

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6695879号
(P6695879)

(45) 発行日 令和2年5月20日(2020.5.20)

(24) 登録日 令和2年4月24日(2020.4.24)

(51) Int.Cl.

F 1

| | | | |
|--------------------|------------------|-------------|---------|
| C07D 403/04 | (2006.01) | C07D 403/04 | C S P |
| C07D 471/04 | (2006.01) | C07D 471/04 | 1 O 7 K |
| C07D 519/00 | (2006.01) | C07D 471/04 | 1 O 7 Z |
| A01P 7/02 | (2006.01) | C07D 519/00 | 3 1 1 |
| A01P 7/04 | (2006.01) | C07D 519/00 | 3 0 1 |

請求項の数 10 (全 208 頁) 最終頁に続く

| | |
|--------------------|-------------------------------|
| (21) 出願番号 | 特願2017-531155 (P2017-531155) |
| (86) (22) 出願日 | 平成27年12月4日 (2015.12.4) |
| (65) 公表番号 | 特表2018-501226 (P2018-501226A) |
| (43) 公表日 | 平成30年1月18日 (2018.1.18) |
| (86) 國際出願番号 | PCT/EP2015/078609 |
| (87) 國際公開番号 | W02016/091731 |
| (87) 國際公開日 | 平成28年6月16日 (2016.6.16) |
| 審査請求日 | 平成30年12月3日 (2018.12.3) |
| (31) 優先権主張番号 | 14197275.2 |
| (32) 優先日 | 平成26年12月11日 (2014.12.11) |
| (33) 優先権主張国・地域又は機関 | 歐州特許庁 (EP) |
| (31) 優先権主張番号 | 15179050.8 |
| (32) 優先日 | 平成27年7月30日 (2015.7.30) |
| (33) 優先権主張国・地域又は機関 | 歐州特許庁 (EP) |

| | |
|-----------|---|
| (73) 特許権者 | 300091441 シンジエンタ パーティシペーションズ アーゲー |
| | スイス国4058 バーゼル、シュバールツ バルトアレー 215 |
| (74) 代理人 | 100094569 弁理士 田中 伸一郎 |
| (74) 代理人 | 100088694 弁理士 弟子丸 健 |
| (74) 代理人 | 100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦 |
| (74) 代理人 | 100084663 弁理士 稲田 篤 |
| (74) 代理人 | 100093300 弁理士 浅井 賢治 |

最終頁に続く

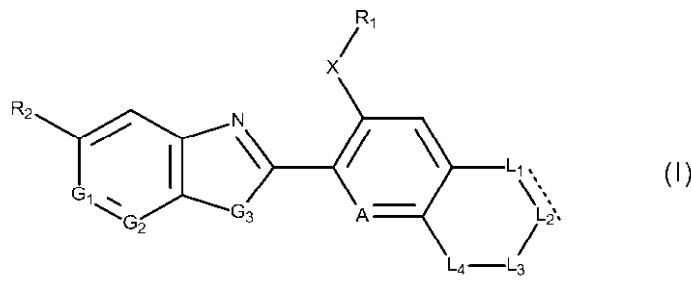
(54) 【発明の名称】硫黄含有置換基を有する殺有害生物的に活性な四環式誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



10

(式中、

A が、C H または N であり；

X が、S、SO または SO₂ であり；R₁ が、C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル - C₁ ~ C₄ アルキルであるか；またはハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルおよび C

20

$C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであるか；またはハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R_2 が、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、O ($C_1 \sim C_4$ ハロアルキル)、-SF₅、-C(O)C₁~C₄ ハロアルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであるか、またはヒドロキシル、メトキシおよびシアノからなる群から選択される 1 つまたは 2 つの置換基で置換される $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであるか；またはハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得る $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

G_1 が、N または CR₄ であり；

G_2 が、N または CR₅ であり；

G_3 が、O、S または NR₆ であり；

R_6 が、ハロゲンおよび $C_1 \sim C_2$ アルキルスルフィニルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得る $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

R_4 および R_5 が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであるか、または R_8 で一置換または多置換され得る $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであるか；または R_9 で一置換または多置換され得る $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか；または

R_4 および R_5 が、互いに独立して、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニルまたはヒドロキシルであり；

R_8 および R_9 が、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；

L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、 L_1 および L_4 が結合される 2 個の炭素原子と一緒に、芳香族または部分的に飽和した炭素環式または複素環式環系を形成し；ここで、

L_1 が、窒素、S(O)n、酸素、N - R_{10a} または C(R_{10a})_m であり；

L_2 が、窒素、S(O)n、酸素、N - R_{10b} または C(R_{10b})_m であり；

L_3 が、窒素、S(O)n、酸素、N - R_{10c} または C(R_{10c})_m であり；

L_4 が、窒素、S(O)n、酸素、直接結合、N - R_{10d} または C(R_{10d})_m であり；ただし、 L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 から選択される 2 つ以下の置換基が、酸素または硫黄であり得；および 2 つの L 基が酸素である場合、それらは互いに隣接しておらず；および 3 つ以下の L 基が窒素であり得；

n が、0 ~ 2 であり；

m が、1 または 2 であり；

R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ - $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、($C_1 \sim C_6$ アルキル) NH、($C_1 \sim C_6$ アルキル)₂N、($C_1 \sim C_6$ シクロアルキル) NH、($C_1 \sim C_6$ シクロアルキル)₂N、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニルアミノまたは -SF₅ であり；さらに、 R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} および R_{10d} のうちの 1 つが、オキソであり得るか；または

10

20

30

40

50

R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであるか；または

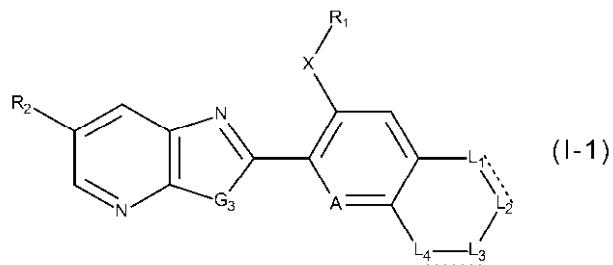
R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るフェニルである)

の化合物、または前記化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはN-オキシド。

【請求項2】

式I-1

【化2】



10

20

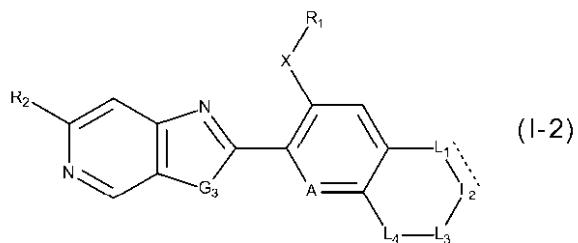
(式中、前記置換基X、A、 R_1 、 R_2 、 G_3 、 L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、請求項1に記載の式Iで定義されるとおりである)

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項3】

式I-2

【化3】



30

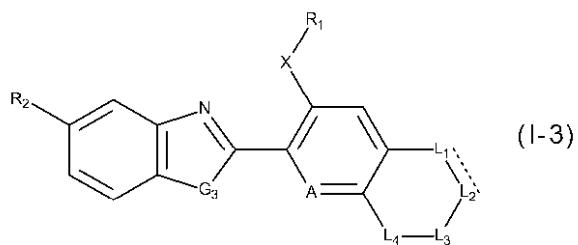
(式中、前記置換基X、A、 R_1 、 R_2 、 G_3 、 L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、請求項1に記載の式Iで定義されるとおりである)

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項4】

式I-3

【化4】



40

50

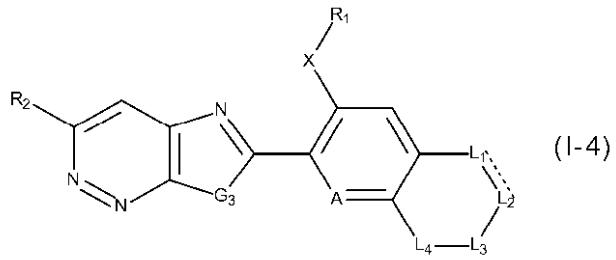
(式中、前記置換基X、A、 R_1 、 R_2 、 G_3 、 L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、請求項1に記

載の式 I で定義されるとおりである)
の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 5】

式 I - 4

【化 5】



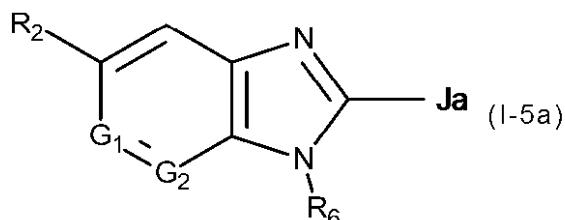
(式中、前記置換基 X、A、R₁、R₂、G₃、L₁、L₂、L₃ および L₄ が、請求項 1 に記載の式 I で定義されるとおりである)

の化合物によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 6】

式 I - 5 a

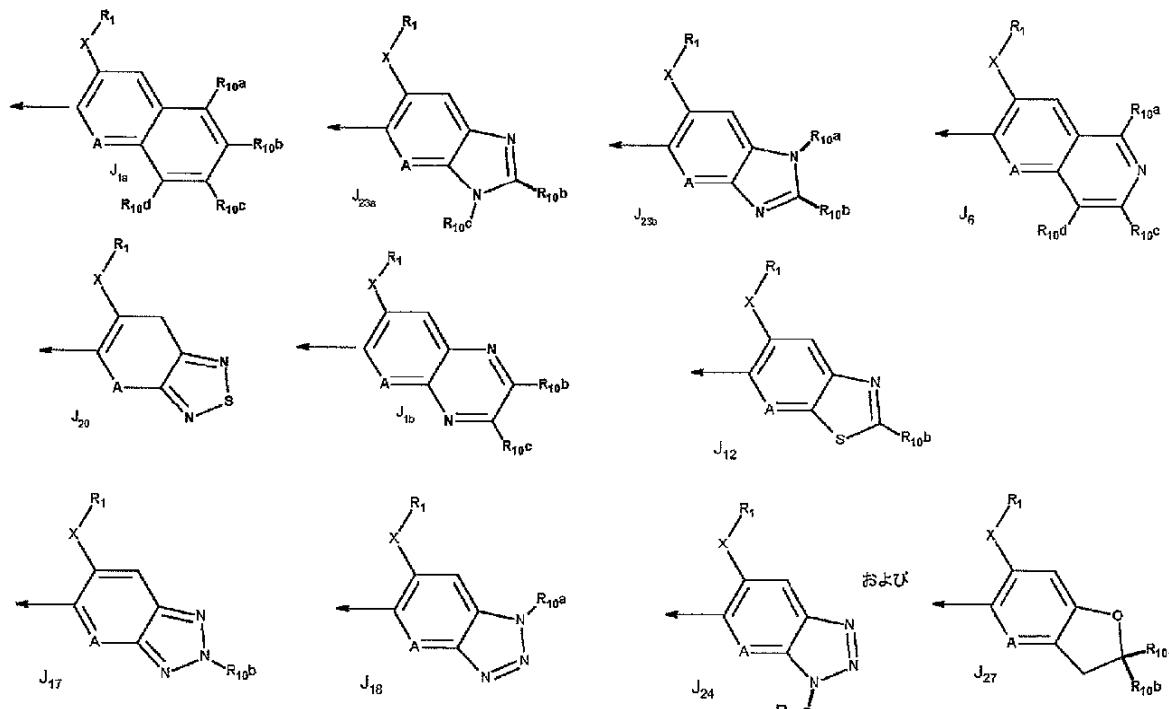
【化 6】



(式中、
G₁ が、N または C H であり ;
G₂ が、N または C H であり ;
R₂ が、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルファニルまたは C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルフィニルであり ;
A が、N または C H であり ;
R₆ が、C₁ ~ C₄ アルキルであり ;
X が、S または SO₂ であり ;
R₁ が、C₁ ~ C₄ アルキルであり ; および
Ja が、

30

【化7】



10

20

からなる群から選択され、式中、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、シクロプロピル、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される)

の化合物によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項7】

活性成分として、それぞれの場合に遊離形態または農芸化学的に利用可能な塩形態の、請求項1に記載の式Iの少なくとも1つの化合物または必要に応じてその互変異性体と、少なくとも1つの助剤とを含む殺有害生物組成物。

【請求項8】

有害生物を防除するための方法であって、請求項7に記載の組成物を、前記有害生物またはその環境に施用する工程を含み、ただし、手術または治療によるヒトの身体の治療のための方法および前記ヒトの身体において実施される診断方法を除くことを特徴とする、方法。

【請求項9】

有害生物による攻撃から植物繁殖材料を保護するための方法であって、前記繁殖材料または前記繁殖材料が植えられる場所を、請求項7に記載の組成物で処理する工程を含むことを特徴とする、方法。

【請求項10】

請求項9に記載の方法に従って処理された植物繁殖材料。

【発明の詳細な説明】

30

【技術分野】

【0001】

本発明は、硫黄置換基を含有する殺有害生物的(pesticidally)活性な、特に、殺虫的に活性な四環式誘導体、それらの化合物を含む組成物、および動物有害生物(animal pest)(節足動物、特に、昆虫またはダニ目(Acarina)の代表例を含む)を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

殺有害生物作用を有する複素環化合物は公知であり、例えば、国際公開第2012/086848号および国際公開第2013/018928号に記載されている。

40

50

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

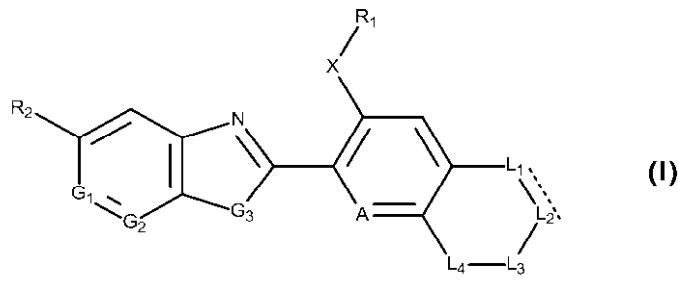
【0003】

ここで、硫黄含有二環式部分を有する新規な殺有害生物的に活性な四環式誘導体が発見された。

【0004】

したがって、本発明は、式 I

【化1】



(式中、

A が、C H または N を表し；

X が、S、SO または SO₂ であり；

R₁ が、C₁ ~ C₄ アルキル、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル、C₃ ~ C₆ シクロアルキル - C₁ ~ C₄ アルキルであり；またはハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルおよび C₁ ~ C₄ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される C₃ ~ C₆ シクロアルキルであり；またはハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルおよび C₁ ~ C₄ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される C₃ ~ C₆ シクロアルキル - C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R₂ が、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルファニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルホニル、O (C₁ ~ C₄ ハロアルキル)、-SF₅、-C(O)C₁ ~ C₄ ハロアルキル、シアノ、C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり、またはヒドロキシル、メトキシおよびシアノからなる群から選択される 1 つまたは 2 つの置換基で置換される C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり；またはハロゲン、シアノ、C₁ ~ C₄ ハロアルキルおよび C₁ ~ C₄ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得る C₃ ~ C₆ シクロアルキルであり；

G₁ が、N または CR₄ であり；

G₂ が、N または CR₅ であり；

G₃ が、O、S または NR₆ であり；

R₆ が、ハロゲンおよび C₁ ~ C₂ アルキルスルフィニルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得る C₁ ~ C₄ アルキルであり；

R₄ および R₅ が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキルであり、または R₈ で一置換または多置換され得る C₃ ~ C₆ シクロアルキルであり；または R₉ で一置換または多置換され得る C₃ ~ C₆ シクロアルキル - C₁ ~ C₄ アルキルであり；または

R₄ および R₅ が、互いに独立して、C₂ ~ C₆ アルケニル、C₂ ~ C₆ ハロアルケニル、C₂ ~ C₆ アルキニル、C₂ ~ C₆ ハロアルキニル、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ アルキルスルファニル、C₁ ~ C₄ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキルスルファニル、C₁ ~ C₄ ハロアルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ ハロアルキルスルフィニルまたはヒドロキシルであり；

R₈ および R₉ が、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁ ~ C₄ ハロアルコキ

20

30

40

50

シ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり； L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、 L_1 および L_4 が結合される2個の炭素原子と一緒に、芳香族、部分的に飽和した炭素環式または複素環式環系を形成し；ここで、

L_1 が、窒素、 $S(O)n$ 、酸素、 $N - R_{10a}$ または $C(R_{10a})_m$ であり；

L_2 が、窒素、 $S(O)n$ 、酸素、 $N - R_{10b}$ または $C(R_{10b})_m$ であり；

L_3 が、窒素、 $S(O)n$ 、酸素、 $N - R_{10c}$ または $C(R_{10c})_m$ であり；

L_4 が、窒素、 $S(O)n$ 、酸素、直接結合、 $N - R_{10d}$ または $C(R_{10d})_m$ であり；ただし、 L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 から選択される2つ以下の置換基が、酸素または硫黄であり得；および2つの L 基が酸素である場合、それらは互いに隣接しておらず；および3つ以下の L 基が窒素であり得；

n が、0～2であり；

m が、1または2であり；

R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ - $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルコキシカルボニル、($C_1 \sim C_6$ アルキル)NH、($C_1 \sim C_6$ アルキル)₂N、($C_1 \sim C_6$ シクロアルキル)NH、($C_1 \sim C_6$ シクロアルキル)₂N、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニルアミノまたは-SF₅であり；さらに、 R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} および R_{10d} のうちの1つがオキソであり得；または

R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；または

R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るフェニルである)

の化合物、ならびにこれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシドに関する。

【0005】

少なくとも1つの塩基性中心(basic centre)を有する式Iの化合物は、例えば酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉛酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、リン酸またはハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和または不飽和ジカルボン酸、例えばシウウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸またはフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸またはクエン酸、または例えば安息香酸との酸付加塩、または有機スルホン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカン-またはアリールスルホン酸、例えばメタン-またはp-トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩またはマグネシウム塩、またはアンモニアまたは有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-またはトリ-低級アルキルアミン、例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-またはジメチルプロピルアミン、またはモノ-、ジ-またはトリヒドロキシ-低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-またはトリエタノールアミンを形成することができる。

【0006】

10

20

30

40

50

炭素原子の混成に応じて、mが、1または2である。

【0007】

$C(R_{10a})_m$ の定義中、mが2である場合、 R_{10a} は、同じかまたは異なっていてもよく；例えば一方の R_{10a} が水素であり、他方がメチルであり得る。これは、 $C(R_{10b})_m$ 、 $C(R_{10c})_m$ および $C(R_{10d})_m$ の定義にも有効である。

【0008】

置換基の定義中に存在するアルキル基は、直鎖状または分枝鎖状であり得、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソ-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ノニル、デシルおよびそれらの分枝鎖状異性体である。アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル基は、記載されるアルキル基から誘導される。アルケニルおよびアルキニル基は、一価不飽和または多価不飽和であり得る。10

【0009】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルまたはハロフェニルなど、他の意味と組み合わせたハロゲンにも適用される。

【0010】

ハロアルキル基は、好ましくは、1～6個の炭素原子の鎖長を有する。ハロアルキルは、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、ペンタフルオロエチル、1,1-ジフルオロ-2,2,2-トリクロロエチル、2,2,3,3-テトラフルオロエチルおよび2,2,2-トリクロロエチルである。20

【0011】

アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシおよびtert-ブトキシであり、さらに異性体ペンチルオキシおよびヘキシルオキシ基である。

【0012】

アルコキシアルキル基は、好ましくは、1～6個の炭素原子の鎖長を有する。

【0013】

アルコキシアルキルは、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、n-プロポキシメチル、n-プロポキシエチル、イソプロポキシメチルまたはイソプロポキシエチルである。30

【0014】

アルコキカルボニルは、例えばメトキカルボニル(C_1 アルコキカルボニルである)、エトキカルボニル、プロポキカルボニル、イソプロポキカルボニル、n-ブトキカルボニル、tert-ブトキカルボニル、n-ペントキカルボニルまたはヘキソキカルボニルである。

【0015】

シクロアルキル基は、好ましくは、3～6個の環炭素原子を有し、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルである。40

【0016】

本明細書において使用される際、「 $C_2 \sim C_6$ アルキニル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、少なくとも1つの三重結合を含有し、2～6個の炭素原子を有し、単結合によって分子の残りの部分に結合された直鎖状または分枝鎖状炭化水素鎖ラジカル基を指す。「 $C_2 \sim C_4$ アルキニル」および「 $C_2 \sim C_3$ アルキニル」という用語は、それに応じて解釈されるべきである。 $C_2 \sim C_6$ アルキニルの例としては、限定はされないが、エチニル、プロパ-1-イニル、ブタ-1-イニル、ブタ-2-イニルが挙げられる。

【0017】

本明細書において使用される際、「 $C_2 \sim C_6$ アルケニル」という用語は、炭素および水素原子のみからなり、少なくとも1つの二重結合を含有し、2～6個の炭素原子を有し、50

単結合によって分子の残りの部分に結合された直鎖状または分枝鎖状炭化水素鎖ラジカル基を指す。「C₂～C₄アルケニル」および「C₂～C₃アルケニル」という用語は、それに応じて解釈されるべきである。C₂～C₆アルケニルの例としては、限定はされないが、ブロパ-1-エニル、ブタ-1-エニル、ブタ-2-エニルが挙げられる。

【0018】

本発明に関して、「L₁、L₂、L₃およびL₄が、L₁およびL₄が結合されるかまたはL₄が結合である場合にL₁およびL₃が結合される2個の炭素原子と一緒に、芳香族または部分的に飽和した炭素環系を形成し」、炭素環系は、好ましくは、不飽和または部分的に飽和した5～6個の環炭素原子を有する基、例えば、限定はされないが、フェニルおよびシクロヘキセニルである。10

【0019】

本発明に関して、「L₁、L₂、L₃およびL₄が、L₁およびL₄が結合されるかまたはL₄が結合である場合にL₁およびL₃が結合される2個の炭素原子と一緒に、芳香族または部分的に飽和した複素環系を形成し」、複素環式環系は、好ましくは、不飽和または部分的に飽和した、環中に1～3個のヘテロ原子を含む基であり、例えば、限定はされないが、ピロリル；ピラゾリル；イソオキサゾリル；フラニル；チエニル；イミダゾリル；オキサゾリル；チアゾリル；イソチアゾリル；トリアゾリル；オキサジアゾリル；チアジアゾリル；テトラゾリル；フリル；ピリジル；ピリミジル；ピラジニル；ピリダジニル；トリアジニル、ピラニル；ピロリジニル、ピペリジニル；ピロリジニル-2-オン；ピペリジニル-2-オンである。20

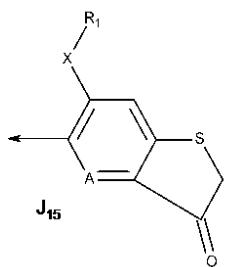
【0020】

本発明に関して、置換基の定義中の「一置換ないし多置換される」は、典型的に、置換基の化学構造に応じて、一置換ないし7回置換され、好ましくは、一置換ないし5回置換され、より好ましくは、一置換、二置換または三置換されることを意味する。

【0021】

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}またはR_{10d}のうちの1つがオキソを表し得る芳香族または部分的に飽和した炭素環式または複素環式環系の例は、基J₁₅：

【化2】



30

であり、式中、X、R₁およびAが、上の式Iで定義されるとおりである。

【0022】

本発明に係る式Iの化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

【発明を実施するための形態】

40

【0023】

式I

(式中、

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₄ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC₃～C₆シクロアルキルであり；またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；

R₂が、水素、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキル

50

スルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、O(C₁～C₄ハロアルキル)、-SF₅、-C(O)C₁～C₄ハロアルキル、シアノ、C₁～C₆ハロアルキルであり、またはヒドロキシル、メトキシおよびシアノからなる群から選択される1つまたは2つの置換基で置換されるC₁～C₆ハロアルキルであり；またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキルであり；

G₁が、NまたはCR₄であり；

G₂が、NまたはCR₅であり；

G₃が、O、SまたはNR₆であり；

R₆が、ハロゲンおよびC₁～C₂アルキルスルフィニルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC₁～C₄アルキルであり；

10

R₄およびR₅が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキルであり、またはR₈で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキルであり；またはR₉で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルであり；または

R₄およびR₅が、互いに独立して、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルスルファニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニルまたはヒドロキシルであり；

20

R₈およびR₉が、互いに独立して、ハロゲン、ニトロ、シアノ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルであり；

L₁、L₂、L₃およびL₄が、L₁およびL₄が結合される2個の炭素原子と一緒に、芳香族または部分的に飽和した炭素環式または複素環式環系を形成し；ここで、

L₁が、窒素、硫黄、酸素またはC-R_{10a}であり；

L₂が、窒素、硫黄、酸素またはC-R_{10b}であり；

L₃が、窒素、硫黄、酸素またはC-R_{10c}であり；

L₄が、窒素、硫黄、酸素、直接結合またはC-R_{10d}であり；ただし、L₁、L₂、L₃およびL₄から選択される2つ以下の置換基が、酸素または硫黄であり得；および2つのL基が酸素である場合、それらは互いに隣接しておらず；

30

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₂～C₄アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニルまたは-SF₅であり；さらに、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}およびR_{10d}のうちの1つが、オキソであり得る）

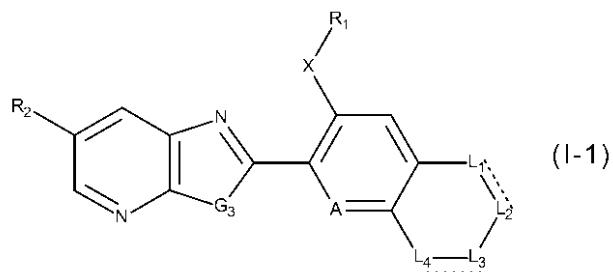
の化合物、ならびにこれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシドが好ましい。

40

【0024】

式Iの化合物の好ましい基は、式I-1

【化3】



10

(式中、置換基X、A、R₁、R₂、R₆、G₃、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりである)

の化合物によって表される。

【0025】

実施形態(A1)：

式I-1

(式中、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフイニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノであり、またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキルであり；

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシリル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₂～C₄アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、-SF₅であり；さらに、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}およびR_{10d}のうちの1つが、オキソであり得る)

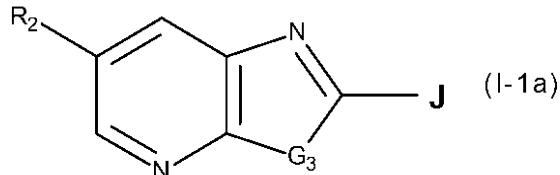
の化合物が好ましい。

【0026】

実施形態(A2)：

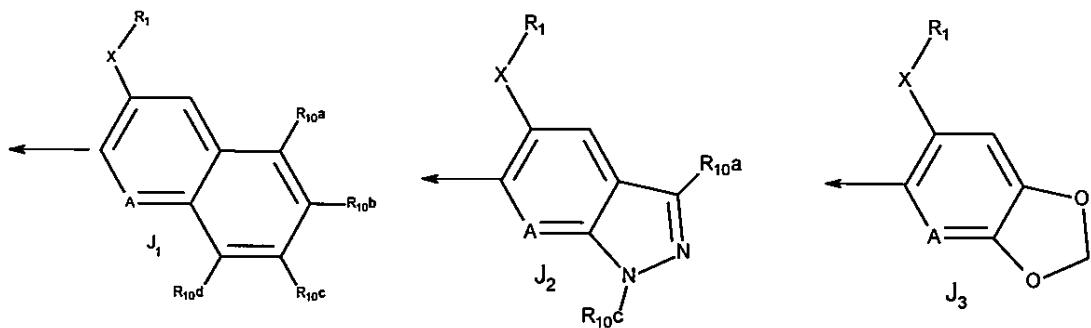
さらなる好ましいものは、式I-1a

【化4】

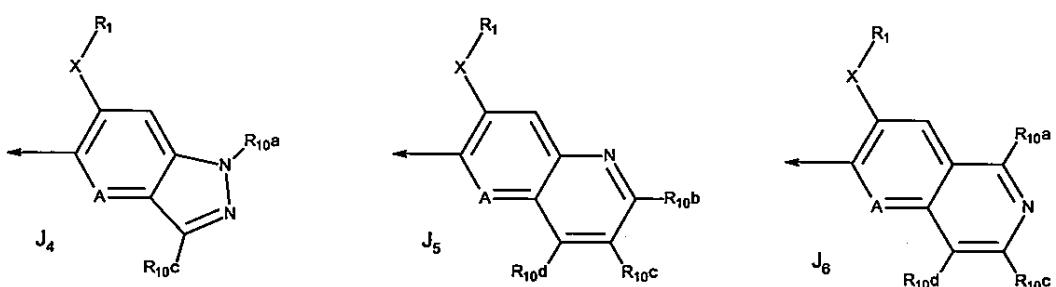


50

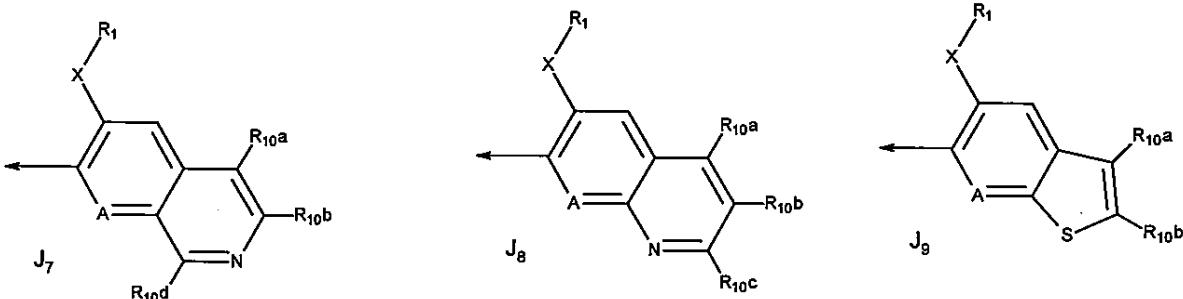
(式中、Jが、
【化5】)



