには有効成分、首輪、耳標、尾標、足輪、端網、印付け用具などの有効成分を含む成型品を用いて使用される。

20

【0203】

家畜、家禽、ペット等に使用される場合には、式 (I) の有効成分は、有効成分を 1 から 80 重量 % の量で含む製剤 (例えば、粉剤、乳濁液、フロアブル剤) として、直接もしくは 100 から 10000 倍希釈後に用いることが可能であり、あるいはそれらは薬浴として使用できる。

30

【0204】

本発明の化合物が工業材料を破壊する昆虫に対して強い殺虫作用を有することも見出されている。

【0205】

好ましい例には下記の昆虫などがあるが、これらに限定されるものではない。

【0206】

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

40

50

ec.）、トリプトデンドロン属種（*Tryptodendron spec.*）、アパテ・モナクス（*Apate monachus*）、ボストリクス・カプシンス（*Bostrychus capucins*）、ヘテロボストリクス・ブルネウス（*Heterobostrychus brunneus*）、シノキシロン属種（*Sinoxylon spec.*）、ジノデルス・ミヌツス（*Dinoderus minutus*）；

ハサミムシ類（*dermapterans*）、例えば、シレキス・ジュベックス（*Sirex juvencus*）、ウロセルス・ギガス（*Urocerus gigas*）、ウロセルス・ギガス・タイグヌス（*Urocerus gigas taignus*）、ウロセルス・アウグル（*Urocerus augur*）；

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

シミ類（*bristletails*）、例えば、レピスマ・サッカリナ（*Lepisma saccharina*）。

【0207】

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、紙および厚紙、皮革、木材、加工木材製品、ならびに、コーティング組成物などを意味するものと理解される。

【0208】

即時使用組成物には、適切な場合には、他の殺虫剤および適宜に1以上の殺菌剤も含ませて良い。

【0209】

可能な追加の混合相手に関しては、上記で挙げた殺虫剤および殺菌剤を挙げることができる。

【0210】

同時に本発明の化合物は、塩水または淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備および信号システムなどを、付着物から保護するのに使用することもできる。

【0211】

さらに、本発明の化合物は、単独でまたは他の有効成分と組み合わせて、汚れ止め組成物として用いることができる。

【0212】

当該有効成分は、家庭内分野、衛生分野および貯蔵物保護における有害動物、特に例えば住居、工場のホール、オフィス、車両室内などの密閉空間で見られる昆虫、クモ類およびダニ類を防除するのにも好適である。それらは、単独でまたは家庭用殺虫剤製品中の他の有効成分および補助剤と組み合わせて使用することで、これら有害生物を防除することができる。それらは、感受性種および抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての発達段階に対して有効である。これらの有害生物としては、以下のものなどがある。

【0213】

スコルピオニデア目（*Scorpionidea*）から、例えば、ブツス・オッシタヌス（*Buthus occitanus*）。

【0214】

ダニ目（*Acarina*）から、例えば、アルガス・ペルシクス（*Argas pers*

10

20

30

40

50

sicus)、アルガス・レフレキスス(Argas reflexus)、ブリオピア属種(Bryobia ssp.)、デルマニスス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、グリシファグス・ドメスチクス(Glyciphagus domesticus)、オルニトドルス・モウバト(Ornithodoros moubat)、リピセファルス・サングイネウス(Rhipicephalus sanguineus)、トロムビクラ・アルフレズゲシ(Trombicula alfreddugesi)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス(Neutrombicula autumnalis)、デルマトファゴイデス・プテロニシムス(Dermatophagoides pteronissimus)、デルマトファゴイデス・ホリナエ(Dermatophagoides forinae)。

10

【0215】

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

【0216】

ザトウムシ目(Opiliones)から、例えば、プセウドスコルピオネス・ケリフェル(Pseudoscorpiones chelifer)、プセウドスコルピオネス・ケイリジウム(Pseudoscorpiones cheiridium)、オピリオネス・ファランギウム(Opiliones phalangium)。

【0217】

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

20

【0218】

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

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

【0219】

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

30

【0220】

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

40

【0221】

サルタトリア目(Saltatoria)から、例えば、アケタ・ドメスチクス(Achetia domesticus)。

【0222】

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

【0223】

シロアリ目(Isoptera)から、例えば、カロテルメス属種(Kaloterme

50

es spp.)、レチクリテルメス属種 (Reticulitermes spp.)
。

【0224】

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

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

【0225】

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

【0226】

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

【0227】

ノミ目 (Siphonaptera) から、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)、ксеノブシラ・ケオピス (Xenopsylla cheopis)。

【0228】

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

10

20

30

40

50

【0229】

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

【0230】

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

10

【0231】

家庭用殺虫剤の分野においては、それらは、単独で使用するか、他の好適な有効成分、例えば、リン酸エステル系、カーバメート系、ピレスロイド系、ネオニコチノイド系、成長調節剤または他の既知の種類の殺虫剤から選択される有効成分と組み合わせて使用する。