10

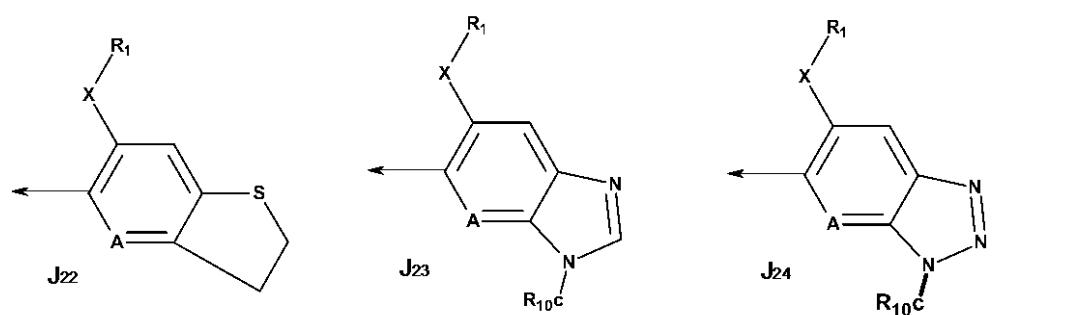
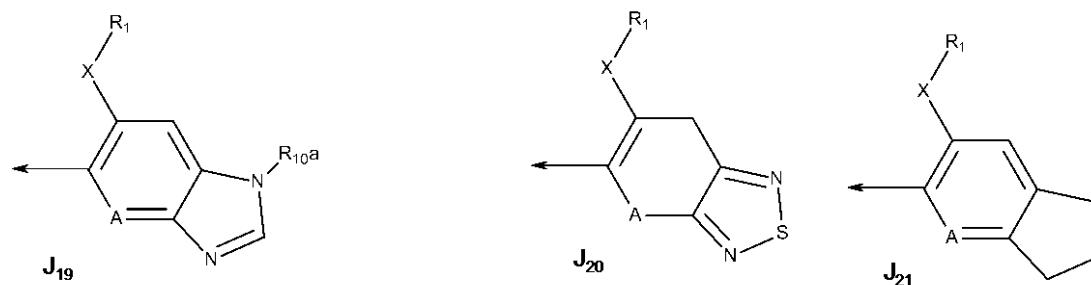
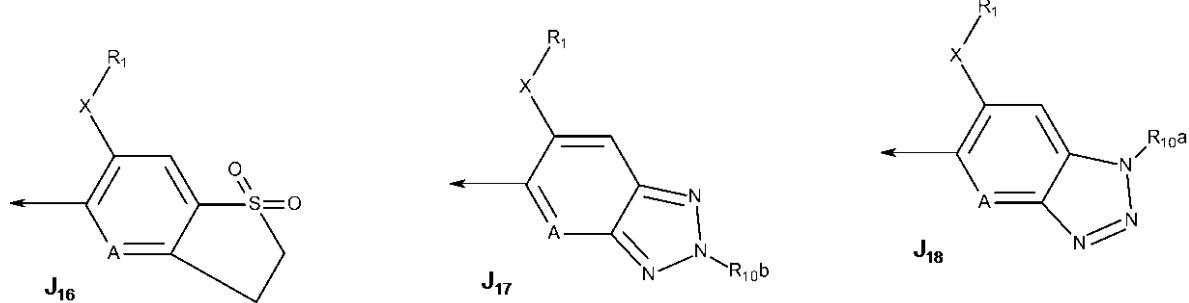
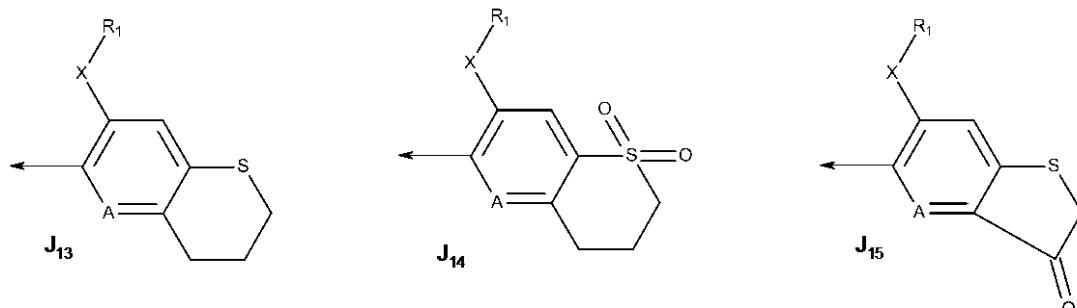
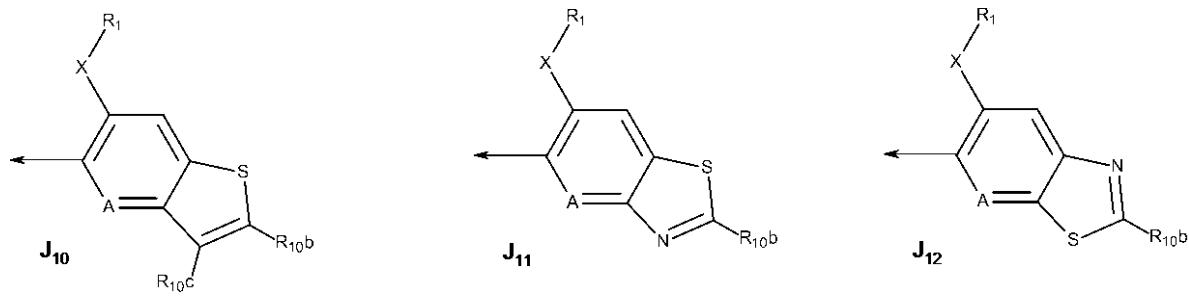


20

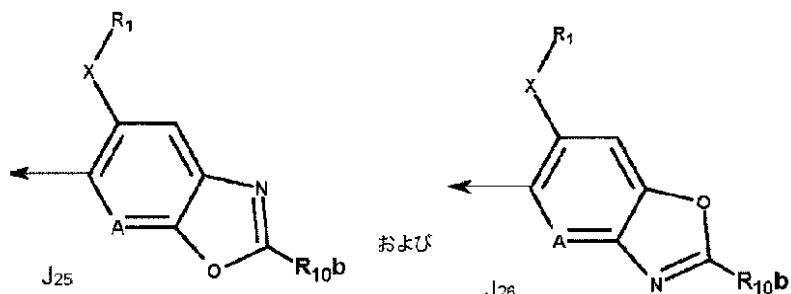


30

【化6】



【化7】



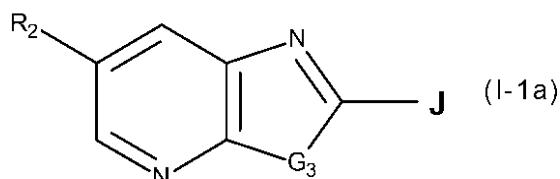
からなる群から選択され、A、G₃、R₁、R₂、X、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、R_{10d}が、実施形態(A1)で定義されるとおりである。
の化合物である。

【0027】

実施形態(A3)：

さらなる好ましいものは、式I-1a

【化8】



10

20

30

40

(式中、Jが、上の実施形態(A2)で定義されるとおりであり、
Aが、C-HまたはNであり；
R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフイニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシリル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)

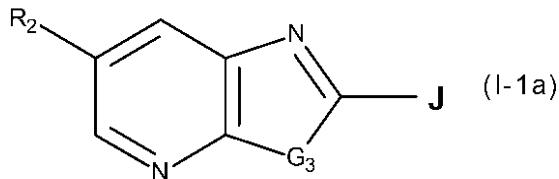
の化合物である。

【0028】

実施形態(A4)：

さらなる好ましいものは、式I-1a

【化9】



(式中、Jが、上の実施形態(A2)で定義されるとおりであり、

10

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキルであり；

R₂が、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシまたはC₁～C₄ハロアルキルであり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)

20

の化合物である。

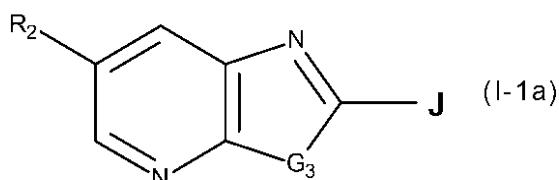
【0029】

実施形態(A5)：

さらなる好ましいものは、式I-1a

【化10】

30



(式中、Jが、上の実施形態(A2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

40

R₁が、C₁～C₄アルキルであり；

R₂が、-OCF₃、-SCF₃、-S(O)CF₃、-S(O)₂CF₃またはCF₃であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)

50

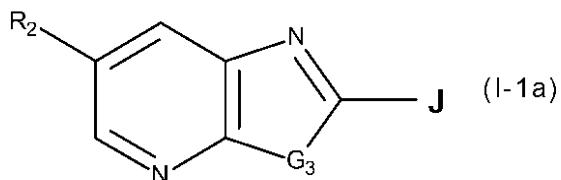
の化合物である。

【0030】

実施形態(A6)：

さらなる好ましいものは、式I-1a

【化11】



10

(式中、Jが、上の実施形態(A2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、エチルであり；

R₂が、CF₃であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、
シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、プロピル、トリフルオロメチル、CF₃CH₂-
、CH₃O、-SCF₃、-S(O)CF₃または-S(O)₂CF₃である)

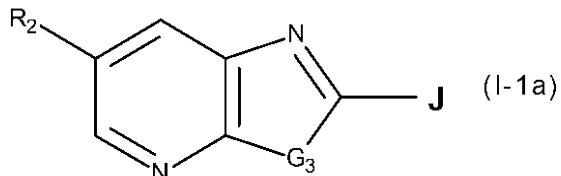
の化合物である。

【0031】

実施形態(A7)：

さらなる好ましいものは、式I-1a

【化12】



30

(式中、Jが、上の実施形態(A2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、エチルであり；

R₂が、CF₃であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、
シアノ、メチル、またはCF₃である)

の化合物である。

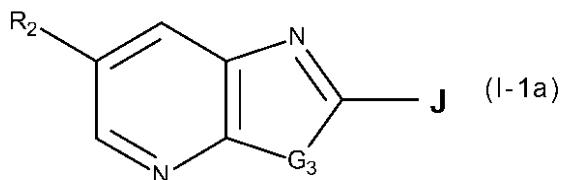
【0032】

実施形態(A8)：

さらなる好ましいものは、式I-1a

40

【化13】



(式中、Jが、実施形態(A2)で定義されるとおりであり、
Aが、C-HまたはNであり；
R₁が、エチルであり；
R₂が、CF₃であり；
Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；
G₃がN-R₆であり、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；
J₂を除く全ての基Jにおいて、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素であり；
R_{10a}、R_{10b}およびR_{10d}が、互いに独立して、J₂中で水素であり、R_{10c}が、J₂中でメチルである)
の化合物である。

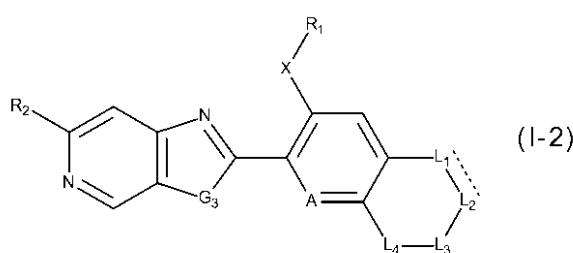
【0033】

上記の式I-1の好ましい実施形態の全てにおいて、Xが、好ましくは、SまたはSO₂であり、Xの定義から独立して、R₆がメチルである。

【0034】

式Iの化合物のさらなる好ましい基は、式I-2

【化14】



(式中、置換基X、A、R₁、R₂、R₆、G₃、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりである)
の化合物によって表される。

【0035】

実施形態(B1)：

式I-2

(式中、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフイニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノであり、またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキルであり；

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

10

20

30

40

50

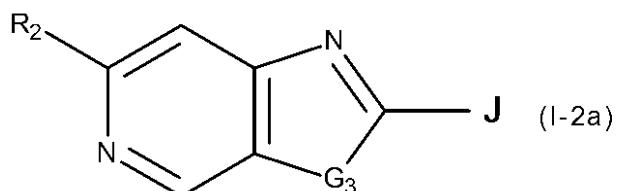
L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、上の式Iで定義されるとおりであり；
 R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロハロアルキル- $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキカルボニル、-SF₅であり；さらに、 R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} および R_{10d} のうちの1つがオキソであり得る)
10
の化合物が好ましい。

【0036】

実施形態(B2)：

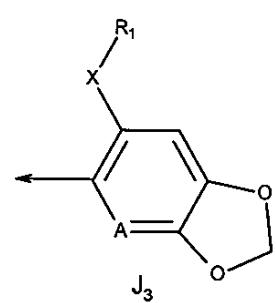
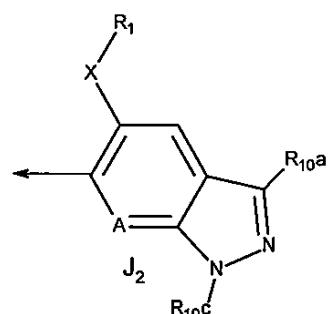
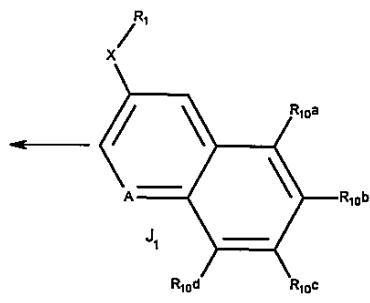
さらなる好ましいものは、式I-2a

【化15】

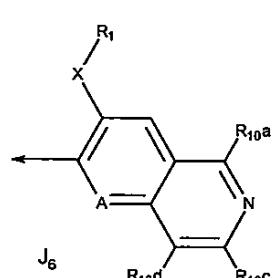
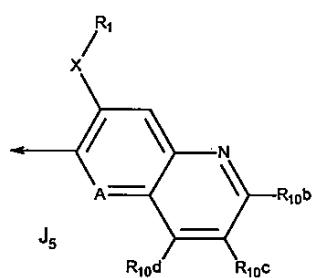
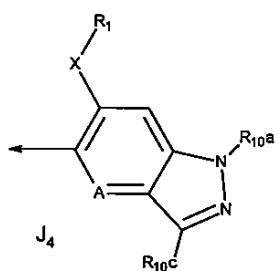


(式中、Jが、

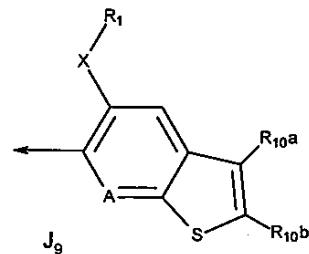
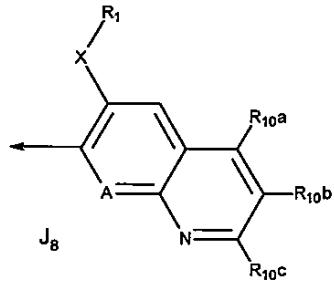
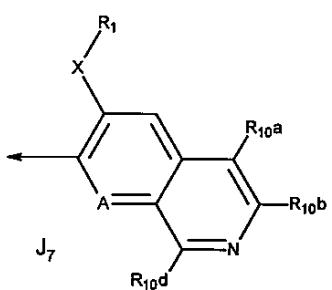
【化 1 6】



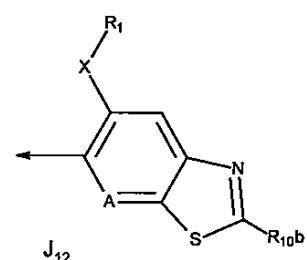
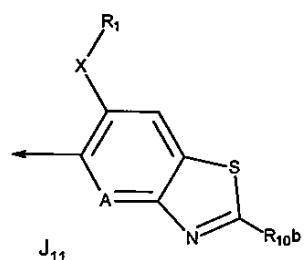
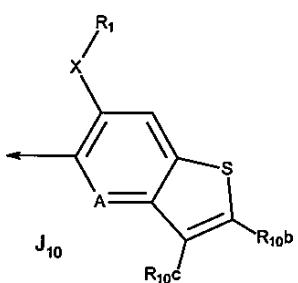
10



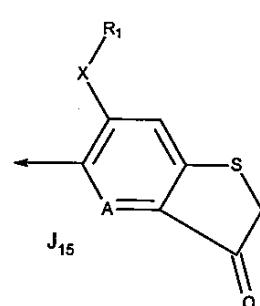
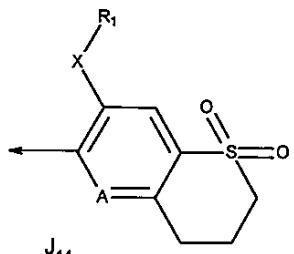
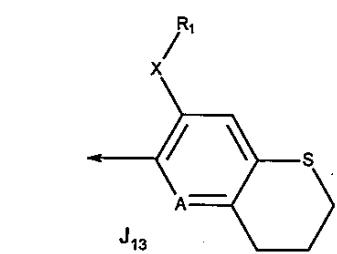
20



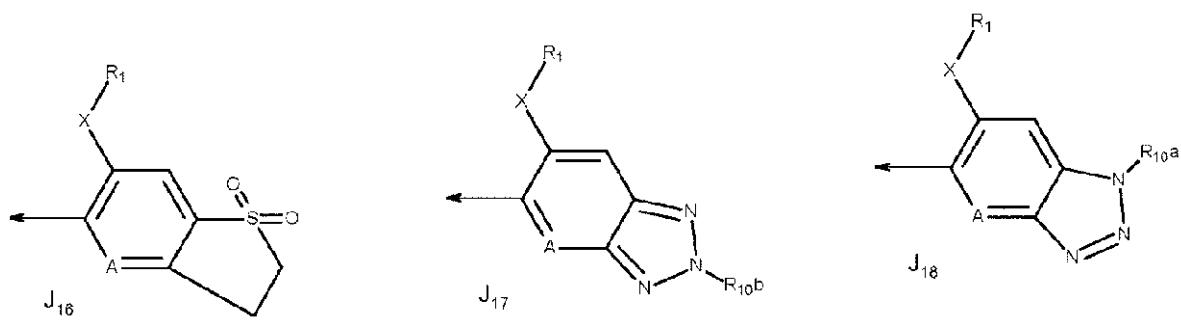
30



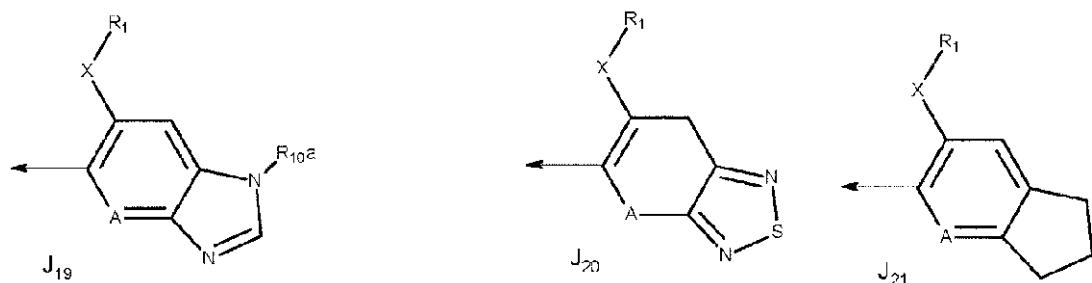
40



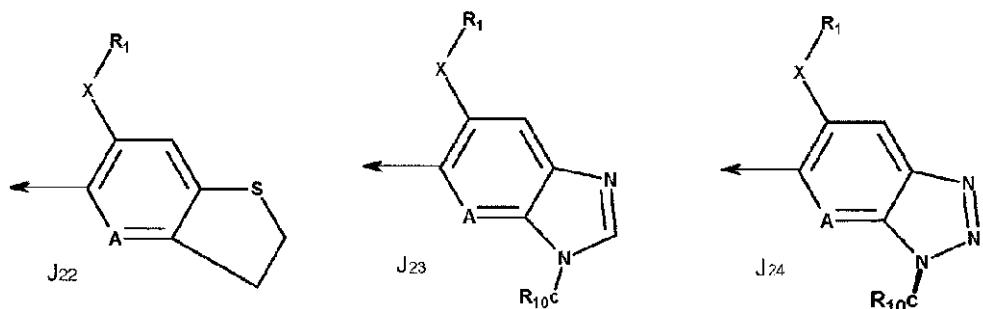
【化17】



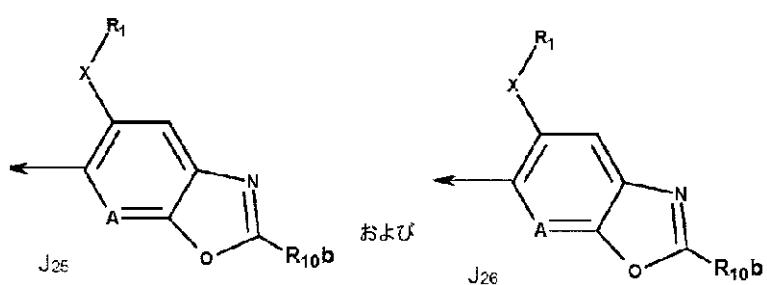
10



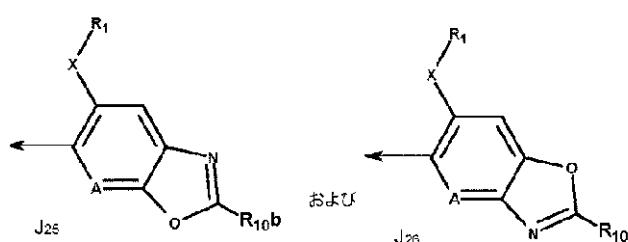
20



30



40



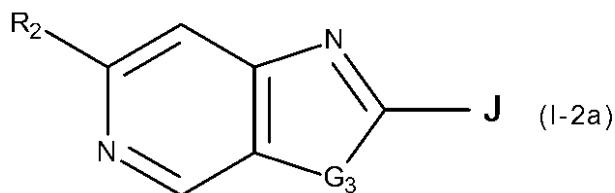
からなる群から選択され、A、G₃、R₁、R₂、X、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、R_{10d}が、実施形態（B 1）で定義されるとおりである）
の化合物である。

【0037】

実施形態（B 3）：

さらなる好ましいものは、式I-2a

【化18】



10

(式中、Jが、実施形態(B2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)

の化合物である。

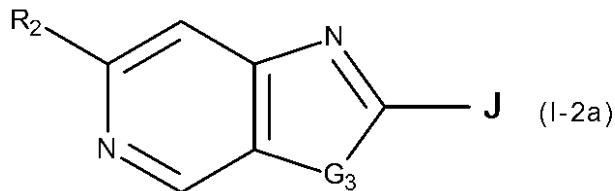
【0038】

実施形態(B4)：

さらなる好ましいものは、式I-2a

30

【化19】



40

(式中、Jが、実施形態(B2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキルであり；

R₂が、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシまたはC₁～C₄ハロアルキルであり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C

50

$C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロハロアルキル - $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである)の化合物である。

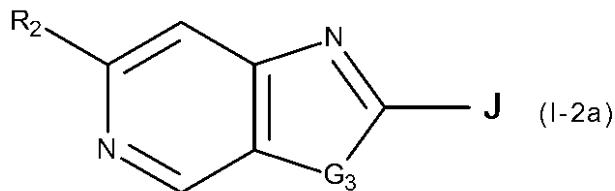
【0039】

実施形態(B5) :

さらなる好ましいものは、式I-2a

10

【化20】



20

(式中、Jが、実施形態(B2)で定義されるとおりであり、Aが、C-HまたはNであり；
 R_1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；
 R_2 が、-OCF₃、-SCF₃、-S(O)CF₃、-S(O)₂CF₃またはCF₃であり；
Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G_3 がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；
R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである)の化合物である。

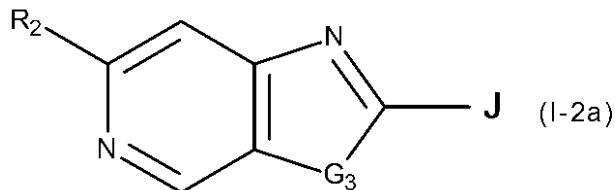
30

【0040】

実施形態(B6) :

さらなる好ましいものは、式I-2a

【化21】



40

(式中、Jが、実施形態(B2)で定義されるとおりであり、Aが、C-HまたはNであり；
 R_1 が、エチルであり；
 R_2 が、CF₃であり；

50

X が、上の式 I で定義されるとおりであり；
 G₃ が N - R₆ であり、ここで、R₆ が、上の式 I で定義されるとおりであり；
 R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、
 シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、プロピル、CF₃、CF₃CH₂-、CH₃O、-
 SCF₃、-S(O)CF₃ または -S(O)₂CF₃ である)
 の化合物である。

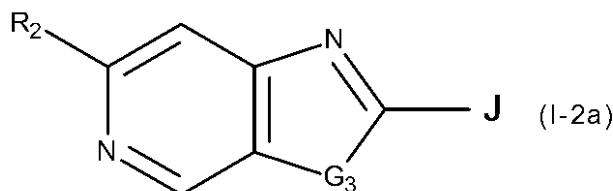
【0041】

実施形態 (B7) :

さらなる好ましいものは、式 I - 2 a

【化22】

10



(式中、J が、実施形態 (B2) で定義されるとおりであり、

20

A が、C - H または N であり；

R₁ が、エチルであり；R₂ が、CF₃ であり；

X が、上の式 I で定義されるとおりであり；

G₃ が N - R₆ であり、ここで、R₆ が、上の式 I で定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、
 シアノ、メチル、または CF₃ である)

の化合物である。

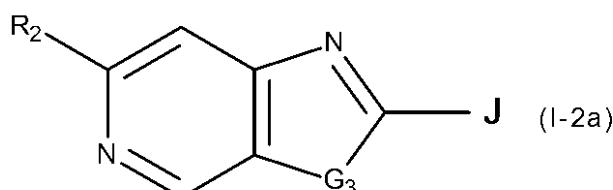
【0042】

実施形態 (B8) :

30

さらなる好ましいものは、式 I - 2 a

【化23】



40

(式中、J が、実施形態 (B2) で定義されるとおりであり、

A が、C - H または N であり；

R₁ が、エチルであり；R₂ が、CF₃ であり；

X が、上の式 I で定義されるとおりであり；

G₃ が N - R₆ であり、R₆ が、上の式 I で定義されるとおりであり；

J₂ を除く全ての基 J において、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、および R_{10d} が、互いに独立し
 て、水素であり；

R_{10a}、R_{10b}、および R_{10d} が、互いに独立して、J₂ 中で水素であり、R_{10c} が J₂ 中で

50

メチルである)
の化合物である。

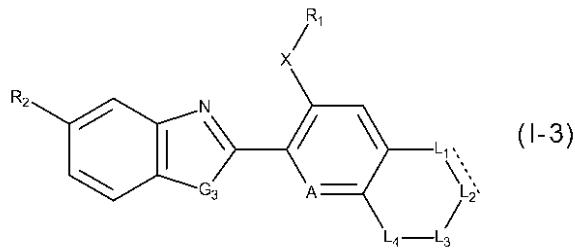
【0043】

上記の式I-2の好ましい実施形態の全てにおいて、Xが、好ましくは、SまたはSO₂であり、Xの定義から独立して、R₆がメチルである。

【0044】

式Iの化合物のさらなる好ましい基は、式I-3

【化24】



(式中、置換基X、A、R₁、R₂、R₆、G₃、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりである)

の化合物によって表される。

【0045】

実施形態(C1) :

式I-3

(式中、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノであり、またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキルであり；

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₂～C₄アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、-SF₅であり；さらに、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}およびR_{10d}のうちの1つがオキソであり得る)

の化合物が好ましい。

【0046】

実施形態(C2) :

さらなる好ましいものは、式I-3a

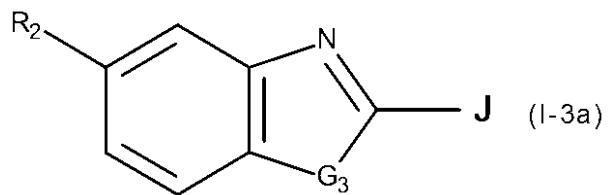
10

20

30

40

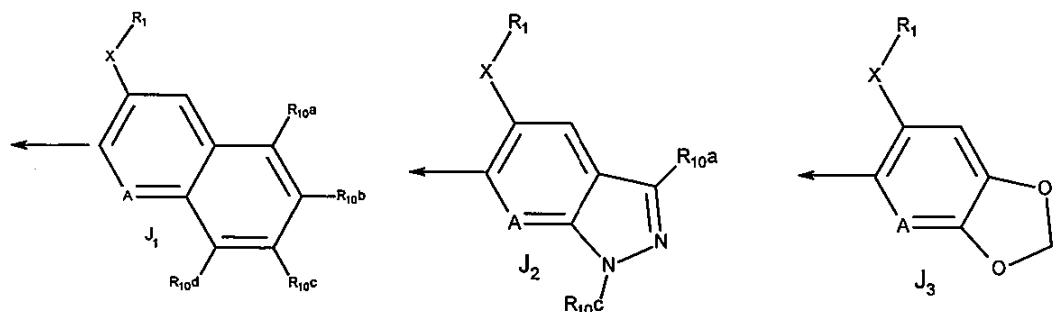
【化 25】



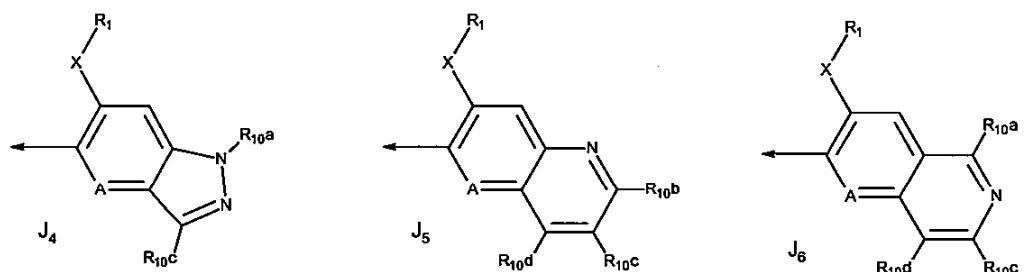
10

(式中、 J が、

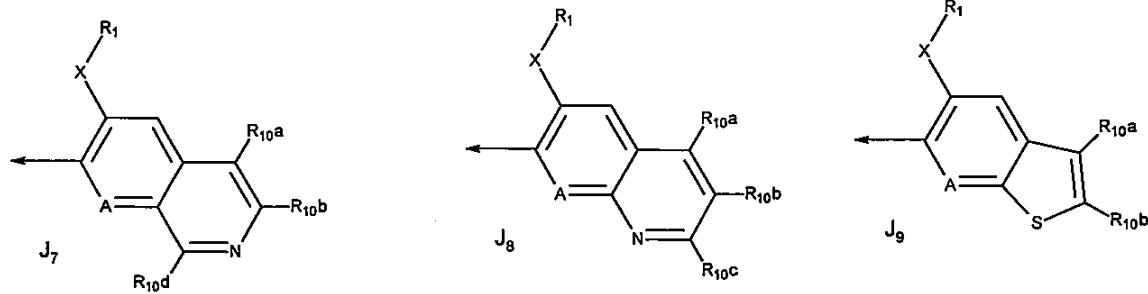
【化 2 6】



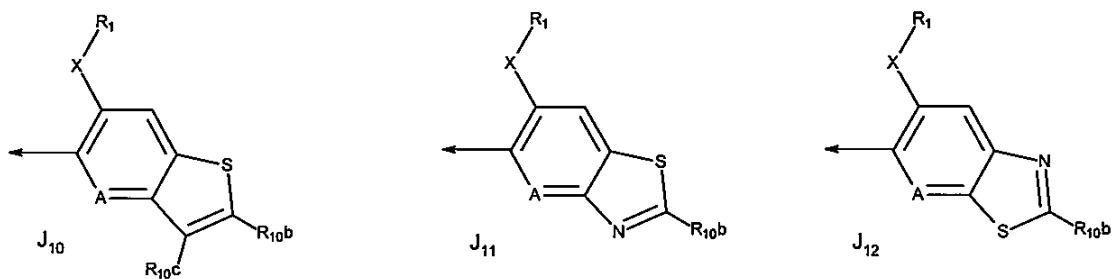
10



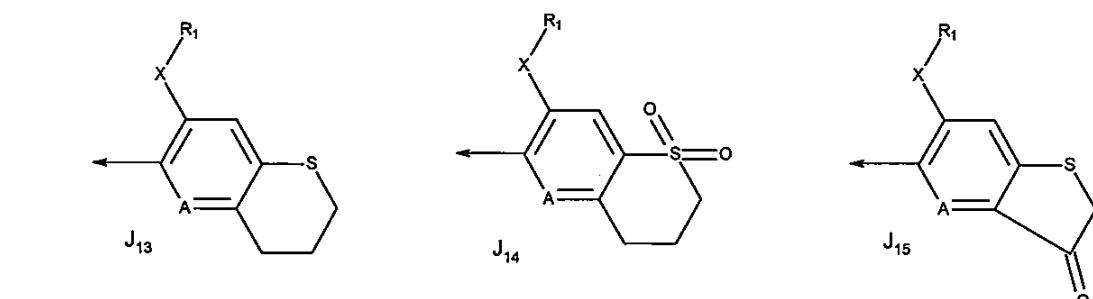
20



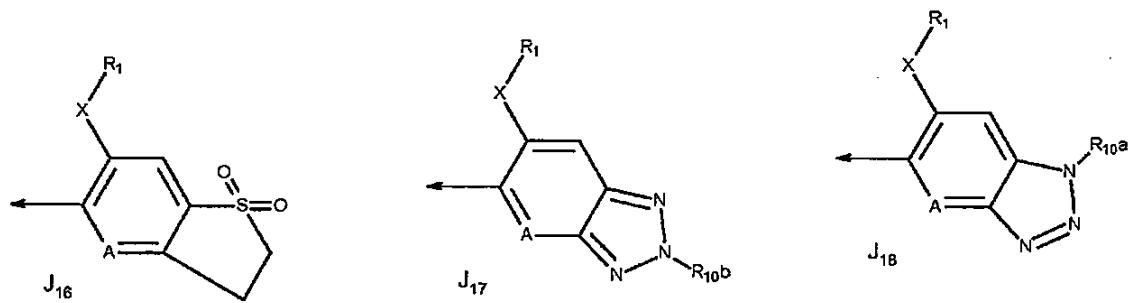
30



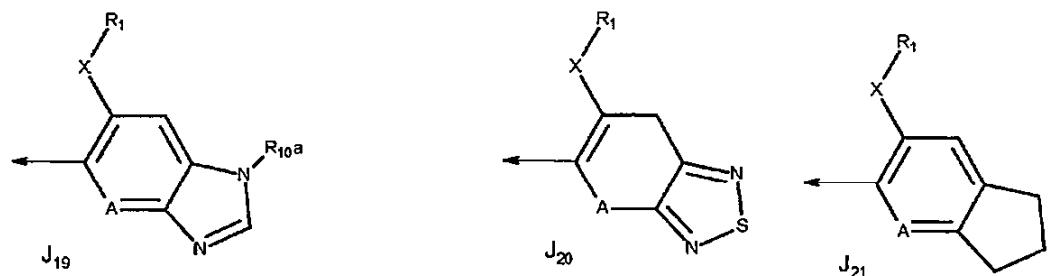
40



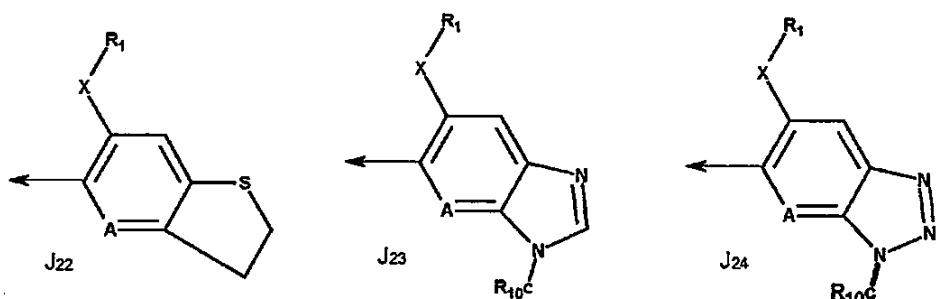
【化 27】



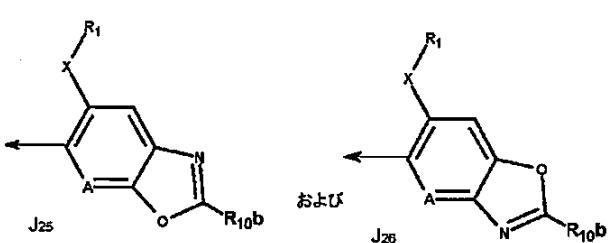
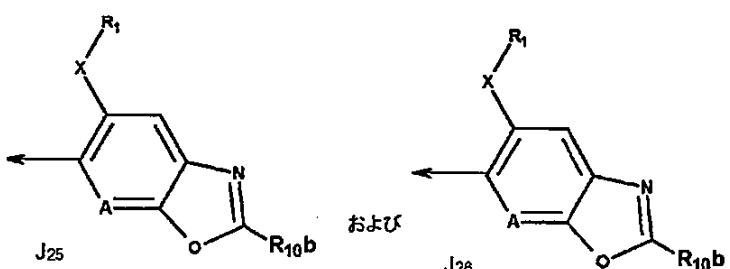
10