【0232】

それらは、エアロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレーおよび噴霧スプレー、自動霧化システム、噴霧器、泡剤、ゲル、セルロース製もしくはポリマー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、ゲルおよび膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、無動力型 (energy-free) すなわち受動型蒸発システム、防虫紙 (moth papers)、防虫バッグ (moth bags) および防虫ゲル (moth gels) で、粒剤もしくは粉剤として、ばらまき用の餌で、または餌ステーションで使用される。

20

【0233】

製造例

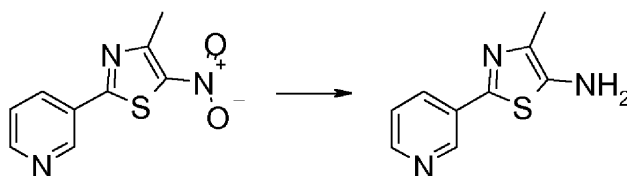
実施例 A : 3, 3, 3 - トリフルオロ - N - [4 - メチル - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - イル] プロパンアミド

段階 1 : 4 - メチル - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 5 - アミン

【0234】

【化28】

30



3 - (4 - メチル - 5 - ニトロ - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル) ピリジン 10 . 1 g (45 . 6 mmol) (製造については、DE 2 2 2 1 6 4 7 を参照) を 10 % 塩酸 100 mL + 濃塩酸 10 mL に溶かし、10 % 塩酸に溶かした塩化スズ (II) 25 g を少量ずつ加え、混合物を 1 時間攪拌したら、その間に発熱が生じた。混合物を氷 / 水酸化ナトリウム溶液に投入し、メチル t - ブチルエーテル、酢酸エチルおよび飽和塩化ナトリウム溶液を加え、混合物を pH = 10 で酢酸エチルによって 4 回抽出し、合わせた有機相を $MgSO_4$ で脱水し、混合物を濃縮した。残留物をベンゾトリフルオリドから再結晶した。

40

【0235】

収量 : 7 . 27 g (理論値の 79 %)。

【0236】

1H NMR (D_6 - DMSO) : 2 . 2 (s, 3 H)、5 . 4 (s, 2 H)、7 . 45 (dd, 1 H)、7 . 95 (d, 1 H)、8 . 55 (m, 1 H)、8 . 85 (s, 1 H)。

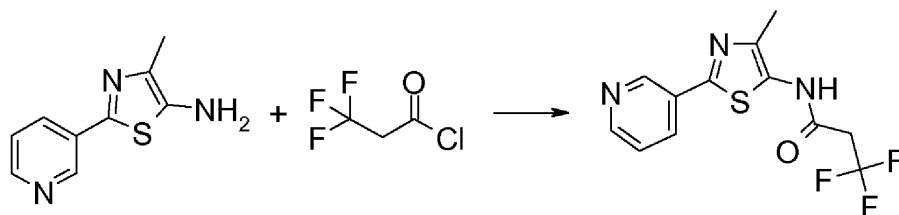
50

【 0 2 3 7 】

段階 2 : 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - N - [4 - メチル - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル] プロパンアミド

【 0 2 3 8 】

【 化 2 9 】



10

4 - メチル - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 5 - アミン 2 8 6 m g (1 . 4 9 m m o l) を T H F に溶かし、トリエチルアミン 0 . 5 2 m L を加え、氷浴で冷却しながらトリフルオロプロピオニルクロライド 2 6 3 m g を加えた。混合物を室温で終夜攪拌し、濃縮した。酢酸エチル、飽和塩化ナトリウム溶液およびリン酸緩衝水溶液 $pH = 7$ を残留物に加え、水相を酢酸エチルで 2 回抽出し、合わせた有機相を Na_2SO_4 で脱水し、濃縮した。残留物をクロマトグラフィー (シリカゲル、シクロヘキサン、アセトン) によって精製した。

【 0 2 3 9 】

20

収量 : 3 0 8 m g (理論値の 6 8 %)、 $\log P (HCOOH)$ 1 . 4 7。

【 0 2 4 0 】

1H NMR (CD_3CN) : 2 . 4 (s、3 H)、3 . 4 5 (q、2 H)、7 . 4 (dd、1 H)、8 . 1 5 (d、1 H)、8 . 5 5 (m、1 H)、8 . 9 (br、1 H)、9 . 0 5 (s、1 H)。

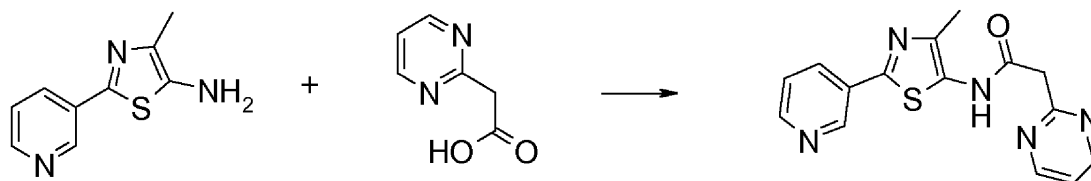
【 0 2 4 1 】

実施例 B : N - [4 - メチル - 2 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 5 - イル] - 2 - (ピリミジン - 2 - イル) アセトアミド