20



30



40

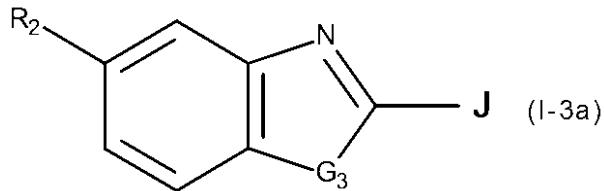
からなる群から選択され、A、G₃、R₁、R₂、X、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、R_{10d}が、実施形態(C 1)で定義されるとおりである)
の化合物である。

【0047】

実施形態(C 3)：

さらなる好ましいものは、式I-3a

【化28】



10

(式中、Jが、実施形態(C2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)

の化合物である。

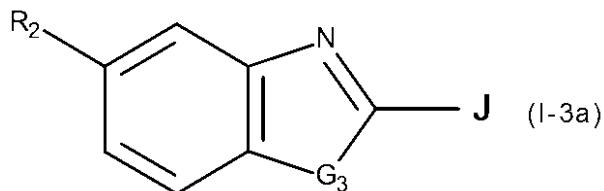
【0048】

実施形態(C4)：

さらなる好ましいものは、式I-3a

30

【化29】



40

(式中、Jが、実施形態(C2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキルであり；

R₂が、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシまたはC₁～C₄ハロアルキルであり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C

50

$C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル - $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロハロアルキル - $C_1 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである)の化合物である。

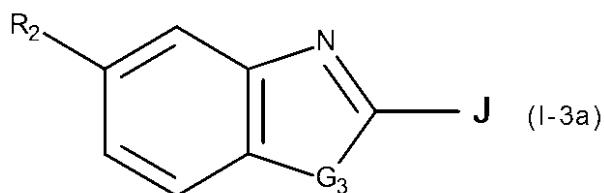
【0049】

実施形態(C5)：

さらなる好ましいものは、式I-3a

10

【化30】



20

(式中、Jが、実施形態(C2)で定義されるとおりであり、Aが、C-HまたはNであり；
 R_1 が、 $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；
 R_2 が、-OCF₃、-SCF₃、-S(O)CF₃、-S(O)₂CF₃またはCF₃であり；
Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G_3 がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；
R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルである)の化合物である。

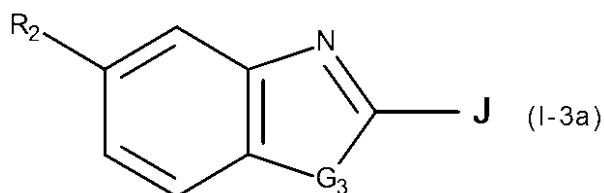
30

【0050】

実施形態(C6)：

さらなる好ましいものは、式I-3a

【化31】



40

(式中、Jが、実施形態(C2)で定義されるとおりであり、Aが、C-HまたはNであり；
 R_1 が、エチルであり；
 R_2 が、CF₃であり；

50

X が、上の式 I で定義されるとおりであり；
 G₃ が N - R₆ であり、ここで、R₆ が、上の式 I で定義されるとおりであり；
 R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、
 シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、プロピル、CF₃、CF₃CH₂-、CH₃O、-
 SCF₃、-S(O)CF₃ または -S(O)₂CF₃ である)
 の化合物である。

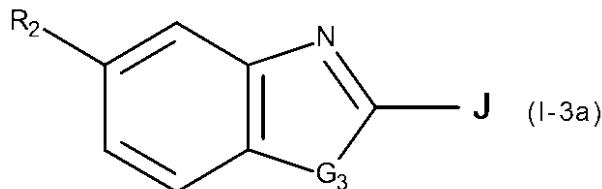
【0051】

実施形態 (C7) :

さらなる好ましいものは、式 I - 3 a

【化32】

10



(式中、J が、実施形態 (C2) で定義されるとおりであり、

20

A が、C - H または N であり；

R₁ が、エチルであり；R₂ が、CF₃ であり；

X が、上の式 I で定義されるとおりであり；

G₃ が N - R₆ であり、ここで、R₆ が、上の式 I で定義されるとおりであり；R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、
 シアノ、メチル、または CF₃ である)

の化合物である。

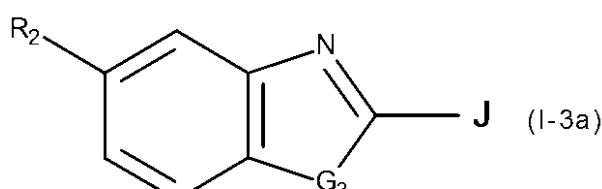
【0052】

実施形態 (C8) :

30

さらなる好ましいものは、式 I - 3 a

【化33】



40

(式中、J が、実施形態 (C2) で定義されるとおりであり、

A が、C - H または N であり；

R₁ が、エチルであり；R₂ が、CF₃ であり；

X が、上の式 I で定義されるとおりであり；

G₃ が N - R₆ であり、R₆ が、上の式 I で定義されるとおりであり；J₂ を除く全ての基 J において、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、および R_{10d} が、互いに独立し
 て、水素であり；R_{10a}、R_{10b}、および R_{10d} が、互いに独立して、J₂ 中で水素であり、R_{10c} が J₂ 中で

50

メチルである)
の化合物である。

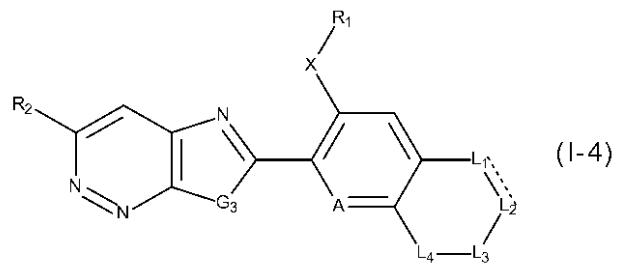
【0053】

上記の式I-3の好ましい実施形態の全てにおいて、Xが、好ましくは、SまたはSO₂であり、Xの定義から独立して、R₆がメチルである。

【0054】

式Iの化合物のさらなる好ましい基は、式I-4

【化34】



10

(式中、置換基X、A、R₁、R₂、R₆、G₃、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりである)

20

の化合物によって表される。

【0055】

実施形態(D1)：

式I-4

(式中、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄アルキルまたはC₃～C₆シクロアルキルであり；

R₂が、ハロゲン、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフイニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄ハロアルキル、シアノであり、またはハロゲン、シアノおよびC₁～C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC₃～C₆シクロアルキルであり；

30

XおよびG₃が、上の式Iで定義されるとおりであり；

L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシリル、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₃～C₆シクロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₆ハロシクロアルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル-C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₂～C₄アルキルカルボニル、C₂～C₆アルコキシカルボニル、-SF₅であり；さらに、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}およびR_{10d}のうちの1つが、オキソであり得る)

40

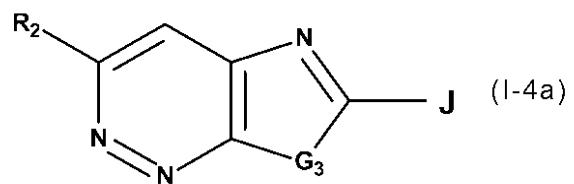
の化合物が好ましい。

【0056】

実施形態(D2)：

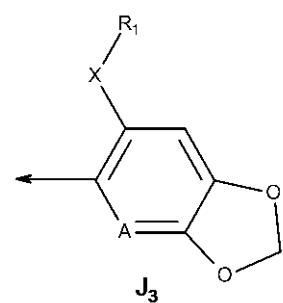
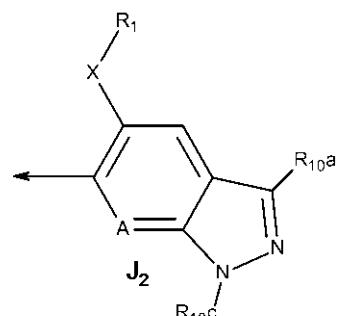
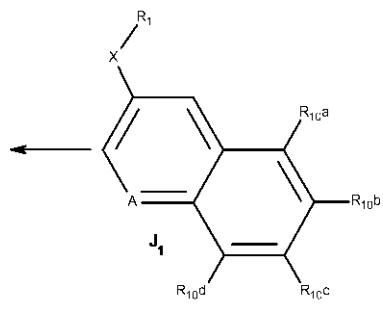
さらなる好ましいものは、式I-4a

【化 3 5】

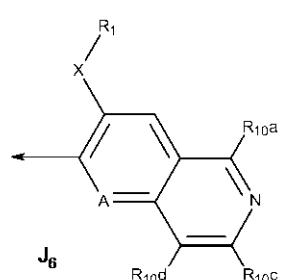
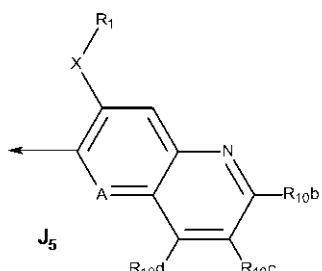
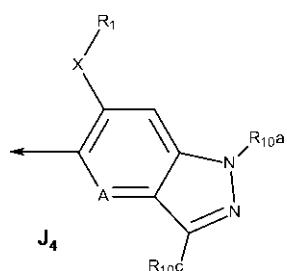
(式中、 J が、

10

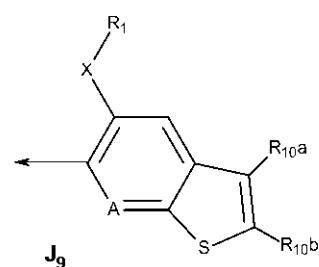
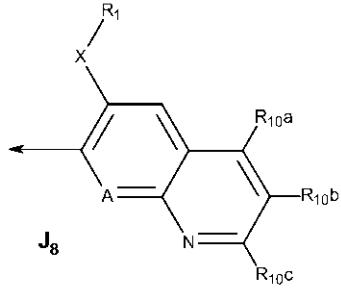
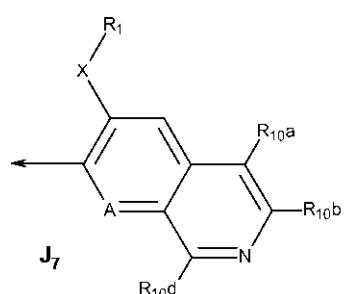
【化 3 6】



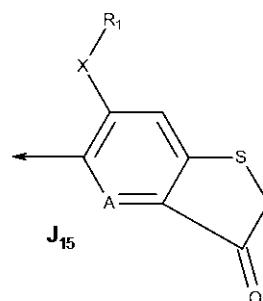
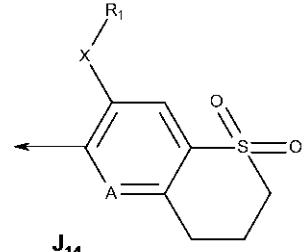
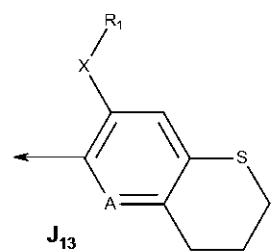
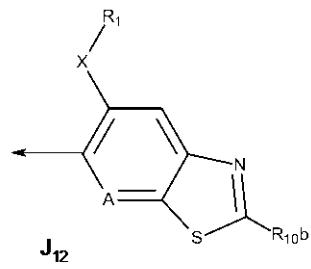
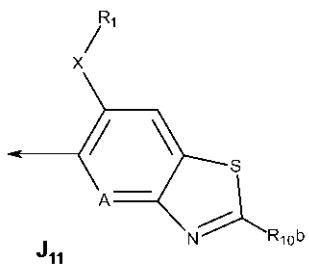
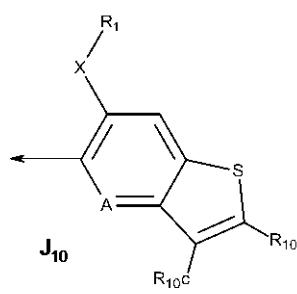
10



20

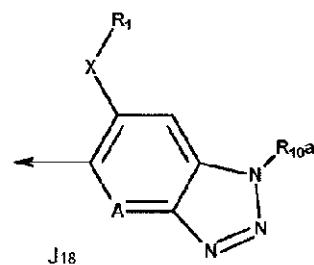
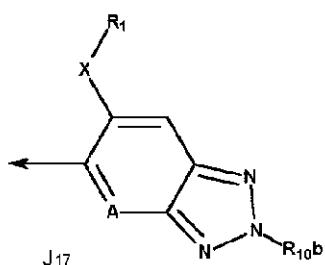
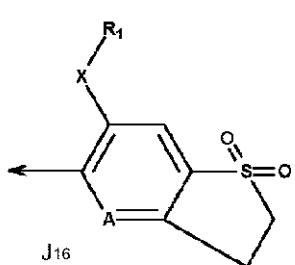


30

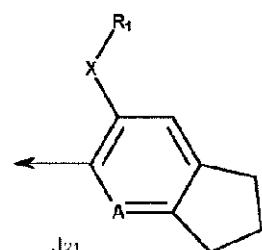
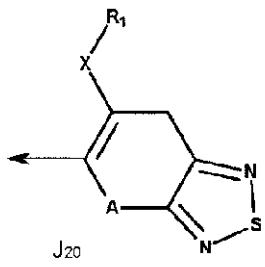
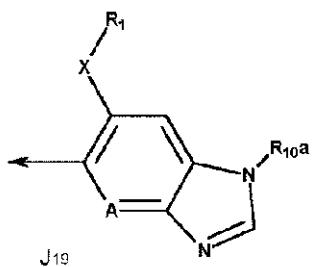


40

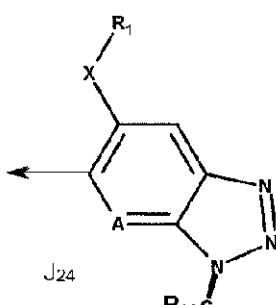
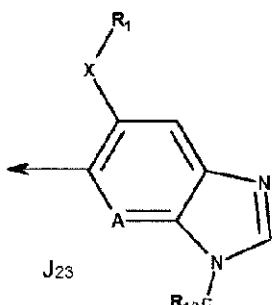
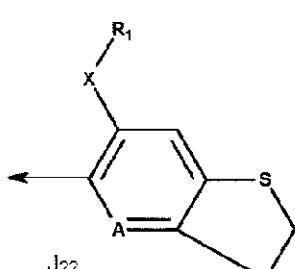
【化37】



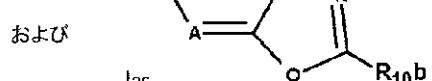
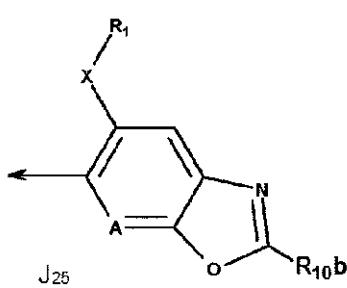
10



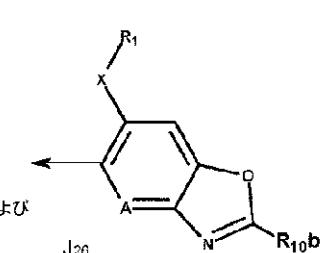
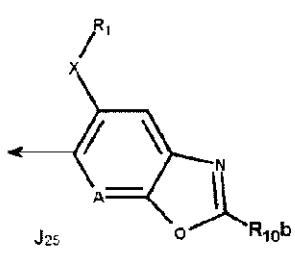
20



30



40



からなる群から選択され、A、G₃、R₁、R₂、X、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、R_{10d}が、実施形態(D1)で定義されるとおりである)
の化合物である。

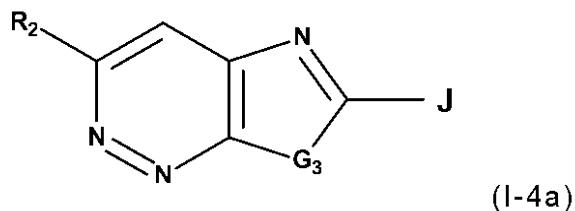
【0057】

実施形態(D3)：

さらなる好ましいものは、式I-4a

50

【化38】



(式中、Jが、実施形態(D2)で定義されるとおりであり、

10

Aが、C-HまたはNであり；

R1が、C1～C4アルキル、C3～C6シクロアルキル-C1～C4アルキルまたはC3～C6シクロアルキルであり；

R2が、ハロゲン、C1～C4ハロアルキルスルファニル、C1～C4ハロアルキルスルフィニル、C1～C4ハロアルキルスルホニル、C1～C4ハロアルコキシ、C1～C4ハロアルキル、シアノまたはC3～C6シクロアルキルであり；

XおよびG3が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R10a、R10b、R10c、およびR10dが、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C1～C6アルキル、C2～C6アルケニル、C2～C6アルキニル、C3～C6シクロアルキル、C3～C6シクロアルキル-C1～C4シクロアルキル、C1～C4ハロアルキル、C2～C6ハロアルケニル、C2～C6ハロアルキニル、C3～C6ハロシクロアルキル、C3～C6シクロハロアルキル-C1～C4シクロアルキル、C1～C4アルコキシ、C1～C4ハロアルコキシ、C1～C4アルキルチオ、C1～C4アルキルスルフィニル、C1～C4アルキルスルホニル、C1～C4ハロアルキルチオ、C1～C4ハロアルキルスルフィニルまたはC1～C4ハロアルキルスルホニルである)

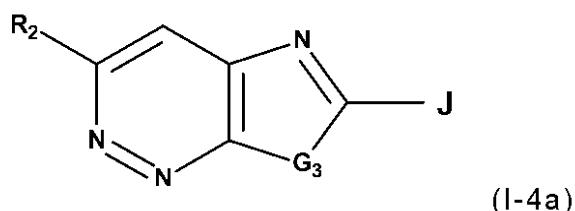
の化合物である。

【0058】

実施形態(4)：

さらなる好ましいものは、式I-4a

【化39】



(式中、Jが、実施形態(D2)で定義されるとおりであり、

40

Aが、C-HまたはNであり；

R1が、C1～C4アルキルであり；

R2が、C1～C4ハロアルキルスルファニル、C1～C4ハロアルキルスルフィニル、C1～C4ハロアルキルスルホニル、C1～C4ハロアルコキシまたはC1～C4ハロアルキルであり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G3がN-R6であり、ここで、R6が、上の式Iで定義されるとおりであり；

R10a、R10b、R10c、およびR10dが、互いに独立して、水素、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシル、C1～C6アルキル、C2～C6アルケニル、C2～C6アルキニル、C3～C6シクロアルキル、C3～C6シクロアルキル-C1～C4シクロアルキル、C1～C4ハロアルキル、C2～C6ハロアルケニル、C2～C6ハロアルキニル、C3～C6ハロシクロアルキル、C3～C6シクロハロアルキル-C1～C4シクロアルキル、C1～C4アルコキシ、C1～C4ハロアルコキシ、C1～C4アルキルチオ、C1～C4アルキルスルフィニル、C1～C4アルキルスルホニル、C1～C4ハロアルキルチオ、C1～C4ハロアルキルスルフィニルまたはC1～C4ハロアルキルスルホニルである)

50

ルキル、C₃～C₆シクロハロアルキル - C₁～C₄シクロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)
の化合物である。

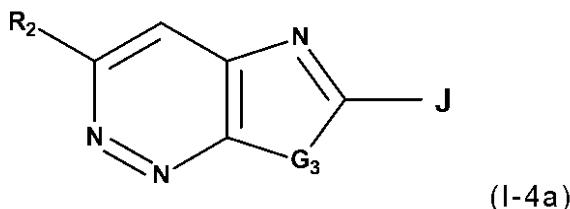
【0059】

実施形態(D5)：

さらなる好ましいものは、式I-4a

【化40】

10



(式中、Jが、実施形態(D2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁が、C₁～C₄アルキルであり；R₂が、-OCF₃、-SCF₃、-S(O)CF₃、-S(O)₂CF₃またはCF₃であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、C₁～C₆アルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₄ハロアルコキシ、C₁～C₄アルキルチオ、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、C₁～C₄ハロアルキルチオ、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニルまたはC₁～C₄ハロアルキルスルホニルである)

の化合物である。

20

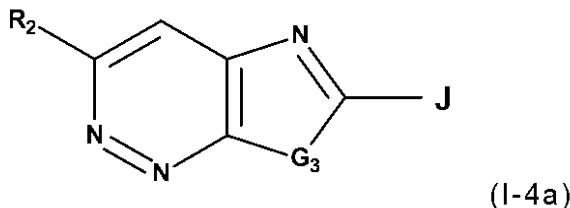
【0060】

実施形態(D6)：

さらなる好ましいものは、式I-4a

【化41】

30



40

(式中、Jが、実施形態(D2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R₁がエチルであり；R₂がCF₃であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

G₃がN-R₆であり、ここで、R₆が、上の式Iで定義されるとおりであり；R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、シアノ、メチル、エチル、イソプロピル、プロピル、CF₃、CF₃CH₂-、CH₃O、-

50

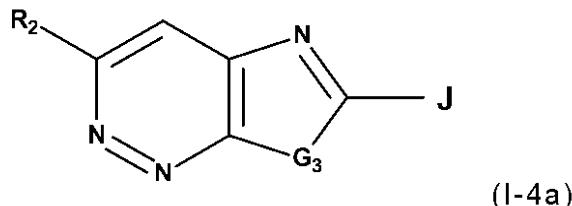
S-CF_3 、 $-\text{S(O)CF}_3$ または $-\text{S(O)}_2\text{CF}_3$ である)
の化合物である。

【0061】

実施形態(D7) :

さらなる好ましいものは、式I-4a

【化42】



10

(式中、Jが、実施形態(D2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R1が、エチルであり；

R2が、 CF_3 であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

 G_3 が $\text{N}-\text{R}_6$ であり、ここで、 R_6 が、上の式Iで定義されるとおりであり；

20

 R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、水素、Br、Cl、I、F、シアノ、メチル、または CF_3 である)

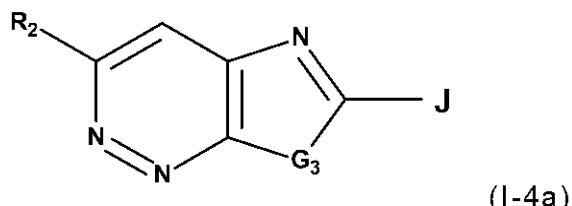
の化合物である。

【0062】

実施形態(D8) :

さらなる好ましいものは、式I-4a

【化43】



30

(式中、Jが、実施形態(D2)で定義されるとおりであり、

Aが、C-HまたはNであり；

R1が、エチルであり；

R2が、 CF_3 であり；

Xが、上の式Iで定義されるとおりであり；

40

 G_3 が $\text{N}-\text{R}_6$ であり、 R_6 が、上の式Iで定義されるとおりであり； J_2 を除く全ての基Jにおいて、 R_{10a} 、 R_{10b} 、 R_{10c} 、および R_{10d} が、互いに独立して、水素であり； R_{10a} 、 R_{10b} 、および R_{10d} が、互いに独立して、 J_2 中で水素であり、 R_{10c} が J_2 中でメチルである)

の化合物である。

【0063】

上記の式I-4の好ましい実施形態の全てにおいて、Xが、好ましくは、Sまたは SO_2 であり、Xの定義から独立して、 R_6 がメチルである。

【0064】

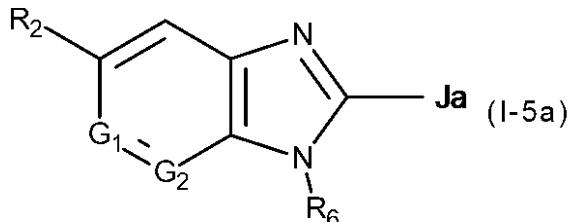
50

好ましい実施形態 A 2 ~ A 8、B 2 ~ B 8、C 2 ~ C 8 および D 2 ~ D 8 の全てにおいて、J が、好ましくは、J₁、J₂、J₃、J₄、J₅、J₆、J₁₂、J₁₇、J₁₈、J₂₄、J₁₉、J₂₀ または J₂₃ であり、特に、J が J₁ である。

【0065】

式 I のさらなる好ましい化合物は、式 I - 5 a

【化44】



10

(式中、

G₁ が、N または CH であり；

G₂ が、N または CH であり；

R₂ が、C₁ ~ C₄ハロアルキルであり；

A が、N または CH であり；

R₆ が、C₁ ~ C₄アルキルであり；

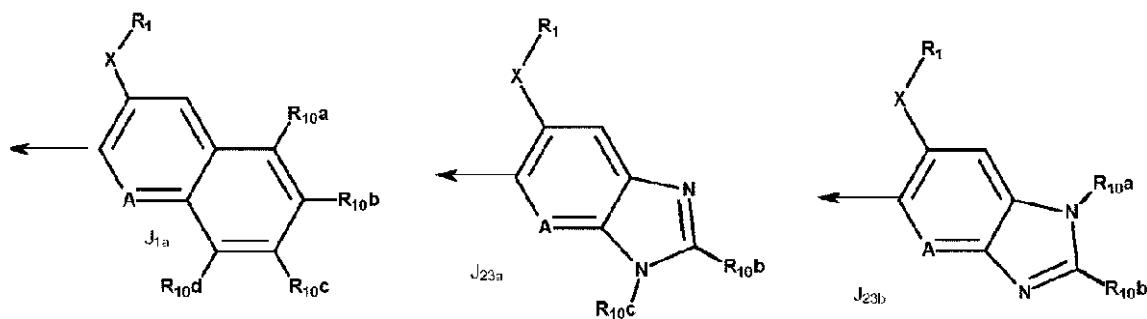
X が、S または SO₂ であり；

R₁ が、C₁ ~ C₄アルキルであり；

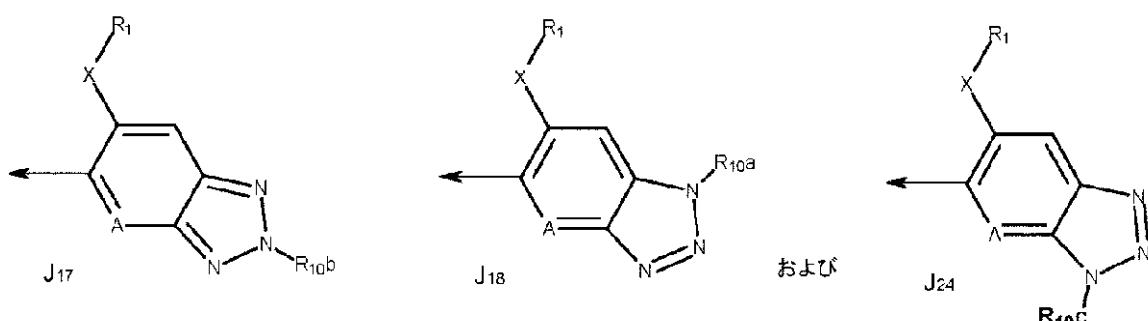
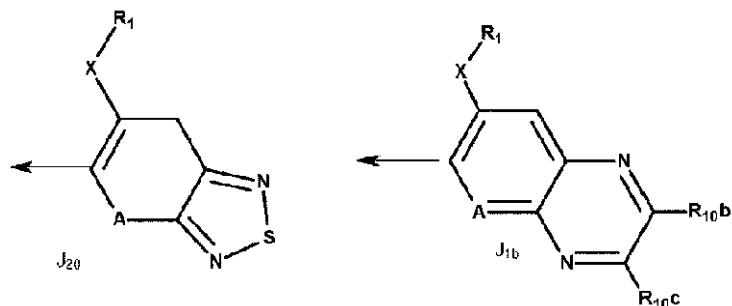
J a が、