【 0 2 4 2 】

【 化 3 0 】

30



2 - ピリミジル酢酸 2 5 0 m g (1 . 8 1 m m o l)、ジイソプロピルエチルアミン 3 . 0 4 g (2 3 . 5 m m o l) および B o p クロライド 2 5 4 . 5 m g (2 . 1 7 m m o l) を、アセトニトリル 5 m L 中にて室温で 2 0 分間攪拌し、前記アミノチアゾール 5 5 3 m g (2 . 1 7 m m o l) を加え、混合物をさらに 1 2 時間攪拌した。

40

【 0 2 4 3 】

後処理のため、反応混合物を濃縮して 2 から 3 m L とし、シリカゲルでのカラムクロマトグラフィー (溶離液 : ジクロロメタン) によって精製した。

【 0 2 4 4 】

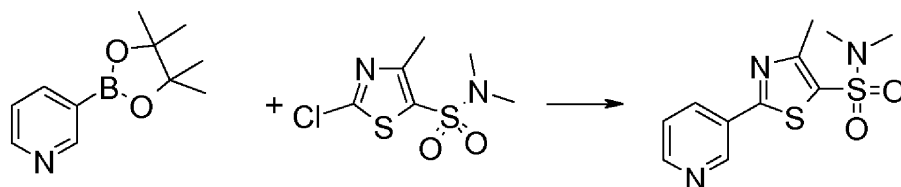
収量 : 1 0 m g (理論値の 2 %)、 $\log P^{1)}$ ($HCOOH$) 0 . 7 4。

【 0 2 4 5 】

1H NMR ((CD_3) $_2SO$) : 2 . 4 5 (s、3 H)、4 . 1 4 (s、2 H)、7 . 3 5 - 9 . 0 5 (m、7 H) p p m。

【 0 2 4 6 】

【化 3 1】



ピリジル - 3 - ボロン酸エステル 112.8 mg (0.55 mmol)、クロロチアゾール化合物 120.4 mg (0.50 mmol) および 1, 1' - ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンパラジウム(II)クロライド 18.3 mg (0.02 mmol) を最初にアルゴン下でジメトキシエタン 10 mL 中に入れ、2 M 炭酸カリウム溶液 0.75 mL を加え、混合物を 80 °C で 16 時間撹拌した。

10

【0247】

後処理のため、混合物を水と酢酸エチルとの間で分配し、有機相を脱水し、濃縮し、シリカゲルでのカラムクロマトグラフィー(溶離液: ジクロロメタン)によって精製した。

【0248】

収量: 60 mg (理論値の 40%)、 $\log P^{(1)}$ (HCOOH) 1.86。

【0249】

^1H NMR ((CD₃)₂SO): 2.67 (s, 3H)、2.81 (s, 6H)、7.55 (m, 1H)、8.32 (m, 1H)、8.72 (m, 1H)、9.05 (m, 1H) ppm。

20

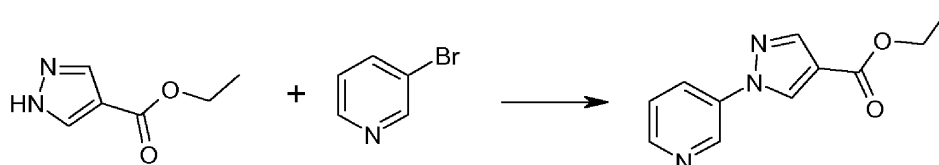
【0250】

実施例 D: N - (ジメチルスルファモイル) - 1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド

段階 1: 1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル

【0251】

【化 3 2】



30

3 - ブロモピリジン 0.412 mL (4.28 mmol) をジメチルホルムアミド 2 mL に溶かした。その後、炭酸カリウム 1.035 g (7.49 mmol)、ヨウ化銅 0.034 g (0.017 mmol)、トランス - N, N' - ジメチル - 1, 2 - シクロヘキサジアミン 0.081 g (0.71 mmol) およびピラゾール - 4 - カルボン酸エチル 0.500 g (5.371 mmol) を加えた。混合物を加熱して 110 °C として 24 時間経過させ、冷却して室温とした。水を加え、生成した沈澱を濾過した。