20

【化45】



10



20

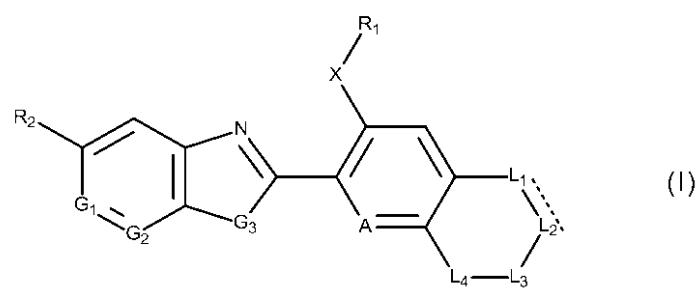
からなる群から選択され、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、シクロプロピル、C₁～C₄アルキルまたはC₁～C₄ハロアルキルである)

30

の化合物によって表される。

【0066】

式Iの特に好ましい化合物において、
【化46】



40

R₁が、C₁～C₄アルキルであり；
R₂が、C₁～C₄ハロアルキルであり；
Xが、SまたはSO₂であり；
Aが、CHまたはNであり；
G₁が、CHまたはNであり；

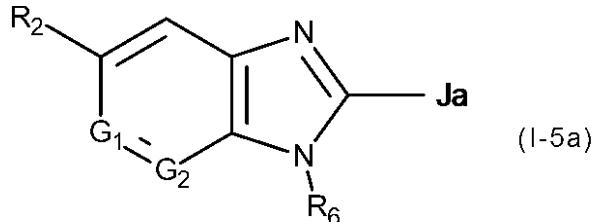
50

G_2 が、C H または N であり；
 G_3 が、N (C₁ ~ C₄アルキル) であり；
 L_1 、 L_2 、 L_3 および L_4 が、 L_1 および L_4 が結合される2個の炭素原子と一緒に、芳香族または部分的に飽和した炭素環式または複素環式環系を形成し；ここで、
 L_1 が、C H、N H、N - C₁ ~ C₄アルキルまたはS であり；
 L_2 が、C H、C (C₁ ~ C₄アルキル)、C (C₁ ~ C₄ハロアルキル)、N またはS であり；
 L_3 が、C H、N またはN - C₁ ~ C₄アルキルであり；
 L_4 が、存在しないかまたはN であり；
ただし、3つ以下の L 基が窒素であり得る。

10

【0067】

式I-5aの特に好ましい化合物において、
【化47】

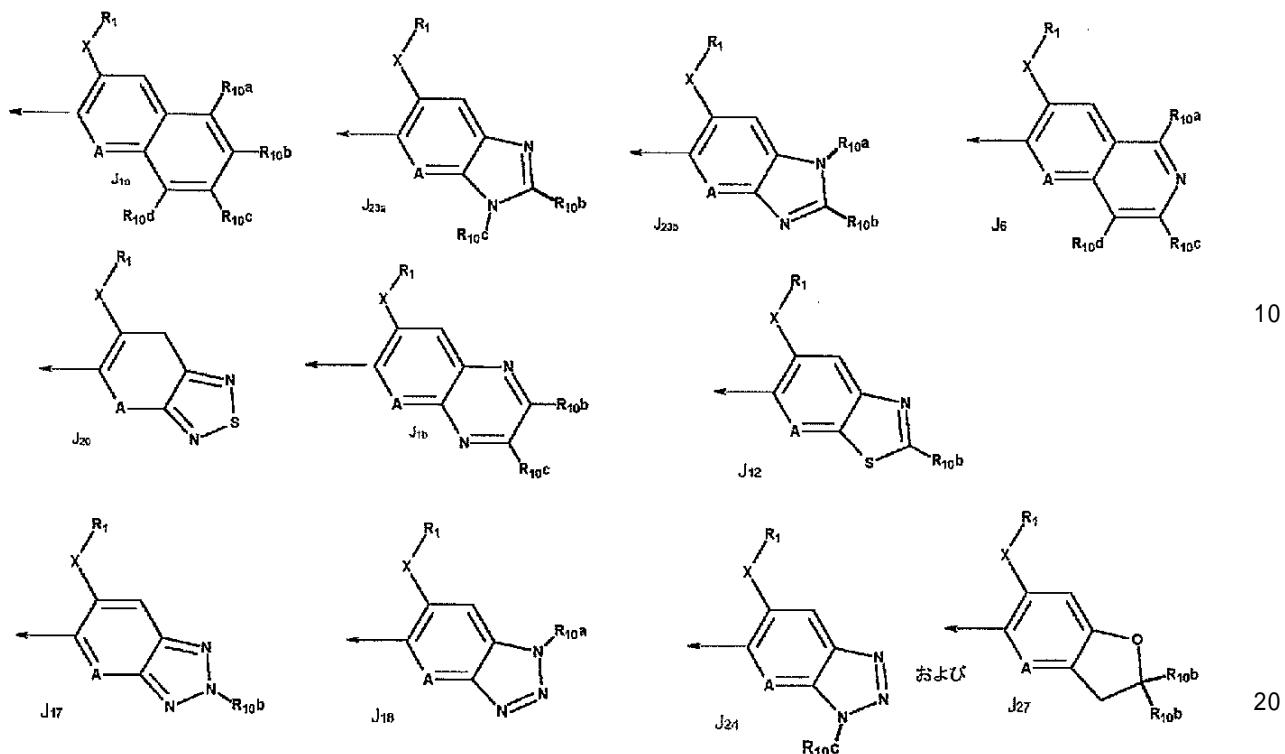


20

G_1 が、N またはC H であり；
 G_2 が、N またはC H であり；
 R_2 が、C₁ ~ C₄ハロアルキル、C₁ ~ C₄ハロアルキルスルファニルまたはC₁ ~ C₄ハロアルキルスルフィニルであり；
A が、N またはC H であり；
R₆が、C₁ ~ C₄アルキルであり；
X が、S またはSO₂ であり；
R₁が、C₁ ~ C₄アルキルであり；
Ja が、

30

【化48】



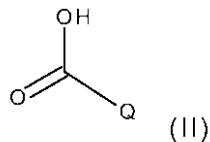
からなる群から、特に、J_{1a}、J_{23a}、J_{23b}、J₆、J₂₀、J_{1b}、J₁₂、J₁₇、J₁₈、およびJ₂₄、最も好ましくは、J_{1a}、J_{23a}、J_{23b}、J₆、J₂₀、J₁₂、J₁₇、J₁₈、およびJ₂₄から選択され；

式中、R_{10a}、R_{10b}、R_{10c}、およびR_{10d}が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、シクロプロピル、C₁～C₄アルキルおよびC₁～C₄ハロアルキルからなる群から選択される。

【0068】

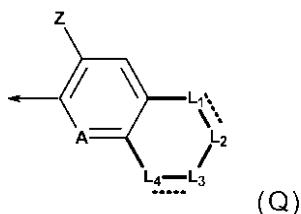
式(I)の化合物を調製するための本発明に係る方法は、当業者に公知であるか、または例えれば国際公開第2009/131237号、国際公開第2011/043404号、国際公開第2011/040629号、国際公開第2010/125985号、国際公開第2012/086848号、国際公開第2013/018928号、国際公開第2013/191113号、国際公開第2013/180193号および国際公開第2013/180194号に記載されている方法によって行われ、150～250の温度で、例えればポリリン酸などの脱水剤の存在下で、式II

【化49】



(式中、Qが、基

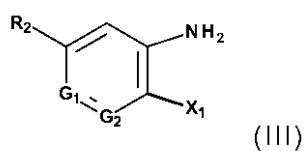
【化 5 0】



であり、ここで、Zが、X - R₁または脱離基、例えばハロゲンであり、X、R₁、L₁、L₂、L₃、L₄およびAが、上の式Iで記載されるとおりであり、ラジカルQ中の矢印が、式IIの化合物中のカルボキシリル基の炭素原子への結合点を示す)の化合物と、

式II

【化 5 1】

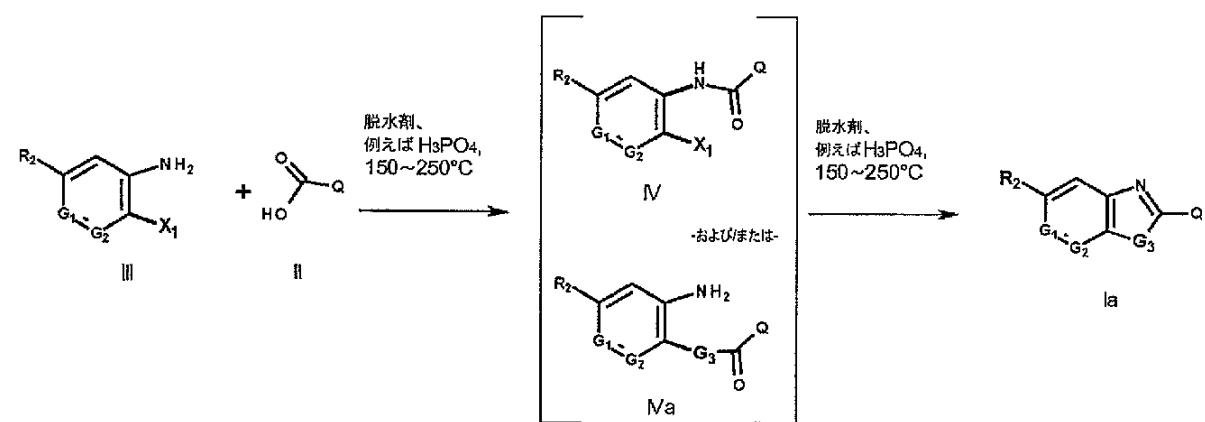


(式中、R₆、R₂、G₁およびG₂が、上の式Iで記載されるとおりであり、X₁が、OH、SHまたはNH - R₆である)の化合物との反応により、式Ia(式中、置換基が、上記および式Iで記載されるとおりである)の化合物を得ることを含む。

【0069】

このような方法は周知であり、例えば国際公開第2008/128968号または国際公開第2006/003440号に記載されている。この方法は、式Ia:

【化 5 2】

スキーム1

の化合物についてのスキーム1にまとめられている。

【0070】

スキーム1に見られるように、式Ia(式中、R₂、G₁、G₂およびG₃が、式Iの化合物中に記載されるとおりである)の化合物の形成は、式IV(および/またはその位置異性体IVa)の化合物の仲介によって起こる。中間体IVまたは中間体IVaは、純粋な実体として生じてもよく、または中間体IVおよびIVaは、位置異性体アシル化生成物の混合物として生じ得る。多くの場合、単離され、任意選択的に精製され得るこのような中間体IV/IVaを介して式(I)の化合物をこのように調製することが有利である。

これは、スキーム2:

10

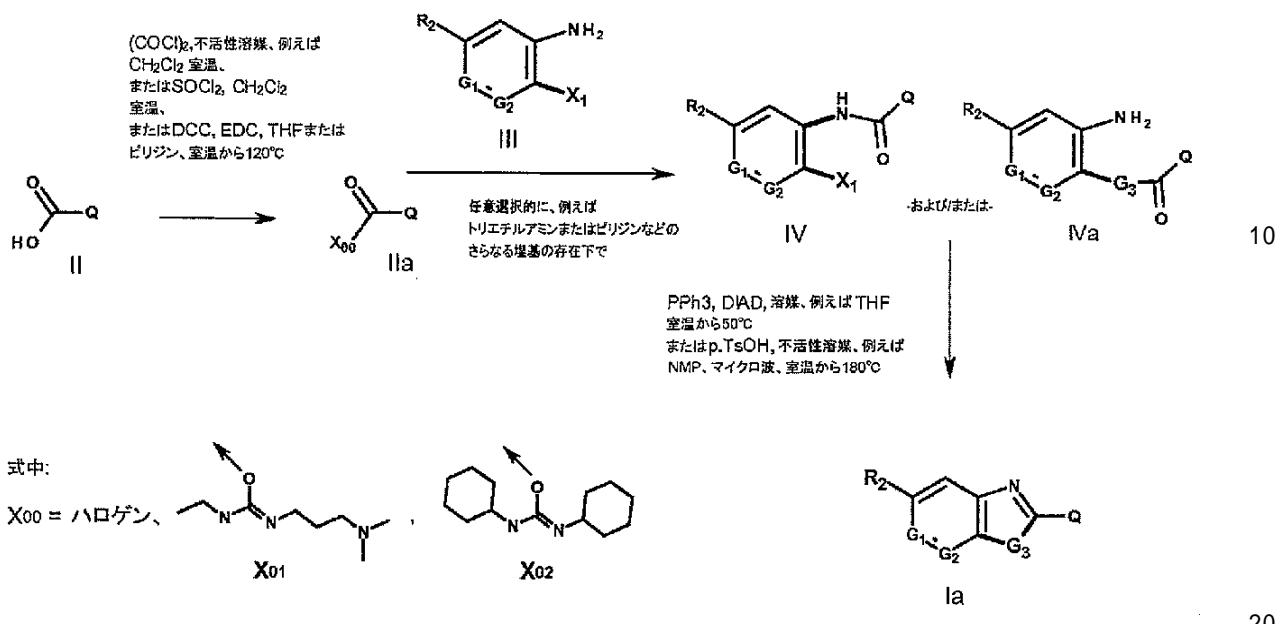
20

30

40

50

【化53】

スキーム2

中の式 I a の化合物について示される。

【0071】

式 I V および / または I V a (またはその混合物)、またはその塩 (式中、Q が上に定義されるとおりであり、R₆、R₂、G₁、G₂ および G₃ が、上の式 I で記載されるとおりであり、X₁ が、上述されるとおりである) の化合物は、以下によって調製され得る。

i) 活性化種 I I a (式中、Q が上に定義されるとおりであり、X₀₀ が、ハロゲン、好ましくは、塩素である) を形成するための、当業者に公知であり、かつ例えれば Tetrahedron, 2005, 61 (46), 10827 - 10852 に記載されている方法による、式 I I (式中、Q が上に定義されるとおりである) の化合物の活性化。例えば、化合物 I I a (式中、X₀₀ が、ハロゲン、好ましくは、塩素である) が、20 ~ 100 、好ましくは、25 の温度で、塩化メチレン CH₂Cl₂ またはテトラヒドロフラン THF などの不活性溶媒中の触媒量の N, N - ジメチルホルムアミド DMF の存在下で、例えば、塩化オキサリル (COCl)₂ または塩化チオニル SOC₁₂ による I I の処理によって形成される。あるいは、例えば、1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド EDC またはジシクロヘキシリカルボジイミド DCC による式 I I の化合物の処理は、25 ~ 180 の温度で、任意選択的にトリエチルアミンなどの塩基の存在下において、ピリジンまたはテトラヒドロフラン THF などの不活性溶媒中で活性化種 I I a (式中、X₀₀ がそれぞれ X₀₁ または X₀₂ である) を生成し；続いて、

i i) 式 I V および / または I V a の化合物 (またはその混合物) を形成するための、0 ~ 80 の温度で、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ジオキサンまたはトルエンなどの不活性溶媒中で、任意選択的にトリエチルアミンまたはピリジンなどの塩基の存在下における式 I I I (またはその塩) (式中、R₆、R₂、G₁ および G₂ が、上の式 I で記載されるとおりである) の化合物による活性化種 I I a の処理。

【0072】

式 I V および / または I V a の化合物 (またはその混合物) はさらに、例えば、任意選択的にマイクロ波条件下で 25 ~ 180 、好ましくは、100 ~ 170 の温度において、N - メチルピロリジン NMP などの不活性溶媒中で、例えばメタンスルホン酸、またはパラ - トルエンスルホン酸 TSOH などの酸触媒の存在下で、化合物 I V および / または I V a (またはその混合物) を加熱することによる脱水により、式 I a (式中、Q が上に定義されるとおりであり、R₆、R₂、G₁、G₂ および G₃ が、上の式 I で記載されると

30

40

50

おりである)の化合物へと転化され得る。このような方法は、例えば、国際公開第2010/125985号に既に記載されている。

【0073】

式Ia(式中、Zが上に定義されるとおりであり、Zが、脱離基、例えばハロゲン、好ましくは、フッ素または塩素であり、R₆、R₂、G₁、G₃およびG₂が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物は、好ましくは、25~120の温度において不活性溶媒中で、任意選択的にアルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウム、または水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、または水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物などの好適な塩基の存在下で、式V



10

の化合物またはその塩(式中、R₁が、式Iにおいて定義されるとおりである)と反応されて、式 Ib(式中、R₁が、上の式Iで記載されるとおりであり、R₆、A、R₂、L₁、L₂、L₃、L₄、G₁、G₂およびG₃が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物が生成され得る。使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトニトリルなどのニトリルまたはN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドンもしくはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒が挙げられる。同様の化学反応が、例えば国際公開第2013/018928号に既に記載されている。式Vの化合物の塩の例としては、式Va

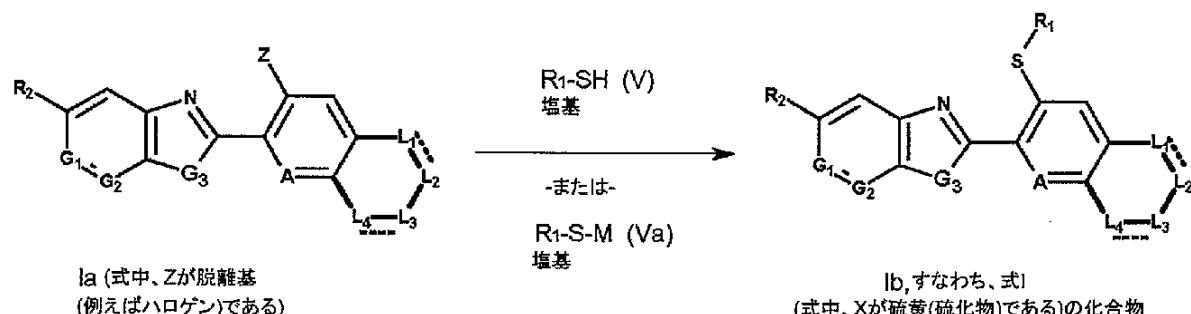


20

(式中、R₁が上に定義されるとおりであり、Mが、例えば、ナトリウムまたはカリウムである)の化合物が挙げられる。これは、スキーム3:

【化54】

スキーム3



30

中の式Ibの化合物について示される。

【0074】

あるいは、この反応は、Perriero et al. Tetrahedron 2005, 61, 5253-5259によって記載されているように、100~160、好ましくは、140の温度で、不活性溶媒、例えば、キシレン中においてキサントホスなどのリンリガンドの存在下で、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)などのパラジウム触媒の存在下で行われ得る。

40

【0075】

式I(式中、Xが、SO(スルホキシド)および/またはSO₂(スルホン)である)の化合物の部分群は、例えば、他の酸化剤の中でも特に、m-クロロペルオキシ安息香酸(mCPBA)、過酸化水素、オキソソ、過ヨウ素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウムまたは次亜塩素酸tert-ブチルなどの試薬を含む、式I(式中、XがSである)の対応する硫化物化合物(すなわち、上の式Ibの化合物)の酸化反応によって得られる。酸化反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、ジクロロメタンおよびクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素; メタノールおよびエタ

50

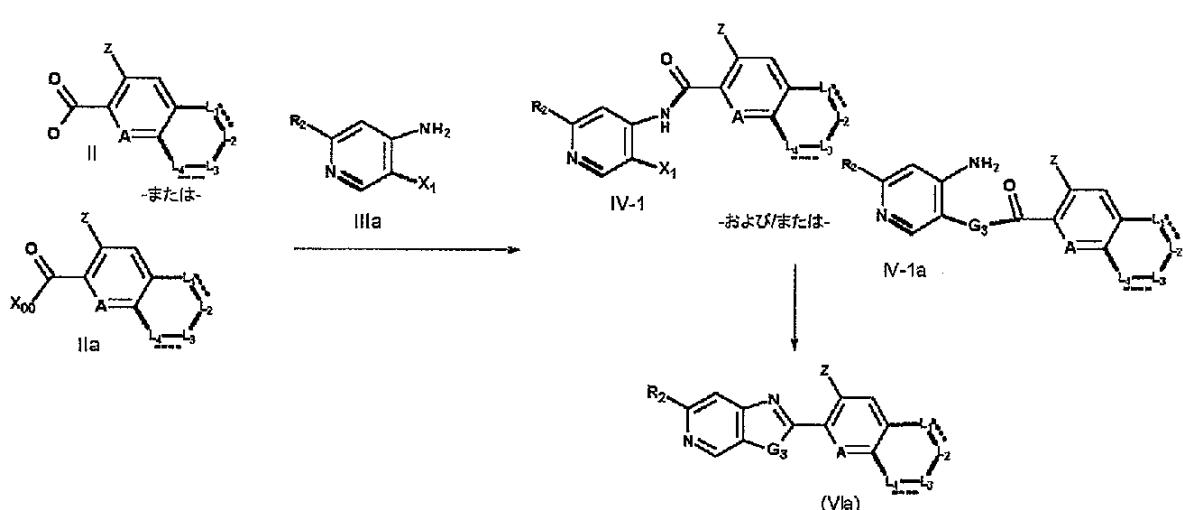
ノールなどのアルコール；酢酸；水；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用される酸化剤の量は、スルホキシド化合物I（式中、 $X = SO$ ）を生成するためには、1モルの硫化物化合物Ibに対して、一般に、1～3モル、好ましくは、1～1.2モル、スルホン化合物I（式中、 $X = SO_2$ ）を生成するためには、1モルの硫化物化合物Ibに対して、好ましくは、2～2.2モルの酸化剤である。このような酸化反応は、例えば、国際公開第2013/018928号に開示されている。

【0076】

より詳細には、式VIa（式中、Zが、 $X - R_1$ または脱離基、例えばハロゲンであり、X、 R_1 、 R_2 、 R_6 およびAが、上の式Iで記載されるとおりであり、 G_1 がNであり、 G_3 がN- R_6 であり、 G_2 がC-Hであり、 X_1 がNHR₆である）の化合物は、上記の式II/IaおよびIIIaおよびIIIbの化合物からの式VIaの化合物の調製（スキーム1および2を参考）と類似の条件下での、式IIまたはIIa（式中、Zが、 $X - R_1$ または脱離基、例えばハロゲンであり、X、 R_1 およびAが、上の式Iで記載されるとおりであり、 X_{00} が上述されるとおりである）の化合物と、式IIIa（式中、 R_6 および R_2 が、上の式Iで記載されるとおりである）の化合物との間の反応によって調製され得る。これは、スキーム4：

【化55】

スキーム4



中の式VIaの化合物について示される。

【0077】

スキーム1および2中の説明と類似して、式VIaの化合物の形成は、任意選択的に単離され、精製され得る、式IV-1および/またはIV-1aの化合物（またはその混合物）、またはその塩の仲介によって起こる。

【0078】

式IIIa（式中、 R_6 、および R_2 が、上の式Iで記載されるとおりである）の化合物は、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミドまたはアセトニトリルなどの適切な溶媒中において、炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸セシウム、または水素化ナトリウムなどの塩基の存在下での $R_6 - X_{LG}$ （式中、 R_6 が、上の式Iで記載されるとおりであり、 X_{LG} が、ハロゲン、好ましくは、ヨウ素、臭素または塩素などの脱離基である）による直接のアルキル化により、式VI（式中、 R_2 が、上の式Iで記載されるとおりである）のジアミノ化合物から調製され得る（スキーム5）。

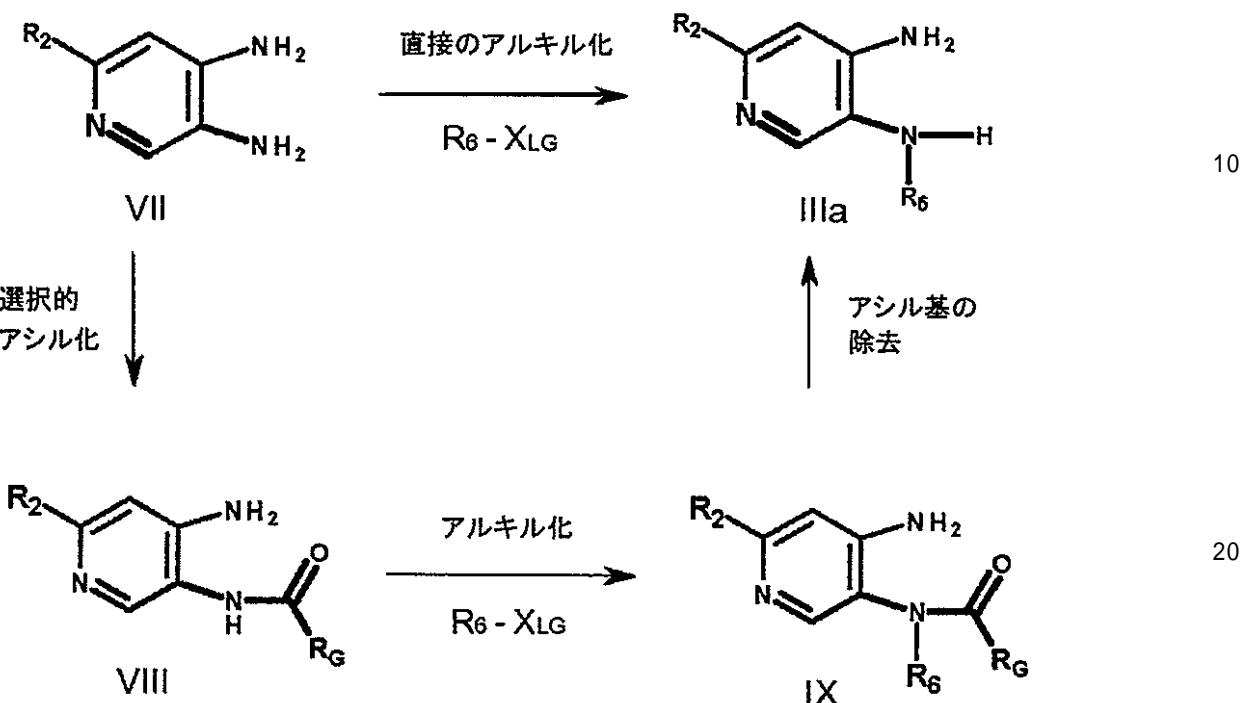
10

20

30

40

【化56】

スキーム5

【0079】

あるいは、式VIIの化合物から式IIIaの化合物を調製するための順序は、i. 例えれば、テトラヒドロフランまたはジオキサンなどのエーテル溶媒中で式VII（式中、 R_2 が、上の式Iで記載されるとおりであり、アシル化剤が、例えれば二炭酸ジ-tert-ブチルである）の化合物を形成するための、化合物VIIの選択的アシル化（ R_G がtert-ブチルオキシである化合物VIIをもたらす）；ii. 式IX（式中、 R_6 および R_2 が、上の式Iで記載されるとおりであり、 R_G が例えればtert-ブチルオキシである）の化合物を生成するための、例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミドまたはアセトニトリルなどの適切な溶媒中における炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸セシウム、または水素化ナトリウムなどの塩基の存在下での R_6-X_{LG} （式中、 R_6 が、上の式Iで記載されるとおりであり、 X_{LG} が、ハロゲン、好ましくは、ヨウ素、臭素または塩素などの脱離基である）による化合物VIIのアルキル化；および最後にiii. 式IIIa（式中、 R_6 、および R_2 が、上の式Iで記載されるとおりである）の化合物を形成するための、化合物IXの脱アシル化を含み得る。 R_G が例えればtert-ブチルオキシである場合、アシル基除去の条件は、例えれば、エーテル（例えればジエチルエーテル、テトラヒドロフランまたはジオキサン）または酢酸などの溶媒中のハロゲン化水素、特に、塩化水素または臭化水素による化合物IXの処理を含む。あるいは、化合物IXはまた、例えればジクロロメタンまたはクロロホルムなどの不活性溶媒の任意選択的な存在下で、例えれば、トリフルオロ酢酸で処理されて、式IIIaの化合物が形成され得る。

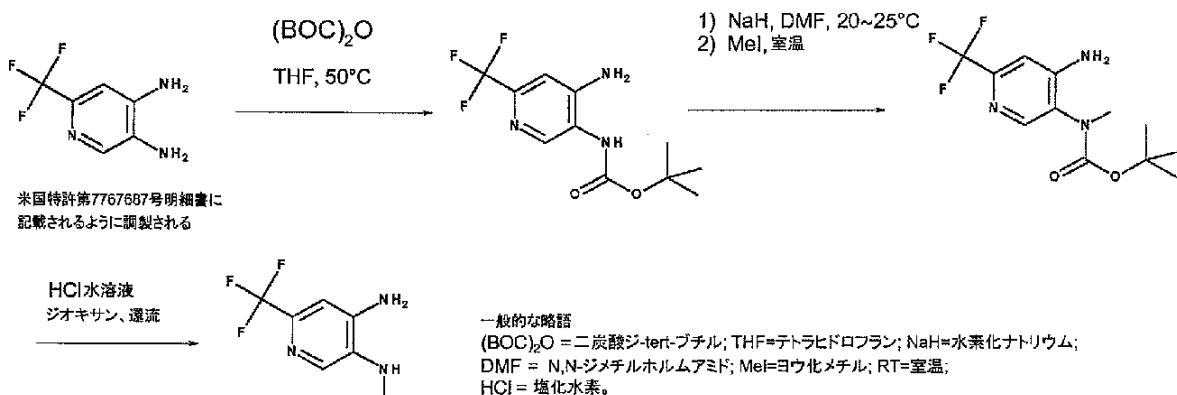
30

40

【0080】

式IIIaの化合物を調製するためのこの代替的な手法は、 R_2 が CF_3 であり、 R_6 が CH_3 であり、 R_G がtert-ブチルオキシである特定の状況についてスキーム6中でより詳細に記載されている。

【化57】

スキーム6

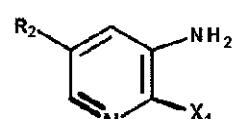
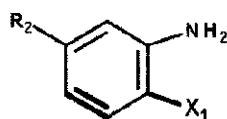
【0081】

式(VIII)のジアミノ化合物は、公知であるか、市販されているか、または例えば米国特許第7767687号明細書に記載されている調製方法と類似の、当業者に公知の方法によって作製され得る。

【0082】

式IIIbおよびIIIc

【化58】

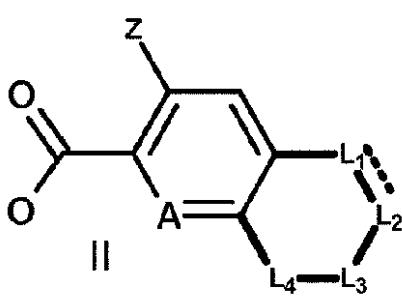
スキーム7

(式中、X₁が、OH、SHまたはNH-R₆である)のジアミノ化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。

【0083】

式III

【化59】

スキーム8

(式中、Zが、X-R₁または脱離基または例えばハロゲン、アミンまたはニトロなどの

10

20

30

40

50

脱離基中で変換され得る基であり、X、R₁、L₁、L₂、L₃、L₄およびAが、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。

【0084】

式IIc (式中、Qが上に定義されるとおりであり、Zが、脱離基、例えばハロゲン、好ましくは、フッ素、塩素であり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりであり、Rが、アルキルまたは水素である)の化合物は、好ましくは、25~120の温度において不活性溶媒中で、任意選択的にアルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウム、または水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、または水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物などの好適な塩基の存在下で、式V



の化合物またはその塩(式中、R₁が、式Iにおいて定義されるとおりである)と反応され、式IID (式中、Rが、アルキルまたは水素であり、R₁が、上の式Iで記載されるとおりであり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物が生成され得る。使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトニトリルなどのニトリルまたはN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドンもしくはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒が挙げられる。

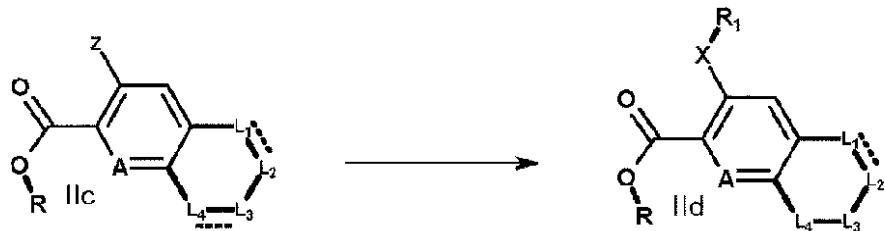
式Vの化合物の塩の例としては、式Va



(式中、R₁が上に定義されるとおりであり、Mが、例えば、ナトリウムまたはカリウムである)の化合物が挙げられる。これは、スキーム9:

【化60】

スキーム9



中の式IIDの化合物について示される。

【0085】

あるいは、式IIc (式中、Zがアミンであり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりであり、Rが、アルキルまたは水素である)の化合物は、ジアゾ化およびジアルキルジスルフィドとの反応により、式IIDの化合物へと変換され得る。この変換は、周知であり、当業者に公知の方法によって作製され得る(例えば、Synthetic Communications, 31(12), 1857-1861; 2001またはOrganic & Biomolecular Chemistry, 6(4), 745-761; 2008を参照)。

【0086】

式IIc (式中、Zがアミンであり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりであり、Rが、アルキルまたは水素である)の化合物は、ジアゾ化および硫化ナトリウムとの反応、続いて還元により、式IIdの化合物へと変換され得る。この変換は、周知であり、当業者に公知の方法によって作製され得る(例えば、米国特許出願公開第20040116734号明細書またはChemische Berichte, 1

10

20

30

40

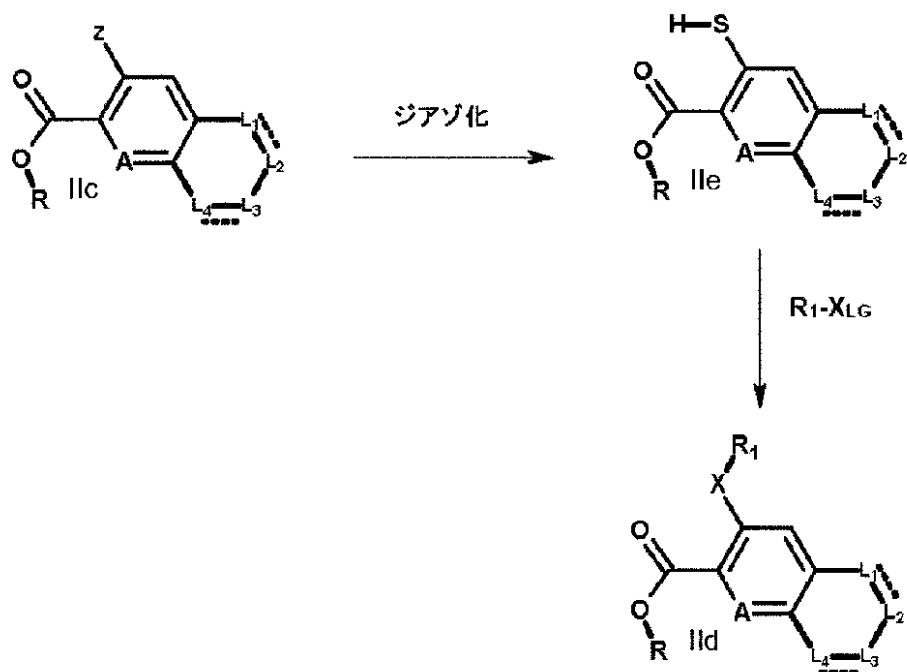
50

20(7), 1151-73; 1987を参照)。例えばN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミドまたはアセトニトリルなどの適切な溶媒中における炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸セシウム、または水素化ナトリウムなどの塩基の存在下でのR₁-X_{LG}(式中、R₁が、上の式Iで記載されるとおりであり、X_{LG}が、ハロゲン、好ましくは、ヨウ素、臭素または塩素などの脱離基である)による化合物IIeのアルキル化により、式IIId(式中、R₁が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物が生成される。スキーム10を参照されたい。

【化61】

スキーム10

10



20

【0087】

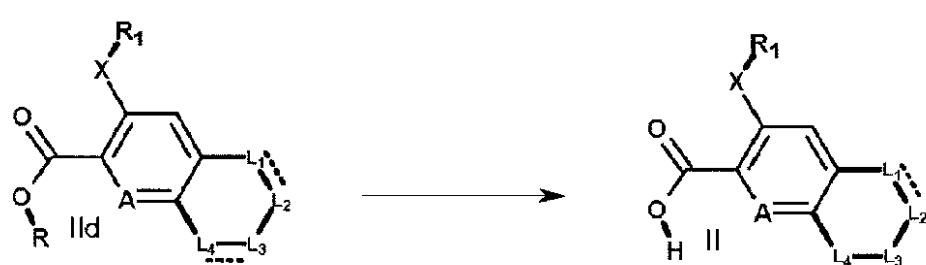
30

式(I I)の化合物は、加水分解による式(I Id)(式中、Rがアルキルである)の化合物の反応によって調製され得る。例えば、Rがメチルまたはエチルである場合、加水分解は、例えば、テトラヒドロフランまたはメタノールなどの溶媒の非存在下または存在下で、水および水酸化カリウムまたは水酸化リチウムなどの塩基を用いて行われ得る。Rが、例えば、tert-ブチルである場合、加水分解は、トリフルオロ酢酸または塩酸などの酸の存在下で行われる。反応は、-120 ~ +130、好ましくは、-100 ~ 100の温度で行われる。スキーム11を参照されたい。

【化62】

スキーム11

40



【0088】

あるいは、式I I の化合物は、式XIIb(式中、R₁が、上の式Iで記載されるとお

50

りであり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物を生成するための、好ましくは、25~120の温度で不活性溶媒中において任意選択的にアルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウム、または水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、または水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物などの好適な塩基の存在下で式Xdの化合物またはその塩(式中、R₁が、式Iにおいて定義されるとおりである)を得るための、式VまたはVa

R₁-SH(V),

R₁-S-M(Va)

の化合物の反応による式(X)(式中、Zが、ニトロまたはフッ素などのハロゲンのような脱離基であり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物の反応によって調製され得る。使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトニトリルなどのニトリルまたはN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドンもしくはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒が挙げられる。式Vの化合物の塩の例としては、式Va

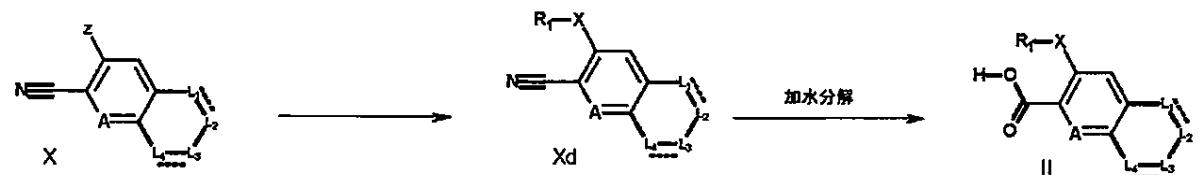
R₁-S-M(Va)

(式中、R₁が上に定義されるとおりであり、Mが、例えば、ナトリウムまたはカリウムである)の化合物が挙げられる。式IIの化合物は、酸性または塩基性条件における、式Xdの化合物のシアノの加水分解によって調製され得る。この変換は、周知であり、当業者に公知の方法によって作製され得る(例えば、Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations. Edited by Richard C. Larock 1989 p993, VCH publishersを参照)。

【0089】

これは、スキーム12中の式IIの化合物について示される。

【化63】



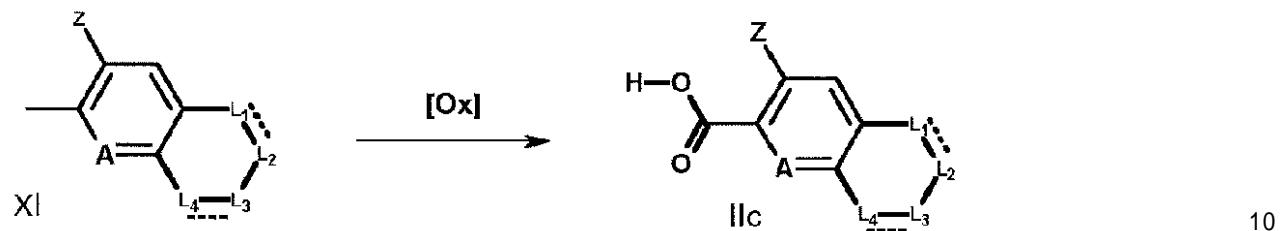
【0090】

式Xの化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。

【0091】

あるいは、式IIc(式中、Rが水素である)の化合物は、金属触媒を用いてまたは用いずに、硫酸などの酸を用いてまたは用いずに、酸素、過酸化水素または三酸化クロムなどの金属酸化物などの酸化剤の存在下での酸化による式(XI)(式中、Zが、ニトロまたはフッ素などのハロゲンのような脱離基であり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりである)の化合物の反応によって調製され得る。この変換は、周知であり、当業者に公知の方法によって作製され得る(例えば、Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations. Edited by Richard C. Larock 1989 p823, VCH publishersを参照)。これは、スキーム13中の式IIの化合物について示される。

【化64】

スキーム13

【0092】

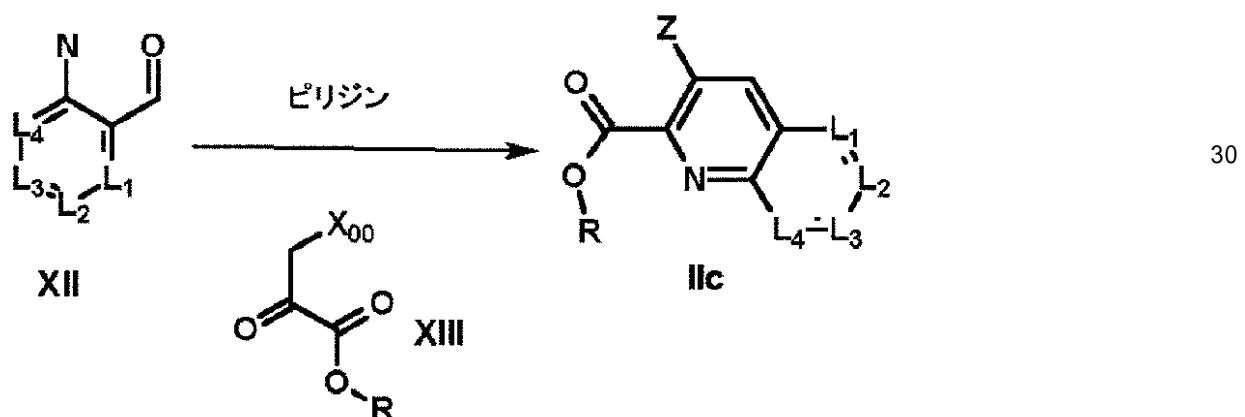
式XⅠの化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によつて作製され得る。

【0093】

式IIC (式中、Rが、C₁~C₆アルキルであり、A、L₁、L₂、L₃およびL₄が、上の式Iで記載されるとおりであり、ZがNH₂である)の化合物は、式(XII)の化合物と、式XIICI (式中、例えばX₀₀が、例えば、臭化物などのハロゲンであり、Rが、例えば、エチルなどのC₁~C₆アルキルである)の化合物との反応によって調製され得る。これらの反応は、当業者に公知であり、例えばTetrahedron 60 (2004) 2937-2942に記載されている。これは、スキーム14中の式IICの化合物について示される。

20

【化65】

スキーム14

【0094】

あるいは、式I (ベンズイミダゾール (J₁₉およびJ₂₃) (式中、L₁=NまたはNR₁_{0a}、L₂=C-R_{10b}、L₃=NまたはN-R_{10c}、L₄=結合; ベンゾチアジアゾール (J₂₀) : L₁=N、L₂=S、L₃=N、L₄=結合; ベンゾチアゾール (J₁₂) : L₁=N、L₂=C-R_{10b}、L₃=S、L₄=結合; ベンゾトリアゾール (J₁₈、J₁₇およびJ₂₄) : L₁=NまたはN-R_{10a}、L₂=NまたはN-R_{10b}、L₃=NまたはN-R_{10c}、L₄=結合; ベンゾオキサゾール (J₂₅) : L₁=N、L₂=C-R_{10b}、L₃=O、L₄=結合)の化合物の合成は、スキーム15に示されるように、式XVⅠまたはXVIⅠの中間体の環化によって行われ得る。

40

【0095】

スキーム16に記載される環状化合物の合成は、非常によく知られており、文献に既に記載されている方法と同様に、当業者に公知の方法によって行われ得る。

【0096】

例えば、中間体タイプXVIから出発するベンズイミダゾールの合成については、Monatshefte fuer Chemie 2011, 142(1), 87 - 91; Organic Preparations and Procedures International 2013, 45(1), 57 - 65; Organic Preparations and Procedures International 2013, 45(2), 162 - 167; Tetrahedron Letters 2007 48(18), 3251 - 3254を参照するか；または中間体タイプXVIから出発する場合、例えばJournal of Organic Chemistry 2011, 76(23), 9577 - 9583またはTetrahedron 2013, 69(6), 1717 - 1719を参照されたい。一般に、ベンズイミダゾールの調製についての概説については、The Chemistry of Heterocyclic Compounds; Weissberger, A., Taylor, E. C., Eds.; Wiley - VCH: New York, NY, 1981; Vol. 40, pp 6 - 60を参照されたい。10

【0097】

例えば、中間体タイプXVIから出発するベンズチアジアゾールの合成については、Tetrahedron 2005, 61(46), 10975 - 10982を参照されたい。ベンズイミダゾールの調製および特性についてのより一般的な概説については、Eur. J. Org. Chem. 2013, 228 - 255を参照されたい。

【0098】

例えば、中間体タイプXVIから出発するベンズトリアゾールの合成については、例えば、スキーム15に記載されている環化縮合（例えばAcOH、NaNO₂）を用いた、Bioorganic & Medicinal Chemistry 2010, 18(24), 8457 - 8462を参照されたい。ベンズトリアゾールの調製についてのより一般的な概説については、例えば、Journal Chem. Pharm. Res., 2011, 3(6) p 375 - 381を参照されたい。20

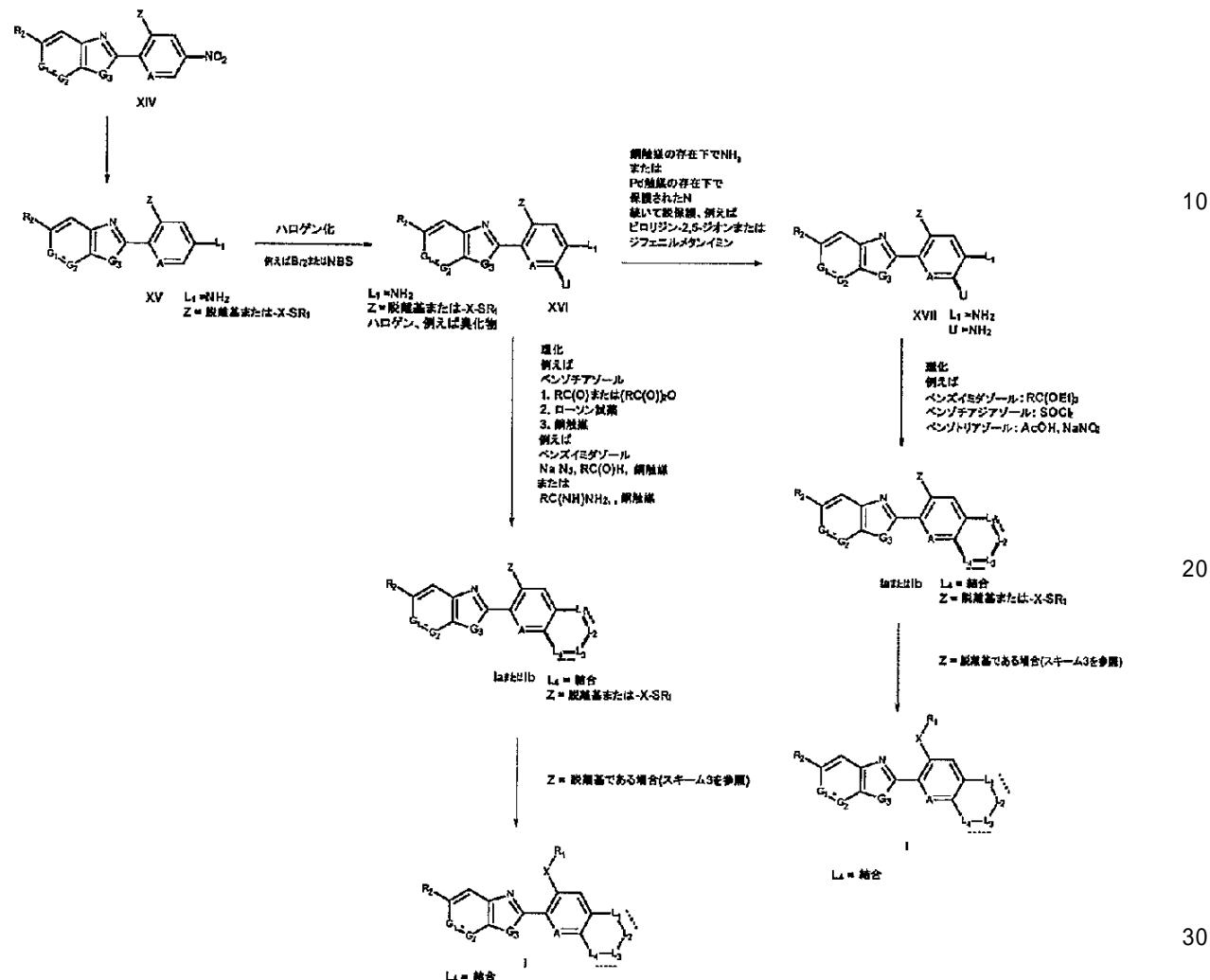
【0099】

例えば、中間体タイプXVIから出発するベンズチアゾールの合成については、例えば、Journal of Combinatorial Chemistry 2009, 11(6), 1047 - 1049; Chemistry - A European Journal 2012, 18(16), 4840 - 4843, S4840 / 1 - S4840 / 35；または国際公開第13066729号を参照されたい。さらに、ベンズチアゾールの合成は、周知であり、他のタイプの中間体による、当業者に公知の方法によって容易に作製され得、例えば、Journal of Current Pharmaceutical Research 2010; 3(1): 13 - 23を参照されたい。30

【0100】

【化 6 6】

スキーム15: 式Iの化合物の代替的な調製



【0101】

L_1 、 L_2 または L_3 として $N - H$ を含有する式 I a、I b、および I の化合物は、炭酸カリウムまたは水素化ナトリウムなどの塩基の存在下で、ヨウ化メチルなどのアルキル化剤と反応されて、式 I a、I b、および I (式中、 L_1 、 L_2 または L_3 が $N - \text{CH}_3$ である) の化合物が得られる。

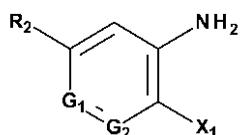
【0102】

スキーム 15 の説明において使用される一般的な参考文献に記載されているのと同じタイプの方法が、例えば、中間体 X I、I I、I I c、I I d、X、X d に使用され得る。

【0103】

式 I (式中、 G_3 が、O または S である) の化合物は、スキーム 1 およびスキーム 2 に記載されているように、式 I I I (式中、 X_1 が、SH または OH である) の化合物と、式 I I の化合物との反応によって調製され得る。

【化67】



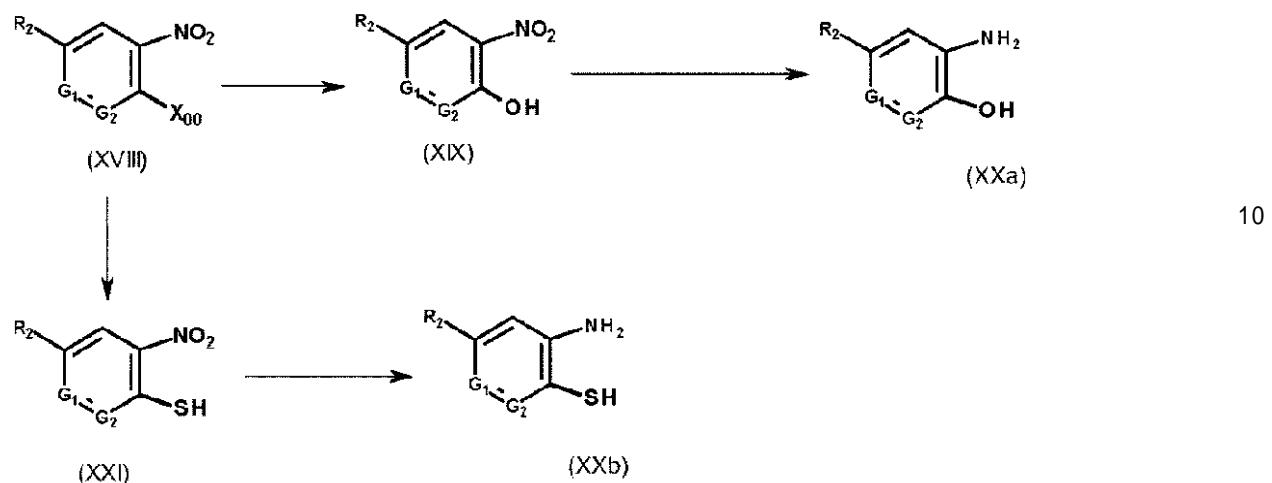
【0104】

これら の方法の全てが、当業者に公知であり、または例えば国際公開第2011/040629号または国際公開第2009131237号、国際公開第2011088990号、国際公開第2011049222号またはInorg. Chimica Acta, 358 (9), 2701 - 2710; 2005に記載されている。このタイプの複素環の合成に使用される方法は、当業者に周知であり、(XVI)または他のタイプの中間体を介したこれらのタイプの構造の合成についての概説または情報については、例えば、RSC Advances (2014), 4 (104), 60176 - 60208、Pure and Applied Chemistry (2008, 80 (4), 707 - 715、Chemical Science Review and Letters (2014), 2 (6), 408 - 414、Tetrahedron Letters 55 (2014) 5515 - 5520 (および引用文献)、Tetrahedron (2015), 71 (4), 700 - 708 (および引用文献)、Heterocycles (2014), 89 (6), 1441 - 1453 (および引用文献)、Heterocycles (1994) 38, 1001、Asian Journal of chemistry (2004) 16, N° 3 - 4, p 1241 - 1260またはChin. J. Org. Chem. 2014, Vol. 34, N° 6, 1048 - 1060を参照されたい。

【0105】

式XXa (式中、X₁がOHである)の化合物は、50 ~ 100 の温度で、水、NMP、DMF、2-イミダゾリジノン、またはそれらの混合物中の塩基、例えばアルカリ土類金属塩基による処理により、式XVIIの化合物から生成され得る。例えば酸性媒体中の金属、例えば酢酸または塩酸中のFeを用いて、当業者に公知の方法によって生成されるXIXの還元である。NO₂基のこのような還元は、例えばOrg. Synth.; Coll. Vol. 5: 346, 1973に記載されており、式XIaの化合物が得られる。同様の反応が、当業者に周知であり、例えばOrganic Letters, 10 (14), 3025 - 3028; 2008またはBioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 16 (8), 2293 - 2298; 2006に記載されている。この化学反応は、スキーム16にまとめられている。

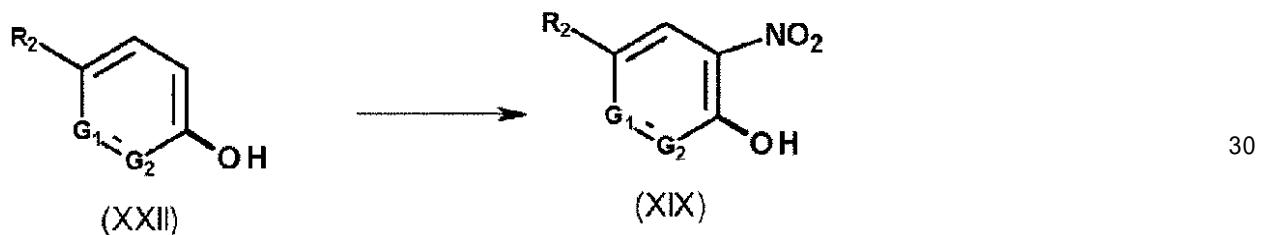
【化68】

スキーム16:

【0106】

あるいは、式XIXの化合物は、ニトロ化反応によって式XXIIの化合物から生成され得る。同様の反応が、当業者に周知であり、例えば、国際公開第20111049222号または国際公開第20111049220号(スキーム17)に記載されている。

【化69】

スキーム17:

【0107】

式XXIIの化合物は、式XVIIの化合物を硫化剤と反応させることによって生成され得る。反応に使用される硫化剤の例としては、硫化ナトリウム、硫化ナトリウム九水和物、およびチオ尿素が挙げられる。この反応は、塩基の存在下で行われ得る。反応に使用される塩基の例としては、炭酸カリウム、炭酸セシウム、およびリン酸三カリウムなどの無機塩基；ならびに有機塩基、例えばトリエチルアミンが挙げられる。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、水；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル；トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；アセトニトリルなどのニトリル；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；酢酸などのカルボン酸；およびそれらの混合物が挙げられる。同様の反応が、文献に記載されている（例えば、ChemMedChem, 4 (6), 935-938; 2009、Bioorganic & Medicinal Chemistry, 16 (23), 9948-9956; 2008またはJournal of Heterocyclic Chemistry, 38 (5), 1153-1166; 2001を参照）。例えば酸性媒体中の金属、例えば酢酸または塩酸中のFeを用いた、当業者に公知の方法による化合物XXII中のニトロ基の還元である。NO₂基のこのような還元は、例えばOrg. Synth.; Coll. Vol. 5: 346, 1973

40

50

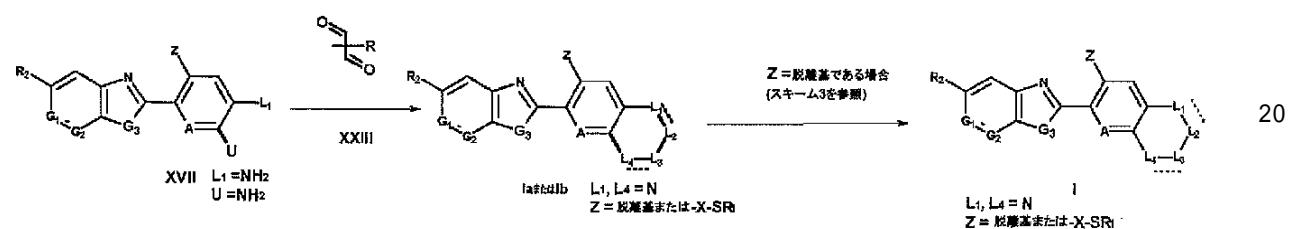
に記載されており、式XXbの化合物をもたらす。この化学反応は、スキーム16にまとめられている。

【0108】

キノキサリン誘導体類似体（J1b）の調製：式IaまたはIb（式中、R₂、G₁、G₂およびG₃が、式Iにおいて定義されるとおりであり、L₁およびL₂が窒素であり、L₂およびL₃がそれぞれ、C-R_{10b}およびC-R_{10c}であり、Zが、脱離基またはX-R₁である）の化合物は、式XXVII（例えば、スキーム15に記載されるように調製される）の化合物をグリオキサール類似体（XXIII）と反応させることによって生成され、例えばスキーム3に記載される条件により、式I（Zが脱離基である場合）の化合物において変換され得る。このような変換は、当業者に周知であり、例えばJournal of Heterocyclic Chemistry, 51(5), 1504-1508; 2014, Synthesis, 45(11), 1546-1552; 2013および引用文献に記載されている。これは、スキーム19中の式Iの化合物について示される。
10

【化70】

スキーム19:



【0109】

ベンゾフラン誘導体類似体（例えばJ27）の調製：式I（式中、A、R₂、G₁、G₂およびG₃が、式Iにおいて定義されるとおりであり、L₁が酸素であり、L₂およびL₃がそれぞれ、C(R_{10b})_mおよびC(R_{10c})_mであり、Zが、脱離基またはX-R₁である）の化合物は、以下によって生成され得る：

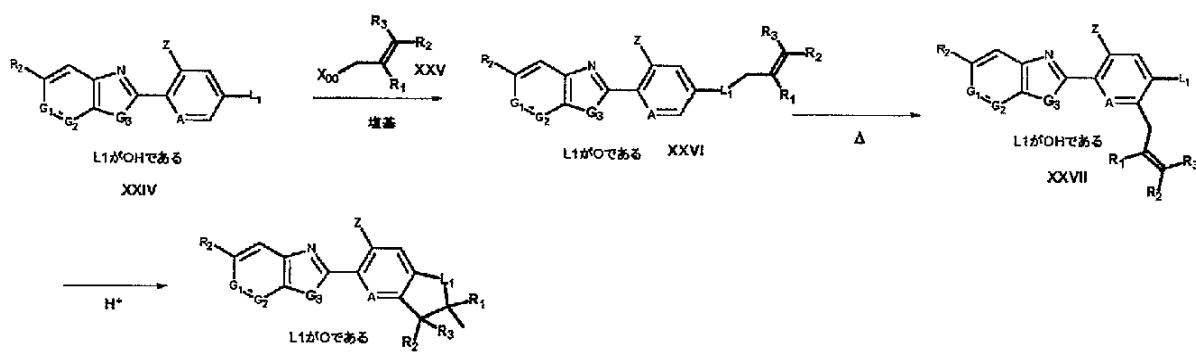
1. ヨウ化ナトリウムなどの触媒の存在下または非存在下で、例えば、アセトン、アセトニトリルもしくはジメチルホルムアミドなどの溶媒またはジメチルホルムアミドおよびアセトンなどの溶媒の混合物中において、例えば、炭酸カリウムなどの塩基の存在下で式XXIVの化合物を式XXVの化合物などのアリル類似体と反応させること。エステルXXVIの形成は、当業者に周知の変換に類似しており、例えばOrganic Letters, 17(12), 3118-3121; 2015; Tetrahedron, 2004, 60, 7973-7981またはProtective groups in organic synthesis (third edition, Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts 1999) p 262に記載されている条件で行われ得る。
30

2. 次に、加熱条件下で、式XXVIの化合物のクライゼン転位によって。この反応およびそれを実現するための条件が、当業者に周知であり、例えばKurti, Laszlo; Czakó, Barbara; EditorsによるStrategic Applications of Named Reactions in Organic Synthesis; 2005, page 88を参照されたい。
40

3. およびギ酸などの酸性条件下における式XXVIIの化合物の環化によって。このような変換（分子内ヒドロアルコキシ化）は、当業者に周知であり、例えば、Angewandte Chemie, International Edition, 54(13), 4014-4017; 2015および引用文献；ChemCatChem, 5(11), 3309-3315; 2013; Chemistry - A European Journal, 16(11), 3403-3422, S3403/1-S3403/38; 2010および引用文献；Journal of Organic Chemistry
50

, 76 (22), 9353 - 9361 ; 2011 に記載されている。

【化71】



【0110】

式XXIVの化合物の調製は、本特許に既に記載されているプロトコルの使用により、または国際公開第2015000715号、米国特許出願公開第20140018373号明細書（国際公開第2012086848号）または米国特許出願公開第20140194290号明細書（国際公開第2013018928号）に記載されている手順により当業者に対して行われ得る。

【0111】

式I-IIおよびIIの定義に従って官能化された式(I)の全ての他の化合物を調製するため、多数の好適な公知の標準的な方法、例えばアルキル化、ハロゲン化、アシリル化、アミド化、オキシム化、酸化および還元が存在し、好適な調製方法の選択は、中間体における置換基の特性（反応性）に応じて決まる。