【0252】

収量: 600 mg (理論値の 77%)、 $\log P^{(1)}$ (HCOOH) 1.55。

40

【0253】

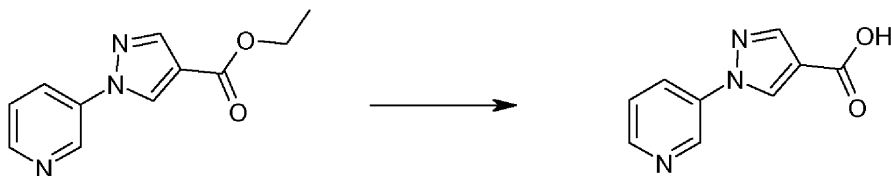
^1H NMR ((CD₃)₂SO): 1.31 (t, 3H)、4.29 (q, 2H)、7.57 - 7.60 (m, 1H)、8.20 (s, 1H)、8.31 - 8.34 (m, 1H)、8.61 (bs, 1H)、9.19 (bs, 2H) ppm。

【0254】

段階 2: 1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸

【0255】

【化 3 3】



1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸エチル 9 . 1 0 g (4 1 . 8 m m o l) をジオキサン 1 7 0 m L に溶かし、水 1 7 m L および 4 5 % 水酸化ナトリウム水溶液 8 . 9 4 g を加えた。混合物を還流下に 5 時間加熱した。溶液を冷却して

10

【 0 2 5 6 】

収量：7 . 5 4 g (理論値の 9 5 %)、log P¹⁾ (H C O O H) 0 . 5 0。

【 0 2 5 7 】

¹ H N M R ((C D ₃) ₂ S O) : 7 . 5 5 (m、1 H)、8 . 0 8 (s、1 H)、8 . 2 8 (m、1 H)、8 . 5 7 (m、1 H)、8 . 9 8 (s、1 H)、9 . 1 3 (m、1 H) p p m。

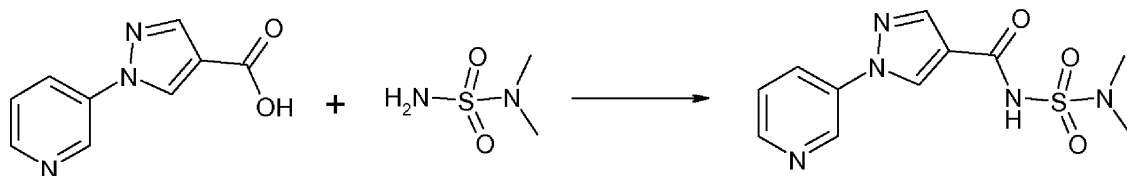
【 0 2 5 8 】

段階 3 : N - (ジメチルスルファモイル) - 1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド

20

【 0 2 5 9 】

【化 3 4】



1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 0 . 2 5 0 g (1 . 3 2 m m o l) を最初にテトラヒドロフラン 5 m L に入れ、N , N' - カルボニルジイミダゾール 0 . 4 3 m L (1 . 9 8 m m o l) を加えた。混合物を還流下に 1 時間加熱した。N , N - ジメチルスルホンアミド 0 . 2 4 6 g (1 . 9 8 m m o l) をテトラヒドロフラン 3 m L に溶かし、室温で最初の溶液に滴下した。混合物を室温で 1 0 分間攪拌した。1 , 8 - ジアザビシクロ (5 , 4 , 0) ウンデク - 7 - エン 0 . 3 0 m L (1 . 9 8 m m o l) を加えた後、混合物を室温で 1 2 時間攪拌した。溶媒をロータリーエバポレータで除去し、水を残留物に加えた。水相をジクロロメタンで抽出した。有機相を廃棄し、水相を濃 H C l で酸性とした。生成した沈澱を吸引濾過した。

30

【 0 2 6 0 】

収量：0 . 1 2 0 g (理論値の 3 0 %)、log P¹⁾ (H C O O H) 1 . 0 3。

40

【 0 2 6 1 】

¹ H N M R ((C D ₃) ₂ S O) : 2 . 8 9 (s、6 H)、7 . 5 8 - 7 . 6 2 (m、1 H)、8 . 2 4 - 8 . 2 7 (m、1 H)、8 . 3 8 (s、1 H)、8 . 6 0 - 8 . 6 2 (m、1 H)、9 . 1 0 - 9 . 1 1 (m、1 H)、9 . 2 2 (s、1 H) p p m。

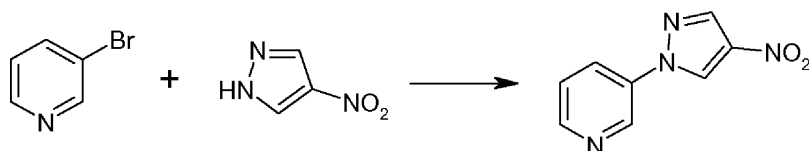
【 0 2 6 2 】

実施例 E : 1 , 1 - ジフルオロ - N - [1 - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] メタンサルホンアミド