【0112】

反応剤は、塩基の存在下で反応され得る。好適な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属ジアルキルアミドまたはアルカリ金属またはアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離またはN-アルキル化飽和または不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウムおよび炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシリアミン、N-シクロヘキシリ-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウムおよび1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

【0113】

反応剤は、そのままで、すなわち、溶媒または希釈剤を加えずに、互いに反応され得る。しかしながら、ほとんどの場合、不活性溶媒または希釈剤またはこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリンまたはN,N-ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒または希釈剤としても働き得る。

【0114】

反応は、約-80～約+140、好ましくは約-30～約+100の温度範囲、多くの場合、周囲温度から約+80の範囲で行われるのが有利である。

【0115】

10

20

30

40

50

式Iの化合物は、式Iの出発化合物の1つ以上の置換基を慣例的な方法で、本発明に係る他の置換基で置換することにより、式Iの別の化合物へと、それ自体公知の方法で転化され得る。

【0116】

それぞれ好適な反応条件および出発材料の選択に応じて、例えば、1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であり、または複数の置換基が、同じ反応工程において、本発明に係る他の置換基で置換され得る。

【0117】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。したがって、例えば、式Iの化合物の酸付加塩が、好適な酸または好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩が、好適な塩基または好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

10

【0118】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物または好適なイオン交換試薬による処理により遊離化合物Iの酸付加塩へと、および例えば好適な酸または好適なイオン交換試薬による処理により塩基による塩へと慣例的な方法で転化され得る。

【0119】

式Iの化合物の塩は、例えば塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、したがって反応混合物から沈殿する好適な溶媒中で、例えば、塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩または銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば、他の酸付加塩へとそれ自体公知の方法で転化され得る。

20

【0120】

手順または反応条件に応じて、塩形成特性を有する式Iの化合物が、遊離形態または塩の形態で得られる。

【0121】

式Iの化合物および必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対および相対配置に応じて、および/または分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば、対掌体および/またはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態で、あるいは鏡像異性体混合物、例えば、ラセミ体、ジアステレオマー混合物またはラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態でまたはこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能な全ての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記および下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

30

【0122】

式Iの化合物のジアステレオマー混合物またはラセミ混合物は、どの出発材料および手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態または塩形態で、例えば、分別結晶化、蒸留および/またはクロマトグラフィーにより、成分の物理化学的差異に基づいて、純粋なジアステレオマーまたはラセミ体へと公知の方法で分離され得る。

40

【0123】

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法により、例えば、光学活性溶媒からの再結晶化により、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィー、例えば、好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィー(HPLC)により、例えば、1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により、またはジアステレオマー塩への転化により、例えば、塩基性最終生成物ラセミ体をカルボン酸、例えばシヨウノウ酸、酒石酸またはリンゴ酸、またはスルホン酸、例えばカソファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を、例えば、異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用により、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得ることによって光

50

学対掌体へと分解され得る。

【0124】

純粹なジアステレオマーまたは鏡像異性体は、本発明に従って、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的またはエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法によっても、例えば、立体化学特性を有する出発材料を用いて本発明に係る方法を行うことによっても得られる。

【0125】

N - オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で、式 I の化合物を好適な酸化剤、例えば H_2O_2 / 尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J . M e d . C h e m . 1 9 8 9 , 3 2 , 2 5 6 1 または国際公開第 2 0 0 0 / 1 5 6 1 5 号といった文献から公知である。

10

【0126】

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ、生物学的により有効な異性体、例えば鏡像異性体またはジアステレオマー、または異性体混合物、例えば鏡像異性体混合物またはジアステレオマー混合物を単離または合成することが有利である。

【0127】

式 I の化合物および必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、必要に応じて、水和物の形態で得ることもでき、および / または他の溶媒、例えば、固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

【0128】

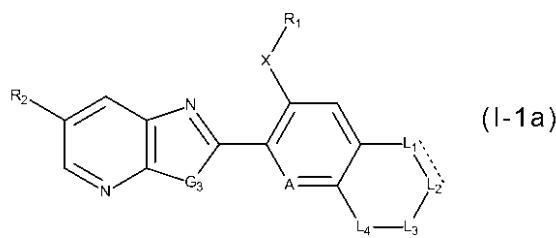
20

以下の表 1 ~ 4 に表される化合物は、上述される方法に従って調製され得る。以下に続く例は、本発明を例示し、式 I の好ましい化合物を示すことが意図される。「Ph」は、フェニル基を表す。

【0129】

表 1 : この表は、式 I - 1 a :

【化 7 2】



30

の 128 種の化合物ならびに表 1 の化合物の N - オキシドまたは互変異性体を開示する。

【0130】

【表 1 - 1】

表 1: G_3 が $N\text{-}R_6$ である

| 化合物番号 | X | R_1 | A | R_2 | R_6 | L_1 | L_2 | L_3 | L_4 |
|-------|---------------|---------------------------|-----|---------------|---------------|-------|------------------------|------------------------|-------|
| 1.001 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | CH | CH | CH |
| 1.002 | SO | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | CH | CH | CH |
| 1.003 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | CH | CH | CH |
| 1.004 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | CH | CH | CH |
| 1.005 | SO | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | CH | CH | CH |
| 1.006 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | CH | CH | CH |
| 1.007 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | O | CH_2 | O | 結合 |
| 1.008 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | O | CH_2 | O | 結合 |
| 1.009 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | N | $\text{N}\text{-CH}_3$ | 結合 |
| 1.010 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | N | $\text{N}\text{-CH}_3$ | 結合 |
| 1.011 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | $\text{N}\text{-CH}_3$ | N | 結合 |
| 1.012 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | $\text{N}\text{-CH}_3$ | N | 結合 |
| 1.013 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | N | $\text{N}\text{-CH}_3$ | 結合 |
| 1.014 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | N | $\text{N}\text{-CH}_3$ | 結合 |
| 1.015 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | $\text{N}\text{-CH}_3$ | N | 結合 |
| 1.016 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | $\text{N}\text{-CH}_3$ | N | 結合 |
| 1.017 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | N | CH | CH | CH |
| 1.018 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | N | CH | CH | CH |
| 1.019 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | N | CH | CH | CH |
| 1.020 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | N | CH | CH | CH |
| 1.021 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | N | CH | CH |
| 1.022 | SO_2 | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | C-H | CF_3 | CH_3 | CH | N | CH | CH |
| 1.023 | S | $-\text{CH}_2\text{CH}_3$ | N | CF_3 | CH_3 | CH | N | CH | CH |

10

20

30

40

【表 1 - 2】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|----------------|----------------|
| 1.024 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 1.025 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 1.026 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 1.027 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 1.028 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 1.029 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 1.030 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 1.031 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 1.032 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 1.033 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 1.034 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 1.035 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 1.036 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 1.037 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 1.038 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 1.039 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 1.040 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 1.041 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 1.042 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 1.043 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 1.044 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 1.045 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 1.046 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 1.047 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 1 - 3】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 1.048 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 1.049 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.050 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.051 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.052 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.053 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.054 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.055 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.056 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.057 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 1.058 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 1.059 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 1.060 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 1.061 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 1.062 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 1.063 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 1.064 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 1.065 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 1.066 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 1.067 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 1.068 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 1.069 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 1.070 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 1.071 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |

10

20

30

40

【表 1 - 4】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|----------------|----------------|
| 1.072 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 1.073 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 1.074 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 1.075 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 1.076 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 1.077 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 1.078 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 1.079 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 1.080 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 1.081 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 1.082 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 1.083 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 1.084 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 1.085 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.086 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.087 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.088 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.089 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.090 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.091 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.092 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.093 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.094 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.095 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 1 - 5】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 1.096 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.097 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.098 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.099 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.100 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.101 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 1.102 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 1.103 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 1.104 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 1.105 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 1.106 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 1.107 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 1.108 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 1.109 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.110 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.111 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.112 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 1.113 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.114 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.115 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.116 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 1.117 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.118 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.119 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |

10

20

30

40

【表 1 - 6】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 1.120 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.121 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.122 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.123 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.124 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.125 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.126 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.127 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 1.128 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |

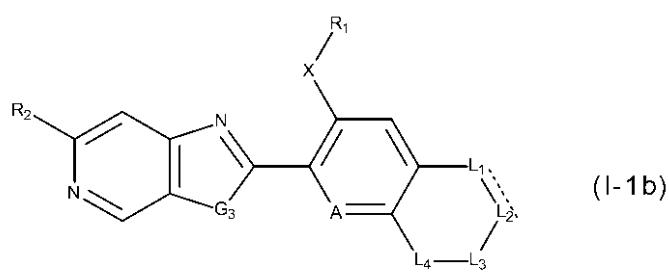
10

20

【0 1 3 1】

表 2 : この表は、式 I - 1 b :

【化 7 3】



の 1 2 8 種の化合物ならびに表 2 の化合物の N - オキシドおよび互変異性体を開示する。

【0 1 3 2】

【表 2 - 1】

表 2: G₃ が N-R₆ である

| 化合物 番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-----------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 2.001 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 2.002 | SO | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 2.003 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 2.004 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 2.005 | SO | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 2.006 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 2.007 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | O | CH ₂ | O | 結合 |
| 2.008 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | O | CH ₂ | O | 結合 |
| 2.009 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.010 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.011 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.012 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.013 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.014 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.015 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.016 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.017 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 2.018 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 2.019 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 2.020 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 2.021 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 2.022 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 2.023 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |

10

20

30

40

【表 2 - 2】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|----------------|----------------|
| 2.024 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 2.025 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 2.026 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 2.027 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 2.028 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 2.029 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 2.030 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 2.031 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 2.032 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 2.033 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 2.034 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 2.035 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 2.036 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 2.037 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 2.038 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 2.039 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 2.040 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 2.041 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 2.042 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 2.043 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 2.044 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 2.045 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 2.046 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 2.047 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 2 - 3】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 2.048 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 2.049 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.050 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.051 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.052 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.053 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.054 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.055 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.056 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.057 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 2.058 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 2.059 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 2.060 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 2.061 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 2.062 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 2.063 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 2.064 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 2.065 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 2.066 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 2.067 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 2.068 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 2.069 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 2.070 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 2.071 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |

10

20

30

40

【表 2 - 4】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|----------------|----------------|
| 2.072 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 2.073 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 2.074 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 2.075 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 2.076 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 2.077 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 2.078 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 2.079 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 2.080 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 2.081 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 2.082 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 2.083 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 2.084 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 2.085 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.086 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.087 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.088 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.089 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.090 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.091 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.092 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.093 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.094 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.095 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 2 - 5】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 2.096 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.097 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.098 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.099 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.100 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.101 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 2.102 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 2.103 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 2.104 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 2.105 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 2.106 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 2.107 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 2.108 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 2.109 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.110 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.111 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.112 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 2.113 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.114 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.115 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.116 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 2.117 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.118 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.119 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |

10

20

30

40

【表 2 - 6】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 2.120 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.121 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.122 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.123 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.124 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.125 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.126 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.127 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 2.128 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |

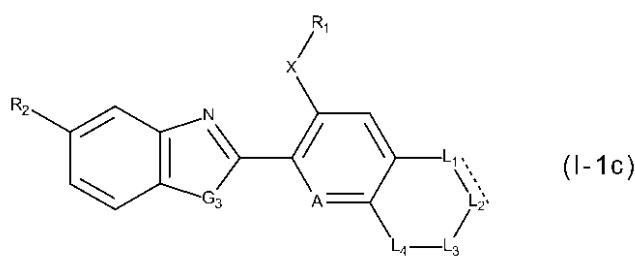
10

20

【0133】

表3：この表は、式I-1c：

【化74】



30

の128種の化合物ならびに表3の化合物のN-オキシドおよび互変異性体を開示する。

【0134】

【表3-1】

表3: G₃がN-R₆である

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 3.001 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 3.002 | SO | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 3.003 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 3.004 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 3.005 | SO | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 3.006 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 3.007 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | O | CH ₂ | O | 結合 |
| 3.008 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | O | CH ₂ | O | 結合 |
| 3.009 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.010 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.011 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.012 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.013 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.014 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.015 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.016 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.017 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 3.018 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 3.019 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 3.020 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 3.021 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 3.022 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 3.023 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |

10

20

30

40

【表 3 - 2】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|----------------|----------------|
| 3.024 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 3.025 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 3.026 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₂ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 3.027 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 3.028 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 3.029 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 3.030 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 3.031 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 3.032 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 3.033 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 3.034 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 3.035 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 3.036 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 3.037 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 3.038 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 3.039 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 3.040 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 3.041 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 3.042 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 3.043 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 3.044 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 3.045 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 3.046 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 3.047 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 3 - 3】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 3.048 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 3.049 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.050 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.051 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.052 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.053 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.054 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.055 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.056 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.057 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 3.058 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 3.059 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 3.060 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 3.061 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 3.062 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 3.063 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 3.064 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 3.065 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 3.066 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 3.067 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 3.068 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 3.069 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 3.070 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 3.071 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |

10

20

30

40

【表 3 - 4】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|----------------|----------------|
| 3.072 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 3.073 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 3.074 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 3.075 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 3.076 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 3.077 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 3.078 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 3.079 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 3.080 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 3.081 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 3.082 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 3.083 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 3.084 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 3.085 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.086 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.087 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.088 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.089 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.090 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.091 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.092 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.093 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.094 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.095 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 3 - 5】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 3.096 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.097 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.098 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.099 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.100 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.101 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 3.102 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 3.103 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 3.104 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 3.105 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 3.106 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 3.107 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 3.108 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 3.109 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.110 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.111 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.112 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 3.113 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.114 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.115 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.116 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 3.117 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.118 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.119 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |

10

20

30

40

【表3-6】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 3.120 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.121 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.122 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.123 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.124 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.125 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.126 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.127 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 3.128 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |

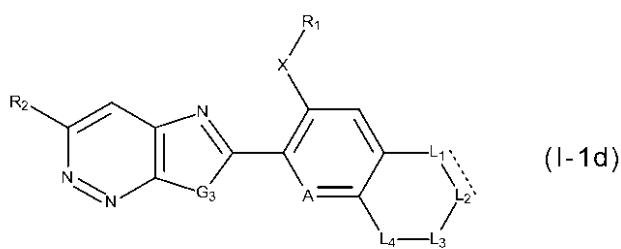
10

20

【0135】

表4：この表は、式I-1d：

【化75】



30

の128種の化合物ならびに表4の化合物のN-オキシドおよび互変異性体を開示する。

【0136】

【表4-1】

表4: G₃がN-R₆である

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 4.001 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 4.002 | SO | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 4.003 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 4.004 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 4.005 | SO | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 4.006 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | CH | CH | CH |
| 4.007 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | O | CH ₂ | O | 結合 |
| 4.008 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | O | CH ₂ | O | 結合 |
| 4.009 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.010 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.011 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.012 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.013 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.014 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.015 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.016 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.017 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 4.018 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 4.019 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 4.020 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | CH | CH |
| 4.021 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 4.022 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 4.023 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |

10

20

30

40

【表 4 - 2】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|----------------|----------------|
| 4.024 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | CH | CH |
| 4.025 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 4.026 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 4.027 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 4.028 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | CH | 結合 |
| 4.029 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 4.030 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 4.031 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 4.032 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | CH | 結合 |
| 4.033 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 4.034 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 4.035 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 4.036 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-H | CH | 結合 |
| 4.037 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 4.038 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 4.039 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 4.040 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | N | N-H | 結合 |
| 4.041 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 4.042 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 4.043 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 4.044 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | S | N | 結合 |
| 4.045 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 4.046 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 4.047 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 4 - 3】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 4.048 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | NH | N | 結合 |
| 4.049 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.050 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.051 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.052 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.053 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.054 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.055 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.056 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | N | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.057 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 4.058 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 4.059 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 4.060 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | N | N | 結合 |
| 4.061 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 4.062 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 4.063 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 4.064 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-CF ₃ | CH | CH |
| 4.065 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 4.066 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 4.067 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 4.068 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | CH | C-F | CH | CH |
| 4.069 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 4.070 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 4.071 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |

10

20

30

40

【表 4 - 4】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|----------------|----------------|
| 4.072 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-H | S | 結合 |
| 4.073 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 4.074 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 4.075 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 4.076 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | S | 結合 |
| 4.077 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 4.078 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 4.079 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 4.080 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | S | 結合 |
| 4.081 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 4.082 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 4.083 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 4.084 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-H | N | 結合 |
| 4.085 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.086 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.087 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.088 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.089 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.090 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.091 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.092 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | S | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.093 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.094 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.095 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |

10

20

30

40

【表 4 - 5】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 4.096 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.097 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.098 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.099 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.100 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.101 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 4.102 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 4.103 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 4.104 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-H | CH | N | 結合 |
| 4.105 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 4.106 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 4.107 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 4.108 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | CH | N | 結合 |
| 4.109 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.110 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.111 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.112 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | 結合 |
| 4.113 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.114 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.115 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.116 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | 結合 |
| 4.117 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.118 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.119 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |

10

20

30

40

【表4-6】

| 化合物番号 | X | R ₁ | A | R ₂ | R ₆ | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----|-----------------|-----------------|----------------|-------------------|-------------------|----------------|
| 4.120 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | CH | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.121 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.122 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.123 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.124 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.125 | S | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.126 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | C-H | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.127 | S | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |
| 4.128 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | N | CF ₃ | CH ₃ | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | 結合 |

【0137】

本発明に係る式Iの化合物は、低い施用量でも有害生物防除の分野で予防的におよび／または治療的に有益な活性成分であり、これは、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類および植物によって良好な耐容性を示される。本発明に係る活性成分は、昆虫またはダニ目(*Acarina*)の代表例など、通常の感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物の全てまたは個々の発育段階に対しても作用する。本発明に係る活性成分の殺虫または殺ダニ活性は、直接、すなわち、直ちにまたはいくらかの時間が経過してから初めて、例えば脱皮中に起こる有害生物の破壊として、または間接的に、例えば、減少した産卵および／または孵化率として現れることがある。

【0138】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

ダニ目(*Acarina*)から、例えば、アカリツス属(*Acalitus spp.*)、アカルス属(*Aculus spp.*)、アカリカルス属(*Acariculus spp.*)、アセリア属(*Aceria spp.*)、アシブトコナダニ(*Acarus sirro*)、キララマダニ属(*Amblyomma spp.*)、ナガヒメダニ属(*Argas spp.*)、ウシマダニ属(*Boophilus spp.*)、ブレビバルパス属(*Brevipalpus spp.*)、ブリオビア属(*Bryobia spp.*)、カリピトリメルス属(*Calipitrimerus spp.*)、ショクヒヒゼンダニ属(*Chorioptes spp.*)、ワクモ(*Dermayssus gallinace*)、デルマトファゴイデス属(*Dermatophagooides spp.*)、エオテラニカス属(*Eotetranychus spp.*)、エリオフィエス属(*Eriophyes spp.*)、ヘミタルソネムス属(*Hemitarsonemus spp.*)、イボマダニ属(*Hyalomma spp.*)、タネガタマダニ属(*Ixodes spp.*)、オリゴニクス属(*Olygonychus spp.*)、カズキダニ属(*Ornithodoros spp.*)、ポリファゴタルソネ・ラタス(*Polyphagota rsone latus*)、パノニクス属(*Panonychus spp.*)、ミカンサビダニ(*Phyllocoptes oleivora*)、フィトネムス属(*Ph*

10

20

30

40

50

ytonemus spp.)、ポリファゴタロソネムス属(*Polyphagotarsonemus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属(*Psoroptes* spp.)、コイタマダニ属(*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属(*Rhizoglyphus* spp.)、サルコブテス属(*Sarcopotes* spp.)、ステネオタルソネムス属(*Steneotarsonemus* spp.)、ホコリダニ属(*Tarsonemus* spp.)およびテトラニクス属(*Tetranychus* spp.);

シラミ目(*Anoplura*)から、例えば、ブタジラミ属(*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属(*Linognathus* spp.)、ペディクルス属(*Pediculus* spp.)、ペムフィグス属(*Pemphigus* spp.)およびフィロキセラ属(*Phylloxera* spp.);

鞘翅目(*Coleoptera*)から、例えば、アグリオテス属(*Agriotes* spp.)、アンフィマロン・マジャレ(*Amphimallon majale*)、セマダラコガネ(*Anomala orientalis*)、アントノムス属(*Anthonomus* spp.)、マグソコガネ属(*Aphodius* spp.)、アスチラス・アトロマクラタス(*Astylus atromaculatus*)、アテニウス属(*Ataenius* spp.)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属(*Cerotoma* spp.)、コノデルス属(*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属(*Cosmopolites* spp.)、コチニス・ニチダ(*Cotinis nitida*)、クルクリオ属(*Curculio* spp.)、シクロセファラ属(*Cyclocephala* spp.)、デルメステス属(*Dermestes* spp.)、ジアプロチカ属(*Diabrotica* spp.)、アブデルスツノカブトムシ(*Diloboderus abderus*)、エピラクナ属(*Epilachna* spp.)、エレムヌス属(*Eremnus* spp.)、ヘテロニクス・アラトル(*Heteronychus arator*)、コーヒーノミキクイムシ(*Hypotenemus hampei*)、ラグリア・フィロサ(*Lagria villosa*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソルホプトルス属(*Lissorrhopterus* spp.)、リオゲニス属(*Liogenys* spp.)、マエコラスピス属(*Maecolaspis* spp.)、アカビロウドコガネ(*Maladera castanea*)、メガセリス属(*Megascelis* spp.)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属(*Melolontha* spp.)、マイオクロウス・アルマツス(*Myochrous armatus*)、オリカエフィルス属(*Orycaephilus* spp.)、オチオリンクス属(*Otiorrhynchus* spp.)、フィロファガ属(*Phyllophaga* spp.)、フリクチヌス属(*Phlyctinus* spp.)、ポピリア属(*Popillia* spp.)、ブシリオデス属(*Psylliodes* spp.)、リソマツス・アウブチリス(*Rhyssomatus aubtilis*)、リゾペルタ属(*Rhizophorha* spp.)、コガネムシ科(*Scarabaeidae*)、シトフィルス属(*Sitophilus* spp.)、シトルガ属(*Sitotroga* spp.)、ソマチカス属(*Somaticus* spp.)、スフェノフォラス属(*Sphenophorus* spp.)、ステルネクススブ・シグナツス(*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属(*Tenebrio* spp.)、トリボリウム属(*Trifolium* spp.)およびトロゴデルマ属(*Trogoderma* spp.);

双翅目(*Diptera*)から、例えば、ヤブカ属(*Aedes* spp.)、ハマダラカ属(*Anopheles* spp.)、アンテリゴナ・ソカタ(*Antherigon a soccata*)、オリーブミバエ(*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス(*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属(*Bradyisia* spp.)、クロバエ(*Calliphora erythrocephala*)、セラ

10

20

30

40

50

チチス属 (*Ceratitidis* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、クテレブラ属 (*Cuterebra* spp.)、ダクス属 (*Dacus* spp.)、デリア属 (*Delia* spp.)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ガストロフィラス属 (*Gastrophilus* spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツェツエバエ属 (*Glossina* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属 (*Hippobosca* spp.)、リリオミザ属 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属 (*Orseolia* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frict*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) およびガガンボ属 (*Tipula* spp.);

半翅目 (Hemiptera) から、例えば、アカントコリス・スカブラトル (*Acanthocoris scabrador*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメムシ (*Adelphocoris lineolatus*)、アンブリペルタ・ニチダ (*Amblypelta nitida*)、バチコエリア・タラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属 (*Blissus* spp.)、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、クラビグララ・トメントシコリス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属 (*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロブス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus* spp.)、エデッサ属 (*Edessa* spp.)、ユーキスツス属 (*Euchistus* spp.)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属 (*Eurygaster* spp.)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリサ属 (*Leptocoris* spp.)、メクラカメムシ属 (*Lygus* spp.)、マルガロデス属 (*Margarodes* spp.)、ムルガンチア・ヒストリオニク (*Murgantia histrionica*)、ネオメガロトムス属 (*Neomegalotomus* spp.)、タバコカスミカメムシ (*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属 (*Nezara* spp.)、ニシウス・シムランス (*Nysius simulanus*)、オエバルス・インスラリス (*Oebalus insularis*)、ピエスマ属 (*Piesma* spp.)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノファラ属 (*Scotinophara* spp.)、チアンタ属 (*Thyanta* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデンス (*Vatiga illudens*); アシルトシウム・ピスム (*Acyrthosium pisum*)、アダルゲス属 (*Adalgis* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属 (*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属 (*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロッコス (*Aleurothrixus*

10

20

30

40

50

s floccosus)、アレイロデス・ブラシカエ (Aleyrodes brasicae)、フタテンミドリヨコバイ (Amarasca biguttula)、アムリトズス・アトキンソニ (Amritodus atkinsoni)、アノニジエラ属 (Aonidiella spp.)、アリマキ科 (Aphididae)、ワタアブラムシ属 (Aphis spp.)、アスピジオツス属 (Aspidiotus spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (Aulacorthum solani)、バクテリセラ・コッケレリ (Bactericera cockerelli)、ベミシア属 (Bemisia spp.)、ブラキカウズス属 (Brachycaudus spp.)、ダイコンアブラムシ (Brevicoryne brassicae)、カコブシラ属 (Cacopsylla spp.)、ニンジンフタオアブラムシ (Cavariella aegopodii Scop.)、セロプラスター属 (Ceroplaster spp.)、クリソムファルス・アオニジウム (Chrysomphalus aonidium)、オンシツマルカイガラムシ (Chrysomphalus dictyospermum)、シカデラ属 (Cicadella spp.)、シロオオヨコバイ (Cofana spectra)、クリプトミズス属 (Cryptomyzus spp.)、シカデユリナ属 (Cicadulina spp.)、ヒラタカタカイガラムシ (Coccus hesperidum)、ダルブルス・マイジス (Dalbulus maidis)、ジアレウロデス属 (Dialeurodes spp.)、ミカンキジラミ (Diaphorina citri)、ジウラフィス・ノキシア (Diuraphis noxia)、ジサフィス属 (Dysaphis spp.)、エンポアスカ属 (Empoasca spp.)、リンゴワタムシ (Eriosoma lanigerum)、エリスロネウラ属 (Erythroneura spp.)、ガスカルジア属 (Gascardia spp.)、グリカスピス・ブリンプレコンベイ (Glycaspis brimblecombei)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (Hyadaphis pseudo brassicae)、ヒアロプテルス属 (Hyalopterus spp.)、ヒペロミズス・パリズス (Hyperomyzus pallidus)、リュウガンズキンヨコバイ (Idioscopus clypealis)、ヤコビアスカ・リビカ (Jacobiasca lybica)、ラオデルファクス属 (Laodelphax spp.)、ミズキカタカイガラムシ (Lecanium corni)、レピドサフェス属 (Lepidosaphes spp.)、ニセダイコンアブラムシ (Lopaphis erysimi)、リオゲニス・マイジス (Lyogenys maidis)、マクロシフム属 (Macrosiphum spp.)、マハナルヴァ属 (Mahanarva spp.)、メタカルファ・ブルイノサ (Metcalfa pruinosa)、ムギウスイロアブラムシ (Metopolophium dirhodum)、ミンズス・クルズス (Myndus crudus)、ミズス属 (Myzus spp.)、ネオトキソプテラ属 (Neotoxoptera sp.)、ツマグロヨコバイ属 (Nephoptix spp.)、ニラバルバタ属 (Nilaparvata spp.)、ナシミドリオオアブラムシ (Nippolachnus piri Mats)、オドナスピス・ルタエ (Odontaspis ruthae)、オレグマ・ラニグラ・ゼンター (Oreagma lanigera Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (Parabemisia myricae)、パラトリオザ・コッケレリ (Paratrioza cockerelli)、パルラトリア属 (Parlatoria spp.)、ペムフィグス属 (Pemphigus spp.)、トウモロコシウンカ (Peregrinus maidis)、ペルキンシエラ属 (Perkinsiella spp.)、ホップイボアブラムシ (Phorodon humuli)、フィロキセラ属 (Phylloxera spp.)、プランコッカス属 (Planococcus spp.)、シューダウラカスピス属 (Pseudaulacaspis spp.)、シュードコッカス属 (Pseudococcus spp.)、ワタノミハムシ (Pseudatomoscelis seriatus)、プシラ属 (Psylla spp.)、ブルビナリア・エチオピカ (Pulvinaria aethiopica)、クアドラズビジオツス属 (Qu

adraspidiotus spp.)、クエサダ・ギガス(*Quesada gigas*)、イナズマヨコバイ(*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属(*Rhopalosiphum* spp.)、サイセチア属(*Saissetia* spp.)、スカホイデウス属(*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属(*Schizaphis* spp.)、シトビオン属(*Sitobion* spp.)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス(*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ(*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属(*Toxoptera* spp.)、トリアルエウロデス属(*Trialeurodes* spp.)、トリジスカス・スポロボリ(*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属(*Trionymus* spp.)、ミカントガリキジラミ(*Trioza erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ(*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ(*Zygina flammeigera*)、ジギニジア・スクテラリス(*Zyginiidia scutellaris*);
10

膜翅目(*Hymenoptera*)から、例えば、ヒメハキリアリ属(*Acromyrmex*)、アルゲ属(*Argus* spp.)、ハキリアリ属(*Atta* spp.)、セフス属(*Cephus* spp.)、ジプリオン属(*Diprion* spp.)、マツハバチ科(*Diprionidae*)、シマトウヒハバチ(*Gilpinia polytoma*)、ホプロカンパ属(*Hoplocampa* spp.)、ケアリ属(*Lasius* spp.)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、ネオジプリオン属(*Neodiprion* spp.)、シュウカクアリ属(*Pogonomyrmex* spp.)、スレノプシス・インビクタ(*Solenopsis invicta*)、ソレノプシス属(*Solenopsis* spp.)およびベスパ属(*Vespa* spp.);
20

等翅目(*Isoptera*)から、例えば、コプトテルメス属(*Coptotermes* spp.)、コルニテルネス・クムランス(*Cornitermes cumulans*)、インシシテルメス属(*Incisitermes* spp.)、マクロテルメス属(*Macrotermes* spp.)、マストテルメス属(*Mastotermes* spp.)、ミクロテルメス属(*Microtermes* spp.)、ヤマトシロアリ属(*Reticulitermes* spp.);ソレノプシス・ゲミナテ(*Solenopsis geminata*)
30

鱗翅目(*Lepidoptera*)から、例えば、アクレリス属(*Acleris* spp.)、アドキソフィエス属(*Adoxophyes* spp.)、アエゲリア属(*Aegeria* spp.)、アグロティス属(*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アミロイス属(*Amylois* spp.)、アンチカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属(*Archips* spp.)、アルギレスチア属(*Argyresthia* spp.)、アルギロタエニア属(*Argyrotaenia* spp.)、アウトグラファ属(*Autographa* spp.)、ブックラトリクス・ツルベリエラ(*Bucculatrix thurberella*)、アフリカズイム(*Busseola fusca*)、スジマラダメイガ(*Cadra cautella*)、モモシンクイガ(*Carposina nipponensis*)、チロ属(*Chilo* spp.)、コリストネウラ属(*Choristoneura* spp.)、クリソテウチア・トピアリア(*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ(*Clysiambiguella*)、クナファロクロシス属(*Cnaphalocrocis* spp.)、クネファシア属(*Cnephasia* spp.)、コチリス属(*Cochylis* spp.)、コレオフォラ属(*Coleophora* spp.)、コリアス・レスビア(*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ(*Cosmophila flava*)、クラムバス属(*Crambus* spp.)、ケブカノメイガ(*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア・ロイコト
40

50

レタ (*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ペルスペクタリス (*Cydalima perspectalis*)、シジア属 (*Cydia spp.*)、ジアファニア・ペルスペクタリス (*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属 (*Diatraea spp.*)、ジパロプシス・カスタネア (*Diparopsis castanea*)、エアリアス属 (*Earias spp.*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属 (*Ephestia spp.*)、エピノチア属 (*Epinotia spp.*)、エスチグメネ・アクレア (*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ (*Etiellazinckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma spp.*)、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguella*)、ユープロクチス属 (*Euproctis spp.*)、ユークゾア属 (*Euxoa spp.*)、フェルチア・ジャクリフェリア (*Feltia jaculifera*)、グラホリタ属 (*Grapholita spp.*)、ヘディア・ヌビフェラナ (*Hedya nubiferana*)、ヘリオティス属 (*Heliothis spp.*)、ハイマダラノメイガ (*Helicula undalis*)、ヘルペトグラマ属 (*Herpetogramma spp.*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコペルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ (*Lasmopalpus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ (*Leucoptera scitella*)、リトコレチス属 (*Lithocolethis spp.*)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ビフィダリス (*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属 (*Lymantria spp.*)、リオネチア属 (*Lyonetia spp.*)、マラコソマ属 (*Malaconosoma spp.*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属 (*Mythimna spp.*)、ノクツア属 (*Noctua spp.*)、オペロフテラ属 (*Operophtera spp.*)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene spp.*)、パンデミス属 (*Pandemis spp.*)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニブンクタ (*Pseudaleitia unipuncta*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属 (*Pieris spp.*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、ブレイス属 (*Prays spp.*)、シュードブルシア属 (*Pseudoplusia spp.*)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga spp.*)、セサミア属 (*Sesamia spp.*)、スバルガノチス属 (*Sparaganothis spp.*)、スポドブテラ属 (*Spodoptera spp.*)、シレブタ・デロガテ (*Sylepta derogata*)、シナンテドン属 (*Synanthedon spp.*)、タウメトポエア属 (*Thaumetopoea spp.*)、トルトリックス属 (*Tortrix spp.*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*)、およびスガ属 (*Yponomeuta spp.*)；

食毛目 (*Mallophaga*) から、例えば、ダマリネア属 (*Damalinea spp.*) およびケモノハジラミ属 (*Trichodectes spp.*)；

直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、ゴキブリ属 (*Blatta spp.*)、チャバネゴキブリ属 (*Blattella spp.*)、ケラ属 (*Gryllota lpa spp.*)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属 (*Locusta spp.*)、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ (*Neoc*

10

20

30

40

50

urtilla hexadactyla)、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta spp.*)、スカプテリスカス属 (*Scapteriscus spp.*)、およびコオロギ属 (*Schistocerca spp.*)；

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えば、リポセリス属 (*Liposcelis spp.*)；

ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、ナガノミ属 (*Ceratophyllus spp.*)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides spp.*) およびケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)；

総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えば、カリオトリップス・ファセオリ (*Calliothrips phaseoli*)、ハナアザミウマ属 (*Frankliniella spp.*)、ヘリオトリップス属 (*Heliothrips spp.*)、ヘルシノトリップス属 (*Hercinothrips spp.*)、パルテノトリップス属 (*Parthenothrips spp.*)、シルトトリップス・アウランティ (*Scirtothrips aurantii*)、ダイズアザミウマ (*Sericothrips variabilis*)、タエニオトリップス属 (*Taeniothrips spp.*)、アザミウマ属 (*Thrips spp.*)；

シミ目 (*Thysanura*) から、例えば、セイヨウシミ (*Lepisma saccharinum*)。

【0139】

本発明に係る活性成分は、特に植物、特に有用な植物および農業、園芸および森林における観賞植物、またはこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎または根などの器官において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち、抑制または破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

【0140】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシまたはソルガムなどの穀物；テンサイまたは飼料用ビートなどのビート；果実、例えば、リンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボまたは液果類、例えばイチゴ、ラズベリーまたはブラックベリーなどの仁果類、核果類または柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメまたはダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオまたはアメリカホドイモ (*ground nut*) などの油脂作物；カボチャ、キュウリまたはメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻またはジュートなどの纖維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツまたはタンジェリンなどの柑橘類の果物；ホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモまたはピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモンまたはショウノウなどのクスノキ科 (*Lauraceae*) の植物；およびさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物、およびラテックス植物である。

【0141】

本発明の組成物および／または方法は、花、低木、広葉樹および常緑樹を含む、任意の観賞植物および／または野菜作物にも使用され得る。

【0142】

例えば、本発明は、以下の観賞植物種のいずれかに使用され得る：カッコウアザミ属 (*Ageratum spp.*)、アロンソア属 (*Alonsoa spp.*)、イチリンソウ属 (*Anemone spp.*)、アニソドンテア・カベンシス (*Anisodon tea capsensis*)、アンセミス属 (*Anthemis spp.*)、キンギョソウ属 (*Antirrhinum spp.*)、シオン属 (*Aster spp.*)、ベゴニア属 (*Begonia spp.*)（例えば、エラチオールベゴニア (*B. elatior*)、シキザキベゴニア (*B. semperflorens*)、*B. チュベレウクス* (*B. tubereux*)）、ブーゲンビリア属 (*Bougainvillea s*

10

20

30

40

50

pp.)、ブラキスコメ属(*Brachycome* spp.)、アブラナ属(*Brassica* spp.)（観賞植物）、カルセオラリア属(*Calceolaria* spp.)、トウガラシ(*Capsicum annuum*)、ニチニチソウ(*Catharanthus roseus*)、カンナ属(*Canna* spp.)、ヤグルマギク属(*Centaurea* spp.)、キク属(*Chrysanthemum* spp.)、シネラリア属(*Cineraria* spp.)（シロタエギク(*C. maritime*)）、ハルシャギク属(*Coreopsis* spp.)、クラッスラ・コッキネア(*Crassula coccinea*)、クフェア・イグネア(*Cuphea ignea*)、ダリア属(*Dahlia* spp.)、デルフィニウム属(*Delphinium* spp.)、ケマンソウ(*Dicentra spectabilis*)、ドロテアンツス属(*Dorotheanthus* spp.)、トルコギキョウ(*Eustoma grandiflorum*)、レンギョウ属(*Forsythia* spp.)、フクシア属(*Fuchsia* spp.)、ゼラニウム・グナファリウム(*Geranium gnaphalium*)、ガーベラ属(*Gerbera* spp.)、センニチコウ(*Gomphrena globosa*)、キダチルリソウ属(*Heliotropium* spp.)、ヒマワリ属(*Helianthus* spp.)、フヨウ属(*Hibiscus* spp.)、アジサイ属(*Hortensia* spp.)、アジサイ属(*Hydrangea* spp.)、ソバカスソウ(*Hypoestes phyllostachya*)、ツリフネソウ属(*Impatiens* spp.)（アフリカホウセンカ(*I. Walleriana*)）、イレシネ属(*Iresines* spp.)、カランコエ属(*Kalanchoe* spp.)、ランタナ(*Lantana camara*)、ハナアオイ(*Lavatera trimestris*)、カエンキセワタ(*Leonotis leonurus*)、ユリ属(*Lilium* spp.)、メセンブリアンテマ属(*Mesembryanthemum* spp.)、ミヅホオズキ属(*Mimulus* spp.)、ヤグルマハツカ属(*Monarda* spp.)、ネメシア属(*Nemesia* spp.)、タゲテス属(*Tagetes* spp.)、ナデシコ属(*Dianthus* spp.)（カーネーション）、カンナ属(*Canna* spp.)、カタバミ属(*Oxalis* spp.)、ヒナギク属(*Bellis* spp.)、テンジクアオイ属(*Pelargonium* spp.)（アイビーゼラニウム(*P. peltatum*)）、モンテンジクアオイ(*P. Zonale*)）、スミレ属(*Viola* spp.)（パンジー）、ペチュニア属(*Petunia* spp.)、フロックス属(*Phlox* spp.)、プレクトランサス属(*Plectranthus* spp.)、ポインセチア種(*Poinsettia* spp.)、ツタ属(*Parthenocissus* spp.)（アメリカヅタ(*P. quinquefolia*)）、ツタ(*P. tricuspidata*)）、サクラソウ属(*Primula* spp.)、キンポウゲ属(*Ranunculus* spp.)、ツツジ属(*Rhododendron* spp.)、バラ属(*Rosa* spp.)（バラ）、オオハンゴンソウ属(*Rudbeckia* spp.)、セントポーリア属(*Saintpaulia* spp.)、アキギリ属(*Salvia* spp.)、ブルーファンフラワー(*Scaevola aemula*)、コチョウソウ(*Schizanthus wisetonensis*)、マンネングサ属(*Sedum* spp.)、ナス属(*Solanum* spp.)、サフィニア種(*Surfinia* spp.)、タゲテス属(*Tagetes* spp.)、タバコ属(*Nicotinia* spp.)、バーベナ種(*Verbena* spp.)、ヒヤクニチソウ属(*Zinnia* spp.)および他の花壇用の植物。

【0143】

例えば、本発明は、以下の野菜種のいずれかに使用され得る：ネギ属(*Allium* spp.)（ニンニク(*A. sativum*)、タマネギ(*A. cepa*)、エシャロット(*A. oschaninii*)、リーキ(*A. Porrum*)、シャロット(*A. ascalonicum*)、ネギ(*A. fistulosum*)）、チャービル(*Anthriscus cerefolium*)、セロリ(*Apium graveolus*)、

アスパラガス (*Asparagus officinalis*)、テンサイ (*Beta vulgaris*)、アブラナ属 (*Brassica spp.*) (ヤセイカンラン (*B. Oleracea*)、ハクサイ (*B. Pekinensis*)、カブ (*B. rapa*))、トウガラシ (*Capsicum annum*)、ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*)、エンダイブ (*Cichorium endivia*)、キクニガナ属 (*Cichorum spp.*) (チコリー (*C. intybus*)、エンダイブ (*C. endivia*))、スイカ (*Citrillus lanatus*)、キュウリ属 (*Cucumis spp.*) (サフラン (*C. sativus*)、メロン (*C. melo*))、カボチャ属 (*Cucurbita spp.*) (ペポカボチャ (*C. pepo*)、西洋カボチャ (*C. maxima*))、チョウセンアザミ属 (*Cyanara spp.*) (アーティチョーク (*C. scolymus*)、カルドン (*C. cardunculus*))、黒人参 (*Daucus carota*)、フェンネル (*Foeniculum vulgare*)、オトギリソウ属 (*Hypericum spp.*)、レタス (*Lactuca sativa*)、トマト属 (*Lycopersicon spp.*) (トマト (*L. esculentum*)、トマト (*L. lycopersicum*))、ハッカ属 (*Mentha spp.*)、バジル (*Ocimum basilicum*)、パセリ (*Petroselinum crispum*)、インゲンマメ属 (*Phaseolus spp.*) (インゲンマメ (*P. vulgaris*)、ベニバナインゲン (*P. coccineus*))、エンドウ (*Pisum sativum*)、ハツカダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マントネンロウ属 (*Rosemarinus spp.*)、アキギリ属 (*Salvia spp.*)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、ノヂシャ属 (*Valerianella spp.*) (ノヂシャ (*V. locusta*)、イタリアンコーンサラダ (*V. eriocarpa*)) およびソラマメ (*Vicia faba*)。

【0144】

好ましい観賞植物種としては、セントポーリア (*African violet*)、ベゴニア属 (*Begonia*)、ダリア属 (*Dahlia*)、ガーベラ属 (*Gerbera*)、アジサイ属 (*Hydrangea*)、クマツヅラ属 (*Verbena*)、バラ属 (*Rosa*)、カランコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア (*Poinsettia*)、シオン属 (*Aster*)、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、ハルシャギク属 (*Coreopsis*)、デルフィニウム属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、オオハンゴンソウ属 (*Rudbeckia*)、マンネングサ属 (*Sedum*)、ペチュニア属 (*Petunia*)、スミレ属 (*Viola*)、ツリフネソウ属 (*Impatiens*)、フウロソウ属 (*Geranium*)、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンポウゲ属 (*Ranunculus*)、フクシア属 (*Fuchsia*)、アキギリ属 (*Salvia*)、アジサイ属 (*Hortensia*)、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリ (*St. Johnswort*)、ミント、ピーマン、トマトおよびキュウリが挙げられる。

【0145】

本発明に係る活性成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネおよびダイズ作物におけるマメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ディアプロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) およびエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) を防除するのに特に好適である。本発明に係る活性成分はさらに、マメストラ属 (*Mamestra*) (好ましくは、野菜中)、コドリンガ (*Cydia pomonella*) (好ましくは、リンゴ中)、エンボアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは、野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (*Leptinot*

arsa) (好ましくは、ジャガイモ中) およびニカメイガ (*Chillo supressalis*) (好ましくは、イネ中) を防除するのに特に好適である。

【0146】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫（内部寄生性、半内部寄生性および外部寄生性線虫）、特に、ネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) および他のメロイドギネ属 (*Meloidogyne*) 種；シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) および他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種；ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、および他のヘテロデラ属 (*Heterodera*) 種；タネコブセンチュウ、アンギナ属 (*Anguina*) 種；クキセンチュウおよびハセンチュウ、アフェレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) 種；刺毛センチュウ (*Sting nematode*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) および他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) 種；マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) および他のバーサフェレンカス属 (*Bursaphelenchus*) 種；ワセンチュウ (*Ring nematode*)、クリコネマ属 (*Criconema*) 種、クリコネメラ属 (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス属 (*Criconemoide*s) 種、メソクリコネマ属 (*Mesocriconema*) 種；クキおよびリンケイセンチュウ、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) および他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) 種；キリセンチュウ (*Awl nematode*)、ドリコドルス属 (*Dolichodorus*) 種；ラセンセンチュウ (*Spiral nematode*)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*) および他のヘリオコチレンクス属 (*Helicotylenchus*) 種；サヤセンチュウおよびサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種およびヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoide*s) 種；ヒルスマニエラ属 (*Hirshmanniella*) 種；ヤリセンチュウ (*Lance nematode*)、ホプロライムス (*Hoploaimus*) 種；ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) 種；ハリセンチュウ (*Needle nematode*)、ロンギドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*) および他のロンギドルス属 (*Longidorus*) 種；ピンセンチュウ (*Pin nematode*)、プラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種；ネグサレセンチュウ (*Lesion nematode*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・カービタツス (*Pratylenchus curvitatus*)、プラチレンクス・ゴオディ (*Pratylenchus goodeyi*) および他のプラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種；ネモグリセンチュウ (*Burrowing nematode*)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) および他のラドホルス属 (*Radopholus*) 種；ニセフクロセンチュウ (*Reniform nematode*)、ロチレンクス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・レニフォルミス (*Rotylenchus reniformis*) および他のロチレンクス属 (*Rotylenchus*) 種；スクテロネマ属 (*Scutellonema*) 種；ミハリセンチュウ (*Stubby*

10

20

30

40

50

root nematode)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*) および他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種；イシュクセンチュウ (*Sunt nematode*)、ナミイシュクセンチュ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・デュビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) および他のチレンコリンクス属 (*Tylenchorhynchus*) 種；ミカンセンチュウ (*Citrus nematode*)、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) 種；オオハリセンチュウ (*Dagger nematode*)、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫；ならびにスパンギナ属 (*Subanguina spp.*)、ヒプソペリン属 (*Hypsoperine spp.*)、マクロポストニア属 (*Macroposthonia spp.*)、メリニウス属 (*Melinius spp.*)、プンクトデラ属 (*Punctodera spp.*)、およびキニスルシウス属 (*Quinisulcicus spp.*) などの他の植物寄生性線虫種による植物および植物の部分への被害を防除する方法にも関する。

【0147】

本発明の化合物は、軟体動物に対しても活性を有し得る。軟体動物の例としては、例えば、スクミリングガイ科 (*Ampullariidae*)；アリオン属 (*Arion*) (コウラクロナメクジ (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーファス* (*A. rufus*))；オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (ブラジバエナ・フルチクム (*Bradybaena fruticum*))；オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (ニワノオウシュウマイマイ (*C. hortensis*)、モリマイマイ (*C. Nemoralis*))；オクロジナ (*Ochlodina*)；デロセラス属 (*Deroceras*) (*D. アグレスチス* (*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム* (*D. empiricorum*)、*D. ラエヴェ* (*D. laeve*)、*D. レチクラツム* (*D. reticulatum*))；ディスクス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*))；ユーオムファリア属 (*Euomphalia*)；ガルバ属 (*Galba*) (*G. トルンクラタ* (*G. trunculata*))；ヘリセリア属 (*Helicelia*) (*H. イタラ* (*H. itala*)、*H. オブヴィア* (*H. obvia*))；マイマイ科 (*Helicidae*) ヘリシゴナ・アルブストルム (*Helicigona arbustorum*))；ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*)；ヘリクス属 (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*))；リマックス属 (*Limax*) (*L. シネレオニゲル* (*L. cinereoniger*)、キイロナメクジ (*L. flavus*)、チャコウラナメクジ (*L. marginatus*)、マダラコウラナメクジ (*L. maximus*)、*L. テネルス* (*L. tenellus*))；モノアライガイ属 (*Lymnaea*)；ミラックス属 (*Milax*) (ニワコウラナメクジ (*M. gagates*)、*M. マルギナツス* (*M. marginatus*)、*M. ソウェルビイ* (*M. sowerbyi*))；オペアス属 (*Opeas*)；リンゴガイ属 (*Pomacea*) (スクミリングガイ (*P. canaliculata*))；ミジンマイマイ属 (*Vallonia*) およびザニトイデス属 (*Zanitooides*) が挙げられる。

【0148】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特に、バチルス属 (*Bacillus*) の細菌に由来する公知のような1つまたは複数の選択的に作用する毒素を合成することができるよう、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

【0149】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) またはバチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*) に由来する殺虫タンパク質；または - エンドトキシン、例えば *Cry1Ab*、*Cry1Ac*、*Cry1F*、*Cry1Fa2*、*Cry2Ab*、*Cry3*

A、Cry3Bb1またはCry9Cなどのバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫タンパク質、または植物性殺虫タンパク質 (Vip)、例えば、Vip1、Vip2、Vip3またはVip3A；または細菌コロニー形成線虫、例えば、フォトラブダス・ルミネセンス (*Photorhabdus luminescens*)、キセノラブダス・ネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*)などのフォトラブダス属 (*Photorhabdus spp.*)。またはキセノラブダス属 (*Xenorhabdus spp.*) の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素および他の昆虫に特有の神経毒素などの動物によって產生される毒素；ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) 毒素などの真菌によって產生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチンまたはユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリンまたはブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (RIP)；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシリ-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-COA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャネルまたはカルシウムチャネルの遮断薬などのイオンチャネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。10

【0150】

20

本発明に関して、-エンドトキシンは、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1またはCry9C、または植物性殺虫タンパク質 (Vip)、例えばVip1、Vip2、Vip3またはVip3A、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素 (truncated toxin) および改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより產生される（例えば、国際公開第02/15701号を参照）。切断毒素、例えば、切断Cry1Abが公知である。改変毒素の場合、天然毒素の1つまたは複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が、毒素に挿入され、例えば、Cry3A055の場合、カテプシン-G-認識配列が、Cry3A毒素に挿入される（国際公開第03/018810号を参照）。

30

【0151】

このような毒素またはこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

【0152】

40

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。CryI型のデオキシリボ核酸およびこれらの調製が、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書および国際公開第90/13651号から公知である。

【0153】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫（鞘翅目 (*Coleoptera*)）、双翅昆虫（双翅目 (*Diptera*)）および蛾（鱗翅目 (*Lepidoptera*)）において特に一般的に見られる。

【0154】

殺虫剤耐性 (insecticidal resistance) をコードし、1つま50

たは複数の毒素を発現する1つまたは複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、Yield Guard（登録商標）（Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種）；Yield Guard Rootworm（登録商標）（Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；Yield Guard Plus（登録商標）（Cry1AbおよびCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry9C毒素を発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry1Fa2毒素、および除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ（PAT）を発現するトウモロコシ品種）；NuCOT N 33B（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard I（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard II（登録商標）（Cry1AcおよびCry2Ab毒素を発現するワタ品種）；VipCot（登録商標）（Vip3AおよびCry1Ab毒素を発現するワタ品種）；NewLeaf（登録商標）（Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種）；NatureGard（登録商標）、Agrisure（登録商標）GT Advantage（GA21グリホサート耐性形質）、Agrisure（登録商標）CB Advantage（Bt11アワノメイガ（CB）形質）およびProtecta（登録商標）である。

【0155】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のBt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（Ostrinia nubilalis））およびセサミア・ノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides）による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

【0156】

2. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のBt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ（アワノメイガ（Ostrinia nubilalis））およびセサミア・ノナグリオイデス（Sesamia nonagrioides）による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt176トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

【0157】

3. Syngenta Seeds SAS（Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France）製のMIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。改変Cry3A毒素のトランスジェニック発現により、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン-G-プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾されたCry3A055である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第03/018810号に記載されている。

【0158】

4. Monsanto Europe S.A.（270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium）製のMON863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON863は、Cry3Bb1毒素を発現し、特定の鞘翅目（Coleoptera）昆虫に対する耐性を有する。

【0159】

5. Monsanto Europe S.A.（270-272 Avenue de

10

20

30

40

50

Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のIPC
531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

【0160】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1Fおよび除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

【0161】

7. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のNK603×MON810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種NK603およびMON810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603×MON810トウモロコシは、除草剤Roundup (登録商標) (グリホサートを含有する)に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属 (Agrobacterium sp.) 菌株CP4から得られるタンパク質CP4EPSPS、およびヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目 (Lepidoptera)に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングンシス亜種クルスターク (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

【0162】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS (Zentrum für Biосicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>)にも記載されている。

【0163】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照)などの選択的作用を有する抗病原性物質 (antipathogenic substance) を合成することができるよう、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質およびこのような抗病原性物質を合成するが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書、国際公開第95/33818号および欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を产生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。

【0164】

作物はまた、真菌 (例えばフザリウム属 (Fusarium)、炭疽病、またはエキビヨウキン (Phytophthora))、細菌 (例えばシュードモナス属 (Pseudomonas)) またはウイルス (例えばジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊瘍ウイルス、キュウリモザイクウイルス) 病原体に対する向上した耐性のために改質され得る。

【0165】

作物は、ダイズシストセンチュウなどの線虫に対する向上した耐性を有する作物も含む。

【0166】

非生物的ストレスに対して耐性がある作物は、例えばNF-YBまたは当該技術分野において公知の他のタンパク質の発現を介して、乾燥、高い塩分、高温、寒気、霜、または光放射に対する向上した耐性を有する作物を含む。

10

20

30

40

50

【0167】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャネルまたはカルシウムチャネルの遮断薬などのイオンチャネル遮断薬、例えばウイルス性K P 1、K P 4またはK P 6毒素；スチルベンシンターゼ；ビベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」(P R P；例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照)；微生物によって產生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質または複素環式抗生物質(例えば、国際公開第95/33818号を参照)または植物病原体防御に関するタンパク質またはポリペプチド因子(国際公開第03/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」)が挙げられる。

10

【0168】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品および貯蔵環境の保護および原料(木材および織物など)、床仕上げ材および建築物の保護、および衛生分野において、特に、上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜および生産性家畜(productive livestock)の保護である。

【0169】

本発明は、有害生物(蚊および他の病原媒介動物など；http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/も参照)を防除するための方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除するための方法は、本発明の組成物を標的有害生物に、その生息地に、または表面もしくは基材に、ブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布または浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井または床面などの表面のIRS(屋内残留噴霧)施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテンおよびテントの形態(またはこれらの製造に使用され得る形態)の不織布または布帛材料などの基材に施用することが想定されている。したがって、本発明のさらなる目的は、式Iの化合物を含有する組成物を含む不織布および織物材料から選択される基材である。

20

【0170】

一実施形態において、このような有害生物を防除するための方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面または基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を標的有害生物に、その生息地に、または表面もしくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布または浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井または床面などの表面におけるIRS施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテンおよびテントの形態(またはこれらの製造に使用され得る形態)の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。

30

【0171】

処理されるべき不織布、布帛または網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布もしくは羊毛などの天然纖維、またはポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成纖維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005113886号または国際公開第2007/090739号から公知である。

40

【0172】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、全ての観賞用樹木ならびにあらゆる種類の果樹および堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野である。

【0173】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目(Lepid

50

optera) および鞘翅目 (Coleoptera) の木材穿孔性 (wood-boring) 昆虫に対して、特に、以下の表AおよびBに列挙される木材穿孔性昆虫 (woodborer) に対して特に好適である。

【0174】

【表5】

表 A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

| 科 | 種 | 寄生される宿主または作物 |
|---------------------------|--|--------------|
| タマムシ科 (Buprestidae) | アオナガタマムシ (<i>Agrilus planipennis</i>) | セイヨウトネリコ |
| カミキリムシ科 (Cerambycidae) | アノブルラ・グラブリペニス (<i>Anoplura glabripennis</i>) | 広葉樹 |
| キクイムシ科 (Scolytidae) | サクキクイムシ (<i>Xylosandrus crassiusculus</i>) | 広葉樹 |
| | クスノキオオキクイムシ (<i>X. multilatus</i>) | 広葉樹 |
| | マツノキクイムシ (<i>Tomicus piniperda</i>) | 針葉樹 |

【0175】

10

20

【表 6 - 1】

表 B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

| 科 | 種 | 寄生される宿主または作物 |
|------------------------|--|--|
| タマムシ科 (Buprestidae) | アグリルス・アンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>) | カバノキ |
| | アグリルス・ポリツス(<i>Agrilus politus</i>) | ヤナギ、カエデ |
| | アグリルス・サイ(<i>Agrilus sayi</i>) | ヤマモモ、ニセヤマモモ |
| | アグリルス・ビッタチコリス (<i>Agrilus vittaticollis</i>) | リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、サービスベリー、サンザシ |
| | クリンボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>) | リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカエデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニレ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナナカマド、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マルメロ、アメリカハナズオウ、サービスベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ |
| | テキサニア・カンペストリス (<i>Texania campestris</i>) | シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ |

10

20

30

【表 6 - 2】

| 科 | 種 | 寄生される宿主または作物 | |
|---------------------------|---|---|----|
| カミキリムシ科 (Cerambycidae) | ゴエス・プルベルレンツス(<i>Goes pulverulentus</i>) | ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤナギ、クロガシワ、アメリカキレハガシワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、スズカケノキ | 10 |
| | ゴエス・チグリヌス(<i>Goes tigrinus</i>) | オーク | |
| | ネオクリツス・アクミナツス(<i>Neoclytus acuminatus</i>) | セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オーク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、イースタンホップホーンビーム(Eastern hophornbeam)、ハナミズキ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハリグワ、サッサフラス、ライラック、マウンテン・マホガニー、セイヨウナシ、サクランボ、プラム、モモ、リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ | 20 |
| | ネオプチコデス・トリリネツス(<i>Neoptychodes trilineatus</i>) | イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry) | |
| | オベレア・オセラータ(<i>Oberea ocellata</i>) | ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイヨウナシ、スグリ、ブラックベリー(Blackberry) | 30 |
| | オベレア・トリプンクタータ(<i>Oberea tripunctata</i>) | ハナミズキ、ガマズミ属(Viburnum)、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ | |
| | オンシデレス・シングラータ(<i>Oncideres cingulata</i>) | ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属(Eucalyptus)、オーク、エノキ、カエデ、果樹 | 40 |
| | サペルダ・カルカラタ(<i>Saperda calcarata</i>) | ポプラ | |
| | ストロフィオナ・ニテンス(<i>Strophiona nitens</i>) | クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ | |

【表 6 - 3】

| 科 | 種 | 寄生される宿主または作物 | |
|------------------------|---|---|----|
| キクイムシ科 (Scolytidae) | コルチルス・コルンビアヌス (<i>Corthylus columbianus</i>) | カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ | 10 |
| | デンドロクトヌス・フロンタリス (<i>Dendroctonus frontalis</i>) | マツ | |
| | ドリオコエテス・ベツラエ (<i>Dryocoetes betulae</i>) | カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ | |
| | モナルトルム・ファスシアツム (<i>Monarthrum fasciatum</i>) | オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ | |
| | フロエオトリブス・リミナリス (<i>Phloeotribus liminaris</i>) | モモ、サクランボ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド | 20 |
| | シードピチオフトルス・ブルイノスス (<i>Pseudopityophthorus pruinosis</i>) | オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム (Chickasaw plum)、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ | |
| スカシバガ科 (Sesiidae) | パラントレネ・シムラヌス (<i>Paranthrene simulans</i>) | オーク、アメリカグリ | |
| | サンニナ・ウロセリフォルミス (<i>Sannina uroceriformis</i>) | カキ | 30 |
| | シナンテドン・エキシチオサ (<i>Synanthedon exitiosa</i>) | モモ、プラム、ネクタリン、サクランボ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ | |
| | シナンテドン・ピクチペス (<i>Synanthedon pictipes</i>) | モモ、プラム、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ | |
| | シナンテドン・ルブロファスシア (<i>Synanthedon rubrofascia</i>) | アメリカヌマミズキ | |
| | シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>) | ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属 (<i>Viburnum</i>)、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ | 40 |
| | ビタセア・ポリスチフォルミス (<i>Vitacea polistiformis</i>) | ブドウ | |

本発明はまた、例えば甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ (ground pearl)、ヤステ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバッグ (southern chin ch bug) および地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫および成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

【0177】

特に、本発明は、地虫 (コガネカブト属 (*Cycllocephala* spp.)) (例えば、マスクドコガネムシ (masked chafer)、*C. lurida*))、リゾトログス属 (*Rhizotrogus* spp.) (例えば、ヨーロピアンコガネムシ、*R. majalis*))、コチヌス属 (*Cotinus* spp.) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*))、ポピリア属 (*Poecilia* spp.) (例えば、マメコガネ (*Japanese beetle*)、マメコガネ (*P. japonica*))、フィロファガ属 (*Phyllophaga* spp.) (例えば、コガネムシ (*May / June beetle*))、アテニウス属 (*Ataenius* spp.) (例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス (*Black turfgrass ataenius*)、*A. spretulus*))、マラデラ属 (*Maladera* spp.) (例えば、アカビロウドコガネ、*M. castanea*)) およびトマルス属 (*Tomarus* spp.) など)、ワタフキカイガラムシ (マルガロデス属 (*Margarodes* spp.))、ケラ (タウニー (tawny)、サウザン (southern)、および短翅型; スカプテリスクス属 (*Scapteriscus* spp.))、ケラ (*Gryllotalpa africana*) およびレザージャケット (*leather jacket*) (ヨーロピアンクレーンフライ (*European crane fly*)、ガガソボ属 (*Tipula* spp.)) を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

【0178】

本発明はまた、ヨトウムシ (*Spodoptera frugiperda*)、および一般的なヨトウムシ (*common armyworm*) (プセウダレチア・ウニブンクタ (*Pseudaletia unipuncta*) など)、ネキリムシ、ゾウムシ (スフェノホルス属 (*Sphenophorus* spp.))、シバオサゾウムシ (*S. venatus versititus*) および *S. parvulus* (*S. parvulus*) など)、およびソッドウェブワーム (*sod webworm*) (クラムブス属 (*Crambus* spp.)) および熱帯ソッドウェブワーム (*tropical sod webworm*)、ケナシクロオビクロノメイガ (*Herpetogramma phaeopteralis*) などを含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

【0179】

本発明はまた、ヒメコガネナガカメムシ (サウザンキンクバッグ、ブリスス・インスラリス (*Blissus insularis*) など)、ギョウギシバ (*Bermudagrass*) のダニ (エリオフィエス・シノドニエンシス (*Eriophyes cynodonensis*))、アフリカヒゲシバ (*rhodes grass*) のコナカイガラムシ (チガヤシロオカイガラムシ (*Antonina graminis*))、2本線のあるアワフキムシ (*two-lined spittlebug*) (プロサピア・ビシンクタ (*Propsapia bicincta*))、ヨコバイ、ネキリムシ (ヤガ科 (*Noctuidae*)))、およびムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