段階 1 : 3 - (4 - ニトロ - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン

【 0 2 6 3 】

【化 3 5】



火炎加熱してアルゴン充填しておいたフラスコに最初に、酸化銅 8.3 g (56.6 mmol)、サリチルアルドキシム 31.9 g (228 mmol)、4-ニトロ-1H-ピラゾール 200 g (1.71 mol) および炭酸セシウム 597 g (1.83 mol) を入れた。フラスコを繰り返し排気し、アルゴンを充填した。ロータリーエバポレータで脱気しておいた 3-ブロモピリジン 218 g (800 mmol) および DMF 1 リットルを加えた。反応混合物を 130 で終夜攪拌し、冷却し、濾過し、DMF をロータリーエバポレータで除去した。取得物を酢酸エチル 1 リットルに溶かし、H₂O 2 リットルで抽出した。水相を酢酸エチル 500 mL で 2 回抽出した。水相の濾過によって、緑色固体を得た。酢酸エチル 1 リットルおよび DMF 100 mL をそれに加え、混合物を加熱して 50 とした。冷却し、次に Hyflo によって濾過し、酢酸エチル 500 mL で洗浄した。濾液を水 300 mL および飽和 NaCl 溶液 300 mL で洗浄し、Na₂SO₄ で脱水し、濾過し、濃縮した。固体を酢酸エチル 100 mL に懸濁させ、濾過し、酢酸エチルおよびメチル tert-ブチルエーテルで洗浄し、そのベージュ固体 (45 g) をロータリーエバポレータで乾燥させた。

【0264】

合わせた有機相を NaHCO₃ 溶液 (5%) 500 mL で 2 回、水 500 mL および飽和 NaCl 溶液 300 mL で洗浄した。有機相を Na₂SO₄ で脱水し、濾過し、濃縮して粘稠スラリーを得た。酢酸エチル 500 mL、塩酸 (2 M) 630 mL および水 500 mL をそれに加えた。濾過後、水相を酢酸エチル 250 mL で 2 回洗浄し、1 M 水酸化ナトリウム溶液を用いて pH 10 から 11 に調節し、終夜静置した。固体を濾過し、水で洗浄して中性とし、ロータリーエバポレータにてジオキサンと 2 回共留去した。褐色固体が得られた (59 g)。

【0265】

収量: 104 g (理論値の 40%)。

【0266】

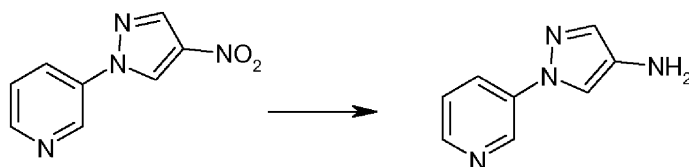
¹H NMR ((CD₃)₂SO): 7.65 (m, 1H)、8.38 (m, 1H)、8.63 (s, 1H)、8.66 (m, 1H)、9.20 (s, 1H)、9.79 (s, 1H) ppm。

【0267】

段階 2: 1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-アミン

【0268】

【化 3 6】



3-(4-ニトロ-1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン 98.9 g (520 mmol) を温ジオキサン 1.3 リットルに溶かし、排気およびアルゴン充填を 2 回行った。アンモニアのメタノール中溶液 500 mL (約 7 mol / リットル) を加え、混合物について再度、排気およびアルゴン充填を 2 回行った。ラネーニッケル (含水スラリー) 27.5 g を加え、混合物の排気およびアルゴン充填を 2 回行い、さらに排気および水素充填を 3 回行った。懸濁液を水素風船下に終夜攪拌した。追加のラネーニッケル 32 g を加え、

混合物を水素雰囲気下にさらに24時間撹拌した。水素雰囲気をアルゴンと交換し、反応混合物をHyfloで濾過し、ジオキサン500mLで洗浄した。濾液をロータリーエバポレータで濃縮し、HV（高真空）下に乾燥させた。得られた褐色油状物を冷蔵庫で結晶化させた。粗取得物を酢酸エチル750mLに溶かし、活性炭20gを加え、混合物を50℃で30分間撹拌した。濾過後、活性炭を再度加え、混合物を再度50℃で30分間撹拌した。Hyfloによる濾過を行い、次に濃縮して約250gとした。ジイソプロピルエーテル350mLを加え、混合物を室温で撹拌した。固体を濾過し、ジイソプロピルエーテルおよびヘプタンで洗浄した。ロータリーエバポレータでの乾燥によってベージュ固体を得た。

【0269】

10

収量：54.7g（理論値の66%）。

【0270】

^1H NMR ($(\text{CD}_3)_2\text{SO}$) : 4.24 (s, 2H)、7.36 (s, 1H)、7.43 (m, 1H)、7.79 (m, 1H)、8.06 (m, 1H)、8.40 (m, 1H)、8.96 ppm (s, 1H) ppm。

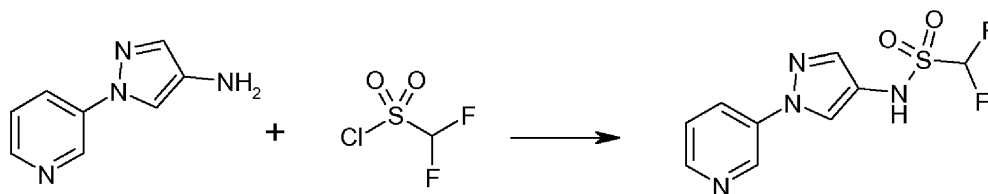
【0271】

段階3：1, 1-ジフルオロ-N-[1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-イル]メタンスルホンアミド

【0272】

【化37】

20



1-(ピリジン-3-イル)-1H-ピラゾール-4-アミン250mg（1.56mmol）を最初にジクロロメタン4mLに入れ、N-メチルモルホリン343μL（3.12mmol）を加え、混合物を冷却して-78℃とした。次にジフルオロメタンスルホニルクロライド235mg（1.56mmol）を加え、反応混合物を終夜放冷して室温とした。次に、追加のジフルオロメタンスルホニルクロライド235mg（1.56mmol）を加え、反応混合物を室温で6時間撹拌した。反応混合物をシリカゲルで濾過し、ジクロロメタンおよび酢酸エチルで洗浄した。TLCによって調べた後、酢酸エチル相を濃縮し、シリカゲルでのクロマトグラフィーによって精製した。

30

【0273】

収量：124mg（29%理論値の）、log P¹⁾ (HCOOH) 1.01。

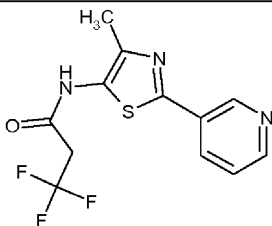
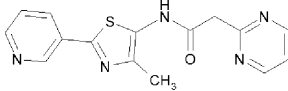
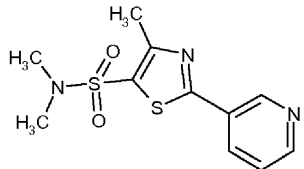
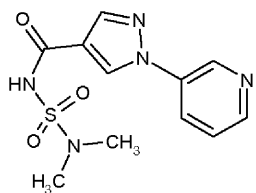
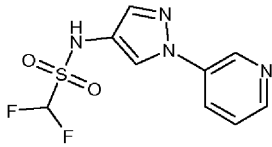
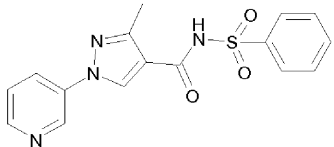
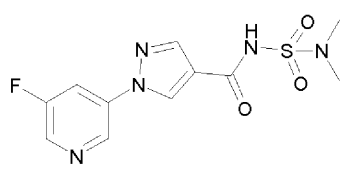
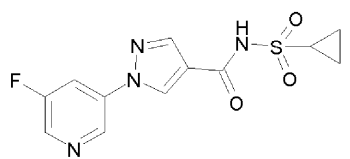
【0274】

^1H NMR ($(\text{CD}_3)_2\text{SO}$) : 7.14 (t, 1H)、7.54 (m, 1H)、7.74 (s, 1H)、8.23 (m, 1H)、8.54 (m, 1H)、8.59 (s, 1H)、9.09 (m, 1H)、10.78 (br s, 1H) ppm。

40

【0275】

【表 1】

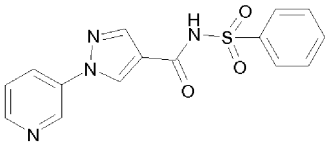
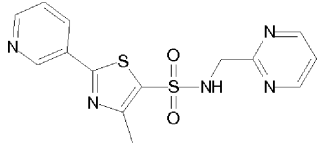
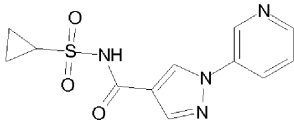
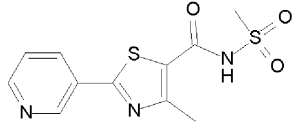
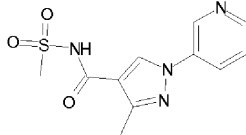
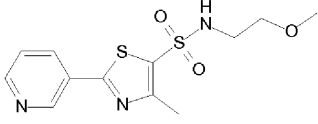
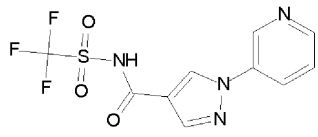
化合物番号	構造	logP ¹⁾ (HCOOH)	NMR データ
1 (実施例 A)		1,47	¹ H-NMR(CD ₃ CN): 2,4(s,3H), 3,45(q,2H), 7,4(dd,1H), 8,15(d,1H), 8,55(m,1H), 8,9(br,1H), 9,05 (s,1H) ppm
2 (実施例 B)		0,74	¹ H-NMR((CD ₃) ₂ SO): 2,45 (s,3H), 4,14(s,2H), 7,35-9,05(m,7H) ppm
3 (実施例 C)		1,86	¹ H-NMR((CD ₃) ₂ SO): 2,67(s,3H), 2,81(s,6H), 7,55(m,1H), 8,32(m,1H), 8,72(m,1H), 9,05(m,1H) ppm.
4 (実施例 D)		1,03	¹ H-NMR((CD ₃) ₂ SO): 2,89(s,6H), 7,58-7,62(m,1H), 8,24-8,27(m,1H), 8,38(s,1H), 8,60-8,62(m,1H), 9,10-9,11(m,1H), 9,22(s,1H) ppm
5 (実施例 E)		1,01	¹ H-NMR ((CD ₃) ₂ SO): 7,14(t,1H), 7,54(m,1H), 7,74(s,1H), 8,23(m,1H), 8,54(m,1H), 8,59(s,1H), 9,09(m,1H), 10,78 (br. s, 1H) ppm
6		1,71	¹ H-NMR ((CD ₃) ₂ SO): 2,34(s,3H), 7,57-7,72(m,4H), 7,98-8,00(m,2H), 8,13-8,17(m,1H), 8,56-8,58(m,1H), 9,00-9,01(m,1H), 9,14(s,1H), 12,1(s,1H)
7		1,42	¹ H-NMR ((CD ₃) ₂ SO): 2,88(s,6H), 8,26-8,30(m,1H), 8,40(s,1H), 8,63-8,64(m,1H), 9,03(s,1H), 9,26(s,1H), 11,72(s,1H)
8		1,28	¹ H-NMR ((CD ₃) ₂ SO): 1,09-1,19(m,4H), 3,08-3,14(m,1H), 8,28-8,31(m,1H), 8,41(s,1H), 8,64-8,65(m,1H), 9,04-9,05(m,1H), 9,28-9,29(m,1H), 12,02(s,1H)

10

20

30

40

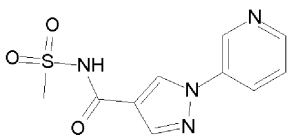
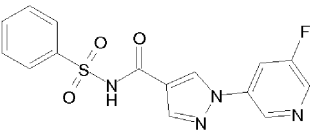
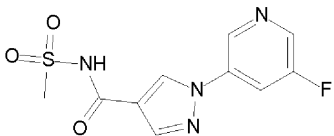
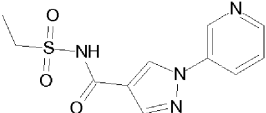
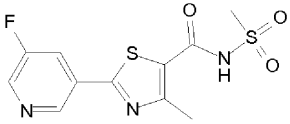
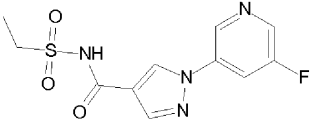
化合物番号	構造	logP ¹⁾ (HCOOH)	NMR データ
9		1,39	¹ H-NMR ((CD ₃) ₂ SO): 7,54-7,66(m,4H), 7,95-7,97(m,2H), 8,20-8,24(m,2H), 8,56-8,58(m,1H), 9,04(s,1H), 9,07-9,08(m,1H)
10		1,35	
11		0,83	
12		0,54	
13		0,81	
14		1,51	
15		0,67	

10

20

30

40

化合物番号	構造	$\log P^{1)}$ (HCOOH)	NMR データ
16		0,41	10
17		1,81	
18		0,9	
19		0,69	30
20		1,08	
21		1,24	

1) $\log P$ 値の測定方法の説明 (ギ酸法)

表で示された $\log P$ 値は、E E C 指令 79 / 831 補遺 V . A 8 に従い、逆相カラム (C 18) を用いる H P L C (高速液体クロマトグラフィー) によって測定した。温度：55。

【0276】

酸性領域での測定のための溶離液 (pH 3.4) :

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

【0277】

勾配 : 4.25 分以内で 10% 溶離液 A / 90% 溶離液 B から 95% 溶離液 A / 5% 溶離液 B。

【0278】

10

20

30

40

50

較正は、既知の $\log P$ 値を有する非分岐アルカン - 2 - オン (3 から 16 個の炭素原子を有する) を用いて行う (2 種類の連続するアルカノン間の線形補間によって保持時間に基づいて測定した $\log P$ 値)。 $\lambda_{\max}$ 値は、200 nm から 400 nm の UV スペクトラムを用いてクロマトグラフィーシグナルの最大値で求めた。

【0279】

2) NMR スペクトラムの測定

NMR スペクトラムは、

a) フロープローブヘッド (容量 60 μ L) を取り付けた Bruker Avance 400 で測定した。使用した溶媒は CD_3CN または d_6 -DMSO であり、テトラメチルシラン (0.00 ppm) を基準として用いた。

10

【0280】

b) Bruker Avance 400 II 600 を用いて測定した。使用した溶媒は CD_3CN または d_6 -DMSO であり、テトラメチルシラン (0.00 ppm) を基準として用いた。

【0281】

シグナルの分裂は、s (1 重線)、d (2 重線)、t (3 重線)、q (4 重線)、quin (5 重線)、m (多重線) として説明した。

【0282】

オウシマダニ (Boophilus microplus) 試験 (注射)

溶媒: ジメチルスルホキシド

20

適切な有効成分製剤を調製するため、有効成分 10 mg を溶媒 0.5 mL と混合し、得られた濃厚液を溶媒で希釈して所望の濃度とする。その有効成分溶液を腹部 (オウシマダニ (Boophilus microplus)) に注射し、その動物をシャーレに移し、気候調節された部屋で保存する。受精卵の産卵数によって活性を評価する。

【0283】

7 日後、% 単位での効力を求める。100% は、受精卵を産卵したマダニがいなかったことを意味している。

【0284】

この試験では、例えば、製造例の下記の化合物が、施用量 20 μ g / 動物で 100% の効力を示した: 1。

30

【0285】

アブラムシ (Myzus) 試験 (噴霧処理)

溶媒: アセトン 78 重量部

ジメチルホルムアミド 1.5 重量部

乳化剤: アルキルアリアルポリグリコールエーテル 0.5 重量部。

【0286】

適切な有効成分製剤を調製するため、1 重量部の有効成分を、指定量の溶媒および乳化剤と混和し、乳化剤を含む水で濃縮液を希釈して、所望の濃度とする。全段階のモモアカアブラムシ (Myzus persicae) がついた白菜 (Brassica pekinensis) の円板形に、所望濃度の有効成分製剤を噴霧する。

40

【0287】

6 日後、% での効力を求める。100% は全てのアブラムシが死亡したことを意味し、0% は死亡したアブラムシがないことを意味する。

【0288】

本試験では例えば、製造例の下記の化合物が、施用量 500 g / ha で 100% の効力を示した: 7、6、3、2。

【0289】

本試験では例えば、製造例の下記の化合物が、施用量 500 g / ha で 90% の効力を示した: 4、8。

【0290】

50

本試験では例えば、製造例の下記の化合物が、施用量 5 0 0 g / h a で 8 0 % の効力を示した： 1。

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I	
A 6 1 P 33/14	(2006.01)	A 6 1 P 33/14	
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 N 43/78	(2006.01)	A 0 1 N 43/78	B
A 0 1 N 43/56	(2006.01)	A 0 1 N 43/56	D

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(74)代理人 100129713

弁理士 重森 一輝

(74)代理人 100137213

弁理士 安藤 健司

(74)代理人 230105223

弁護士 城山 康文

(72)発明者 プレトシユナイダー、トーマス

ドイツ国、5 3 7 9 7・ローマー、タールシュトラッセ・2 9・ペー

(72)発明者 ケーラー、アデリーネ

ドイツ国、4 0 7 6 4・ランゲンフェルト、ハイムケムベーク・9

(72)発明者 フイツシャー、ライナー

ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ネリー - ザックス - シュトラッセ・2 3

(72)発明者 フュースライン、マルティン

ドイツ国、4 0 2 2 5・ドウツェルドルフ、ビツェルシュトラッセ・9

(72)発明者 ジエシユケ、ペーター

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

(72)発明者 クルート・ヨアヒム

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

(72)発明者 ミュールタウ、フリードリヒ・アウグスト

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

(72)発明者 フェールステ、アルント

ドイツ国、5 0 6 7 4・ケルン、モーツアルトシュトラッセ・3 - 5

(72)発明者 マルサム、オルガ

ドイツ国、5 1 5 0 3・ルースラート、フオル・デン・クロスターホフ・1 9

(72)発明者 ゲルゲンズ、ウルリヒ

ドイツ国、4 0 8 8 2・ラティンゲン、フェステルシュトラッセ・3 7

(72)発明者 佐藤 善孝

〒3 0 0 - 2 6 4 8茨城県つくば市豊里の杜2 - 1 0 - 1 0

審査官 伊藤 幸司

(56)参考文献 特表2 0 0 7 - 5 1 6 2 0 0 (J P , A)

国際公開第2 0 1 0 / 1 2 9 4 9 7 (W O , A 1)

国際公開第2 0 0 4 / 1 0 3 9 8 0 (W O , A 1)

国際公開第0 3 / 0 4 4 0 0 0 (W O , A 1)

特開昭5 2 - 1 0 5 1 7 3 (J P , A)

FILE REGISTRY on STN, RN 2 6 2 8 5 5 - 2 0 - 9 , Entered

STN: 2 4 Apr 2 0 0 0

(58)調査した分野(Int.Cl. , D B 名)

C 0 7 D

A 6 1 K

A 0 1 N

C A P L U S / R E G I S T R Y (S T N)