【0180】

本発明はまた、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ (*Solenopsis invicta*) などの芝草の他の有害生物を防除するのに使用され得る。

【0181】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ(hard tick)、ヒメダニ(soft tick)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ(サシバエおよび舐性(licking)のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミおよびノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

【0182】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目(*Anoplurida*)のうち：ブタジラミ属(*Haematopinus spp.*)、ホソジラミ属(*Linognathus spp.*)、ペディクルス属(*Pediculus spp.*)およびケジラミ属(*Phtirus spp.*)、ソレノポテス属(*Solenopotes spp.*)。 10

【0183】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ(hard tick)、ヒメダニ(soft tick)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ(サシバエおよび舐性(licking)のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミおよびノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

【0184】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目(*Anoplurida*)：ブタジラミ属(*Haematopinus spp.*)、ホソジラミ属(*Linognathus spp.*)、ペディクルス属(*Pediculus spp.*)およびケジラミ属(*Phtirus spp.*)、ソレノポテス属(*Solenopotes spp.*)。 20

【0185】

ハジラミ目(*Mallophagida*)のうち：トリメノポン属(*Trimenopon spp.*)、タンカクハジラミ属(*Menopon spp.*)、トリノトン属(*Trinoton spp.*)、ボビコラ属(*Bovicola spp.*)、ウェルネッキエラ属(*Werneckiella spp.*)、レピケントロン属(*Lepikeptron spp.*)、ダマリナ属(*Damalina spp.*)、トリコデクテス属(*Trichodectes spp.*)およびフェリコラ属(*Felicola spp.*)。 30

【0186】

双翅目(*Diptera*)ならびにその亜目であるネマトセリナ亜目(*Nematocerina*)および短角亜目(*Brachycerina*)のうち、例えば、ヤブカ属(*Aedes spp.*)、ハマダラカ属(*Anopheles spp.*)、イエカ属(*Culex spp.*)、ブヨ属(*Simulium spp.*)、ツノマユブユ属(*Eusimulium spp.*)、サシチョウバエ属(*Phlebotomus spp.*)、ルツオミヤ属(*Lutzomyia spp.*)、キュリコイデス属(*Culicoides spp.*)、メクラアブ属(*Chrysops spp.*)、ヒボミトラ属(*Hybomitra spp.*)、キイロアブ属(*Atylotus spp.*)、アブ属(*Tabanus spp.*)、ゴマフアブ属(*Haematopota spp.*)、フィリポミア属(*Philippomyia spp.*)、ブラウラ属(*Braula spp.*)、イエバエ属(*Musca spp.*)、トゲアシメマトイ属(*Hydrotaea spp.*)、サシバエ属(*Stomoxyys spp.*)、ヘマトビア属(*Haematobia spp.*)、モレリア属(*Morellia spp.*)、ヒメイエバエ属(*Fannia spp.*)、ツェツエバエ属(*Glossina spp.*)、オオクロバエ属(*Calliphora spp.*)、キンバエ属(*Lucilia spp.*)、オビキンバエ属(*Chrysomyia spp.*)、ヴォールファールトニクバエ属(*Wohlfahrtia spp.*)、ニクバエ属(*Sarcophaga spp.*)、ヒツジバエ属(*Oestrus spp.*)、ウシバエ属(*Hypoderma spp.*)、ウマバエ属(*Gasterophilus spp.*)、シラミバ 50

工属 (*Hippobosca* spp.)、シカシラミバエ属 (*Lipoptena* spp.) およびヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。

【0187】

ノミ目 (*Siphonapterida*) のうち、例えば、ヒトノミ属 (*Pulex* spp.)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.)、ネズミノミ属 (*Xenopsylla* spp.)、ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)。

【0188】

異翅目 (*Heteroptera*) のうち、例えば、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属 (*Panstrongylus* spp.)。 10

【0189】

ゴキブリ目 (*Blattaria*) のうち、例えば、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattelagermanica*) およびスペラ属 (*Supella* spp.)。

【0190】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) ならびにマダニ亜目 (*Metastigmata*) および中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えば、ナガヒメダニ属 (*Argas* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Haemophysalis* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニスス属 (*Dermanyssus* spp.)、ライリエチア属 (*Raiillietia* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.) およびバロア属 (*Varroa* spp.)。 20

【0191】

ダニ目 (*Actinedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) およびカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) のうち、例えば、アカラピス属 (*Acarapis* spp.)、ツメダニ属 (*Cheyletiella* spp.)、オルニソケイレチア属 (*Ornithochyletia* spp.)、ミオビア属 (*Myobia* spp.)、ヒツジツメダニ属 (*Psorergates* spp.)、ニキビダニ属 (*Demodex* spp.)、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp.)、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp.)、コナダニ属 (*Acarus* spp.)、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp.)、ゴミコナダニ属 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属 (*Hypodectes* spp.)、ブテロリクス属 (*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp.)、ヒゼンダニ属 (*Sarcopetes* spp.)、ショウセンコウヒゼンダニ属 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属 (*Cytodites* spp.) およびラミノシオプテス属 (*Laminozioptes* spp.)。 40

【0192】

本発明に係る組成物はまた、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙および厚紙、皮革、床仕上げ材および建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのに好適である。

【0193】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosiss*)、アノビウム・ブンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、ブチリヌスペクチコルニス (*Ptilinus specticornis*)、デンドロビウム・ペルチネクス (*Dendrobium pertinax*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Prionobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・エクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテスルギコリス (*Minthes rugicollis*)、キシリボルス属種 (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カブシ NS-1
ンス (*Bostrychus capucinus*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種 (*Sinoxylon spec.*) およびチビタケナガシンクイムシ (*Dinoderus minutus*) などの甲虫、ならびにさらにコルリキバチ (*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*) およびウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (*hymenopteran*)、ならびにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kalotermes flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heterotermes indicola*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Mastotermes darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) およびイエシロアリ (*Coptotermes formosanus*) などのシロアリ、ならびにセイヨウシミ (*Leptisma saccharina*) などのシミ。

【0194】

本発明に係る化合物は、非修飾形態で有害生物防除剤として使用され得るが、それらは、一般に、担体、溶媒および表面活性物質などの製剤化補助剤を用いて様々な方法で組成物へと製剤化される。製剤は、様々な物理的形態、例えば粉剤、ゲル、水和剤、水和性粒剤、水分散性錠剤、発泡性ペレット (*effervescent pellet*)、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物 (*microemulsifiable concentrate*)、水中油乳剤、油性フロアブル剤 (*oil-flowable*)、水性分散液、油性分散液、サスペンション (*suspension*)、カプセル懸濁剤、乳化性粒剤、可溶性液体、水溶性濃縮物 (担体として水または水混和性有機溶媒を含む)、含浸ポリマーフィルム (*impregnated polymer film*) の形態または例えば *the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010)* から公知の他の形態であり得る。このような製剤は、直接使用されるかまたは使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量栄養素、生物有機体、油または溶媒を用いて行われ得る。

【0195】

製剤は、微粉化された固体、粒剤、液剤、分散液または乳剤の形態の組成物を得るため

に、例えば活性成分を製剤化補助剤と混合することによって調製され得る。活性成分はまた、微粉化された固体、鉱油、植物もしくは動物由来の油、植物もしくは動物由来の変性油、有機溶媒、水、表面活性物質またはそれらの組合せなどの他の補助剤とともに製剤化され得る。

【0196】

活性成分はまた、微細なマイクロカプセル中に含有され得る。マイクロカプセルは、多孔質担体中に活性成分を含有する。これにより、活性成分を制御された量で環境中に放出させることができる（例えば持続放出）。マイクロカプセルは、通常、0.1～500 μmの直径を有する。マイクロカプセルは、カプセル重量の約25～95重量%の量で活性成分を含有する。活性成分は、モノリシック固体（monolithic solid）の形態、固体もしくは液体分散体中の微粒子の形態または好適な溶液の形態であり得る。封入用の膜は、例えば、天然もしくは合成ゴム、セルロース、スチレン／ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリ尿素、ポリウレタンまたは化学修飾ポリマーおよびデンブンキサンテート（starch xanthate）または当業者に公知の他のポリマーを含み得る。あるいは、活性成分が基剤の固体マトリクス中に微粉化された粒子の形態で含まれた微細なマイクロカプセルが形成され得るが、このマイクロカプセル自体は封入されない。

【0197】

本発明に係る組成物の調製に好適な製剤化補助剤はそれ自体公知である。液体担体として、以下のものが使用され得る：水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、炭酸ブチレン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエテート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトル（diproxitol）、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサン、炭酸エチレン、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、-ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、-ブチロラクトン、グリセロール、酢酸グリセロール、二酢酸グリセロール、三酢酸グリセロール、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロビル、乳酸、ラウリルアミン、酸化メシチル、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、乳酸プロピル、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、ペルクロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、およびアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノールなどのより高い分子量のアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N-メチル-2-ピロリドンなど。

【0198】

好適な固体担体は、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石粘土、シリカ、アタバージャイト粘土、珪藻土、石灰石、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロ

10

20

30

40

50

ナイト、綿実殻、小麦粉、大豆粉、軽石、木粉、粉碎されたクルミ殻、リグニンおよび同様の物質である。

【0199】

多くの表面活性物質が、固体および液体製剤の両方中、特に、使用前に担体で希釈され得る製剤中で有利に使用され得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、非イオン性またはポリマーであってもよく、それらは、乳化剤、湿潤剤もしくは懸濁化剤としてまたは他の目的のために使用され得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどの硫酸アルキルの塩；デシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリールスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノール／アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどのアルコール／アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石けん；ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートなどのアルキルナフタレンスルホネートの塩；ナトリウムジ(2-エチルヘキシル)スルホスクシネットなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；オレイン酸ソルビトールなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第四級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびにモノ-およびジ-アルキルリン酸エステルの塩；ならびにさらに例えば McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載されているさらなる物質が挙げられる。10

【0200】

殺有害生物製剤に使用され得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁化剤、染料、酸化防止剤、発泡剤、光吸收剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤またはpH調整物質および緩衝液、腐食防止剤、香料、湿潤剤、吸収向上剤、微量栄養素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤、ならびに液体および固体肥料が挙げられる。20

【0201】

本発明に係る組成物は、植物もしくは動物由来の油、鉱油、このような油のアルキルエステルまたはこのような油と油誘導体との混合物を含む添加剤を含み得る。本発明に係る組成物中の油添加剤の量は、一般に、施用される混合物を基準にして、0.01～10%である。例えば、油添加剤は、スプレー混合物が調製された後、所望の濃度でスプレータンクに加えられ得る。好ましい油添加剤は、鉱油または植物由来の油、例えばナタネ油、オリーブ油もしくはヒマワリ油、乳化植物油、植物由来の油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体、または魚油もしくは牛脂などの動物由来の油を含む。好ましい油添加剤は、C₈～C₂₂脂肪酸のアルキルエステル、特に、C₁₂～C₁₈脂肪酸のメチル誘導体、例えばラウリン酸、パルミチン酸およびオレイン酸のメチルエステル（それぞれ、ラウリン酸メチル、パルミチン酸メチルおよびオレイン酸メチル）を含む。多くの油誘導体が、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。30

【0202】

本発明の組成物は、一般に、0.1～99重量%、特に、0.1～95重量%の、本発明の化合物および1～99.9重量%の製剤化補助剤（これは、好ましくは、0～25重量%の表面活性物質を含む）を含む。市販の製品は、好ましくは、濃縮物として製剤化され得るが、最終使用者は、通常、希釈製剤を用いるであろう。

【0203】

施用量は、広い範囲内で変化し、土壤の性質、施用方法、作物植物、防除される有害生物、そのときの気候条件、ならびに施用方法、施用の時期および標的作物に左右される他の要因に応じて決まる。一般的な指針として、化合物は、1～20001/h a、特に、40

10 ~ 1000 l / ha の割合で施用され得る。

【0204】

好ましい製剤は、以下の組成を有し得る（重量%）。

【0205】

乳剤：

活性成分：1 ~ 95 %、好ましくは60 ~ 90 %

表面活性剤：1 ~ 30 %、好ましくは5 ~ 20 %

液体担体：1 ~ 80 %、好ましくは1 ~ 35 %

【0206】

ダスト剤：

活性成分：0.1 ~ 10 %、好ましくは0.1 ~ 5 %

固体担体：99.9 ~ 90 %、好ましくは99.9 ~ 99 %

【0207】

懸濁濃縮物：

活性成分：5 ~ 75 %、好ましくは10 ~ 50 %

水：94 ~ 24 %、好ましくは88 ~ 30 %

表面活性剤：1 ~ 40 %、好ましくは2 ~ 30 %

【0208】

水和剤：

活性成分：0.5 ~ 90 %、好ましくは1 ~ 80 %

表面活性剤：0.5 ~ 20 %、好ましくは1 ~ 15 %

固体担体：5 ~ 95 %、好ましくは15 ~ 90 %

【0209】

粒剤：

活性成分：0.1 ~ 30 %、好ましくは0.1 ~ 15 %

固体担体：99.5 ~ 70 %、好ましくは97 ~ 85 %

【0210】

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

【0211】

【表7】

10

20

30

40

| 水和剤 | a) | b) | c) |
|--|------|------|------|
| 活性成分 | 25 % | 50 % | 75 % |
| リグノスルホン酸ナトリウム | 5 % | 5 % | - |
| ラウリル硫酸ナトリウム | 3 % | - | 5 % |
| ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム | - | 6 % | 10 % |
| フェノールポリエチレングリコールエーテル(7~8 モルのエチレンオキシド) | - | 2 % | - |
| 高度に分散したケイ酸 | 5 % | 10 % | 10 % |
| カオリン | 62 % | 27 % | - |

【0212】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が好適なミルにおいて十分に粉碎され、これにより、水和剤が得られ、これは水で希釈されて、所望の濃度の懸濁液が得られる

50

【0213】

【表8】

| 乾燥種子処理用の粉剤 | a) | b) | c) |
|------------|------|------|------|
| 活性成分 | 25 % | 50 % | 75 % |
| 軽油 | 5 % | 5 % | 5 % |
| 高度に分散したケイ酸 | 5 % | 5 % | - |
| カオリン | 65 % | 40 % | - |
| タルカム | - | | 20 |

【0214】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が好適なミルにおいて十分に粉碎され、種子処理に直接使用され得る粉剤が得られる。

【0215】

【表9】

| 乳剤濃縮物 | |
|---|------|
| 活性成分 | 10 % |
| オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル (4~5 モルのエチレンオキシド) | 3 % |
| ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム | 3 % |
| ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35 モルのエチレン オキシド) | 4 % |
| シクロヘキサン | 30 % |
| キシレン混合物 | 50 % |

【0216】

植物保護に使用され得る、任意の所要の希釈率の乳剤が、水による希釈によってこの濃縮物から得られる。

【0217】

10

20

30

40

【表 1 0】

| ダスト剤 | a) | b) | c) |
|-------|------|------|------|
| 活性成分 | 5 % | 6 % | 4 % |
| タルカム | 95 % | - | - |
| カオリン | - | 94 % | - |
| 無機充填剤 | - | - | 96 % |

10

【0218】

即時使用可能なダスト剤が、担体と組み合わせて混合し、混合物を好適なミルにおいて粉碎することによって得られる。このような粉末は、種子の乾式粉衣 (dry dressing) にも使用され得る。

【0219】

【表 1 1】

| 押出粒剤 | |
|---------------|------|
| 活性成分 | 15 % |
| リグノスルホン酸ナトリウム | 2 % |
| カルボキシメチルセルロース | 1 % |
| カオリン | 82 % |

20

【0220】

この組合せは、補助剤と混合され、粉碎され、混合物は、水で濡らされる。混合物は、押し出され、次に、空気流中で乾燥される。

30

【0221】

【表 1 2】

| 被覆粒剤 | |
|----------------------|------|
| 活性成分 | 8 % |
| ポリエチレングリコール(分子量 200) | 3 % |
| カオリン | 89 % |

40

【0222】

この微粉化された組合せは、ミキサー中において、ポリエチレングリコールで濡らされたカオリンに均一に適用される。このように、ほこりのない被覆粒剤が得られる。

【0223】

【表 1 3】

懸濁濃縮物

| | |
|---|------|
| 活性成分 | 40 % |
| プロピレングリコール | 10 % |
| ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 モルの エチレンオキシド) | 6 % |
| リグノスルホン酸ナトリウム | 10 % |
| カルボキシメチルセルロース | 1 % |
| シリコーン油(水中 75%の乳剤の形態) | 1 % |
| 水 | 32 % |

10

【0224】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて生きた植物および植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけまたは浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

20

【0225】

【表 1 4】

種子処理用のフロアブル剤

| | |
|-----------------------------------|--------|
| 活性成分 | 40 % |
| プロピレングリコール | 5 % |
| コポリマーブタノール PO/EO | 2 % |
| 10~20 モルの EO を含むトリスチレンフェノール | 2 % |
| 1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中 20%の溶液の形態) | 0.5 % |
| モノアゾ-顔料カルシウム塩 | 5 % |
| シリコーン油(水中 75%の乳剤の形態) | 0.2 % |
| 水 | 45.3 % |

30

【0226】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて生きた植物および植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけまたは浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

40

【0227】

持続放出性カプセル懸濁剤

28 部のこの組合せを 2 部の芳香族溶媒および 7 部のトルエンジイソシアネート / ポリメチレン - ポリフェニルイソシアネート - 混合物 (8 : 1) と混合する。この混合物を、所望の粒度が得られるまで、1 . 2 部のポリビニルアルコールと、0 . 05 部の消泡剤と、51 . 6 部の水との混合物中で乳化する。この乳剤に、5 . 3 部の水中の 2 . 8 部の 1

50

, 6 - ジアミノヘキサンの混合物を加える。混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁剤を、0.25部の増粘剤および3部の分散剤を加えることによって安定化させる。カプセル懸濁剤製剤は、28%の活性成分を含有する。カプセルの中間直径は8~15μmである。得られた製剤を該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に施用する。

【0228】

製剤のタイプとしては、乳剤濃縮物(EC)、懸濁濃縮物(SC)、サスポエマルション(SE)、カプセル懸濁剤(CS)、水和性粒剤(WG)、乳化性粒剤(EG)、油中水乳剤 EO)、水中油乳剤(EW)、マイクロエマルション(ME)、油性分散液(OD)、油混和性フロアブル剤(OF)、油混和性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、微量散布用懸濁剤(*ultra-low volume suspension*)(SU)、微量散布用液剤(*ultra-low volume liquid*)(UL)、工業用濃縮物(*technical concentrate*)(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、可溶性粒剤(SG)または農学的に許容できる補助剤と組み合わされた任意の技術的に実現可能な製剤が挙げられる。10

【実施例】

【0229】

調製実施例：

「Mp」は、融点()を意味する。遊離基は、メチル基を表す。¹Hおよび¹⁹F NMR測定を Brucker 400 MHz または 300 MHz 分光計で記録し、化学シフトを TMS 標準に関して ppm で示す。示されるように、スペクトルを重水素化溶媒中で測定する。20

【0230】

LCMS方法：

方法 A - 標準：

エレクトロスプレー源(極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30~60 V、抽出装置：2.00 V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0 L / 時、脱溶媒和ガス流：650 L / 時、質量範囲：100~900 Da)を備えた Waters 製の質量分析計(SQD または ZQ シングル四重極質量分析計)および Waters 製の Acuity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置で、スペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、3.0 × 2.1 mm、温度：60、DAD 波長範囲(nm)：210~500、溶媒勾配：A = 水 + 5% の MeOH + 0.05% の HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05% の HCOOH：勾配：勾配：0 分間 0% の B、100% の A；1.2~1.5 分間 100% の B；流量(ml / 分) 0.85。30

【0231】

方法 B - 標準長さ：

エレクトロスプレー源(極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30~60 V、抽出装置：2.00 V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0 L / 時、脱溶媒和ガス流：650 L / 時、質量範囲：100~900 Da)を備えた Waters 製の質量分析計(SQD または ZQ シングル四重極質量分析計)および Waters 製の Acuity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置で、スペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、3.0 × 2.1 mm、温度：60、DAD 波長範囲(nm)：210~500、溶媒勾配：A = 水 + 5% の MeOH + 0.05% の HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05% の HCOOH：勾配：勾配：0 分間 0% の B、100% の A；2.7~3.0 分間40

50

100%のB；流量(ml/分)0.85。

【0232】

方法C - 非極性：

エレクトロスプレー源(極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00kV、コーン範囲：30~60V、抽出装置：2.00V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0L/時、脱溶媒和ガス流：650L/時、質量範囲：100~900Da)を備えたWaters製の質量分析計(SQDまたはZQシングル四重極質量分析計)およびWaters製のAcuity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置で、スペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30×2.1mm、温度：60、DAD波長範囲(nm)：210~500、溶媒勾配：A = 水 + 5%のMeOH + 0.05%のHCOOH、B = アセトニトリル + 0.05%のHCOOH：勾配：勾配：0分間40%のB、60%のA；1.2~1.5分間100%のB；流量(ml/分)0.85。

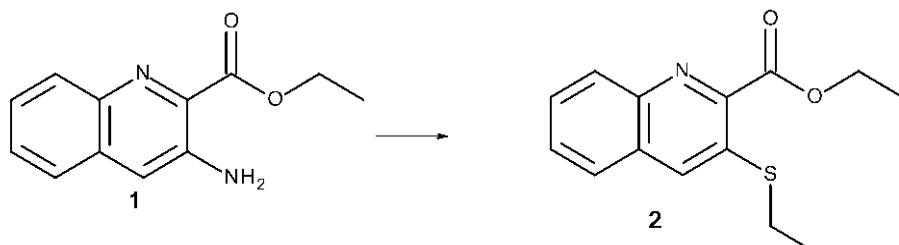
【0233】

中間体の合成：

中間体1：3-エチルスルファニルキノリン-2-カルボン酸の合成：

工程A：エチル3-エチルスルファニルキノリン-2-カルボキシレート：

【化76】

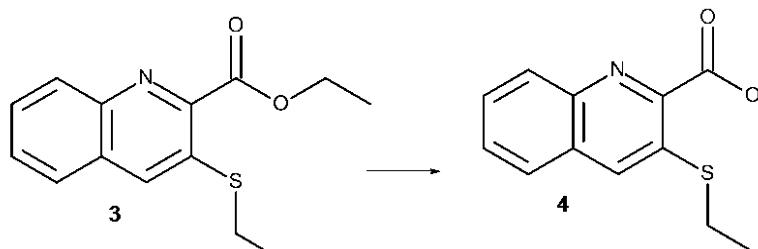


DCE(30ml)中の化合物1(3.6g、16.66mmol)の攪拌溶液にジエチルジスルフィド(4.51ml、36.6mmol)を加え、次に、亜硝酸t-ブチルを周囲温度で滴下して加えた。反応混合物を2時間にわたって40に加熱した。反応をTLCによって監視した。出発材料の完了後、反応混合物をCH₂Cl₂で希釈し、水(2×10mL)で洗浄した。有機層をNa₂SO₄上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、ヘキサン-酢酸エチルを用いたカラムクロマトグラフィー(100~200シリカゲル)によって精製したところ、所望の化合物が黄色の液体(量：1.0g；収率=23%)として得られた。¹H NMR(400MHz, CDCl₃)：(ppm) 8.14(d, 1H)、8.06(s, 1H)、7.75(d, 1H)、7.68(m, 1H)、7.58(m, 1H)、4.54(q, 2H)、3.03(q, 2H)、1.48(t, 3H)、1.40(t, 3H)。

【0234】

工程B：3-エチルスルファニルキノリン-2-カルボン酸：

【化77】



10

20

30

40

50

T H F (8 m l) 中の化合物 3 (1 g、3 . 8 m m o l) の攪拌溶液に N a O H (2 N 、2 . 2 当量) を室温で加えた。反応混合物を周囲温度で 16 時間攪拌した。反応を T L C によって監視した。出発材料の完了後、反応混合物を酢酸エチル (2 × 1 0 m L) で抽出した。次に、水部分を 10 % のクエン酸溶液によって pH = 4 になるまで酸性化し、酢酸エチル (3 × 2 0 m l) で抽出した。有機層を N a₂S O₄ 上で乾燥させた。ろ過し、減圧下で濃縮したところ、粗生成物の固体が得られ、それをエーテルで研和したところ、所望の化合物が黄色の固体 (量 : 613 m g ; 収率 = 68 %) として得られた。¹H N M R (4 0 0 M H z、D M S O - d₆) : (p p m) 13 . 7 (s , 1 H) 、8 . 4 2 (s , 1 H) 、8 . 0 0 (m , 2 H) 、7 . 7 5 (m , 1 H) 、7 . 6 8 (m , 1 H) 、3 . 0 9 (q , 2 H) 、1 . 2 9 (t , 3 H) .

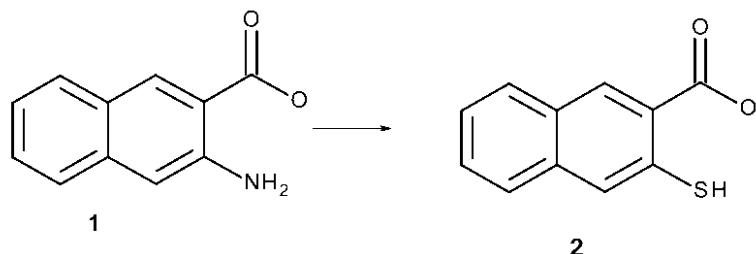
10

【 0 2 3 5 】

中間体 2 : 3 - エチルスルファニルナフタレン - 2 - カルボン酸の合成 :

工程 A : 3 - スルファニルナフタレン - 2 - カルボン酸 :

【 化 7 8 】



20

5 で水 (2 8 m L) および濃 H C l (1 1 . 4 m L) 中の化合物 - 1 (1 0 g、5 3 . 4 7 m m o l) の攪拌懸濁液に水 (1 4 . 6 m L) 中の N a N O₂ (3 . 6 9 g、5 3 . 4 7 m m o l) の溶液を滴下して加え、溶液を 5 で維持した。碎かれた氷を添加中に定期的に反応混合物に加えて、温度を 5 未満に保持した。一方、N a₂S . 9 H₂O (1 3 . 7 g、1 7 6 . 4 7 m m o l) および硫黄華 (1 . 8 8 g、5 8 . 8 2 m m o l) を加熱によって水 (1 5 m L) に溶解させ、N a O H (1 0 M、5 . 5 m L) の添加によってアルカリ性にし、得られたアルカリ性ジスルフィド溶液を氷浴中で 5 に冷却した。碎かれた氷を定期的に加えて温度を 5 未満に維持しながら、冷ジアゾ溶液をアルカリ性ジスルフィド溶液に滴下して加えた。ジアゾ溶液の添加後、N₂ガスの発生が停止するまで混合物を周囲温度で攪拌した。黄色の固体としての粗生成物の沈殿が完了するまで濃 H C l を溶液に加えた。沈殿物を収集し、N a H C O₃ の飽和溶液 (1 3 0 m L) 中で沸騰させた。1 5 分間沸騰させた後、混合物をろ過して、不溶性材料を除去し、粗生成物が黄色の固体として析出するまで濃 H C l をろ液に加えた。沈殿が完了するまで過剰な濃 H C l を混合物に加え、沈殿物をろ過によって単離した。この材料を 1 5 分間にわたって無水 E t O H (5 0 m L) 中で沸騰させ、ろ過し、ろ液を減圧下で濃縮したところ、ジチオサリチル酸誘導体が得られた。次に、ジチオサリチル酸誘導体を氷 C H₃C O O H (5 0 m L) 中で Z n 粉末 (3 . 2 g) と混合し、4 8 時間にわたって還流させた。次に、混合物を冷却し、ろ過した。このように収集された固体を 5 M の N a O H (1 0 0 m L) 中で沸騰させた。3 0 分間沸騰させた後、溶解されていない固体をろ過によって除去し、粗生成物が黄色の固体として析出するまで透明なろ液を濃 H C l で酸性化した。沈殿が完了するまで濃 H C l を混合物に加えた。沈殿物を収集し、E t O H (4 0 m L) 中で沸騰させ、ろ過し、ろ液を減圧下で濃縮したところ、チオサリチル酸誘導体 2 が得られた。この材料をさらに精製せずに次の工程にそのまま持ち越した (量 : 4 g ; 収率 = 3 6 %) 。

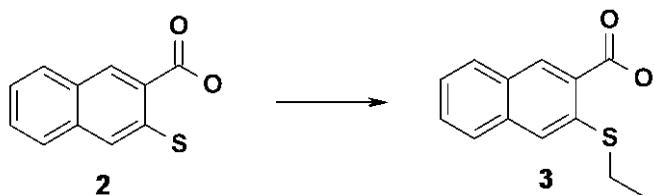
30

【 0 2 3 6 】

工程 B : 3 - エチルスルファニルナフタレン - 2 - カルボン酸 :

40

【化79】

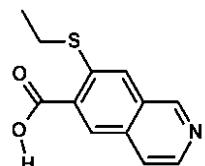


エタノール(10ml)およびNaOH(1M、10mL)中の化合物2(1.9g、9.36)の攪拌溶液にEtI(0.75ml、9.36mmol)を周囲温度で加えた。反応混合物を48時間で攪拌した。LC-MSにより、所望の生成物が形成されたことが示された。溶媒を蒸発させ、粗生成物をpH=2になるまで酸性化し、酢酸エチル(2×30ml)で抽出した。酢酸エチル層をNa₂SO₄上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、ヘキサン-酢酸エチルを用いたカラムクロマトグラフィー(100~200シリカゲル)によって精製したところ、所望の化合物が黄色の固体として得られた。收率=量: 274mg; 25%。¹H NMR(400MHz、DMSO-d₆): (ppm) 13.14(s, 1H)、8.49(s, 1H)、7.99(d, 1H)、7.90(d, 1H)、7.81(s, 1H)、7.62(t, 1H)、7.48(t, 1H)、3.04(q, 2H)、1.32(t, 3H).

【0237】

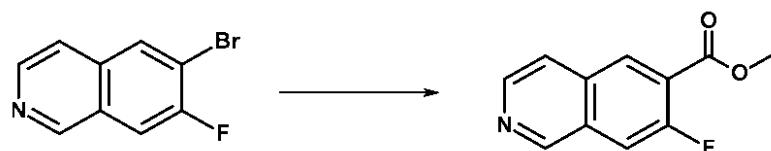
中間体3: 7-エチルスルファニルイソキノリン-6-カルボン酸の合成:

【化80】



工程A: メチル7-フルオロイソキノリン-6-カルボキシレート

【化81】



オートクレーブ中で6-ブロモ-7-フルオロイソキノリン(市販されているか、または国際公開第08077553号と同様に合成される、0.452mg)、ビス(トリフエニルホスフィン)パラジウムジクロリド(71.0mg)およびトリエチルアミン(404.8mg)をメタノール(40mL)に加えた。次に、オートクレーブの不活性雰囲気をCOで置き換え、容器中の圧力は20バールであった。オートクレーブを15時間にわたって80℃に加熱した。溶媒を蒸発させ、残渣を酢酸エチルに溶解させた。有機溶液を塩水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を*i*-ヘキサン/エチル2:1を用いたカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、所望の化合物(314mg、76.5%の收率)が得られた。¹H NMR(400MHz、CDCl₃) ppm 9.27(s, 1H); 8.60(d, 1H); 8.50(d, 1H); 7.73(d, 1H); 7.68(d, 1H); 4.02(s, t).

【0238】

工程B: メチル7-エチルスルファニルイソキノリン-6-カルボキシレート

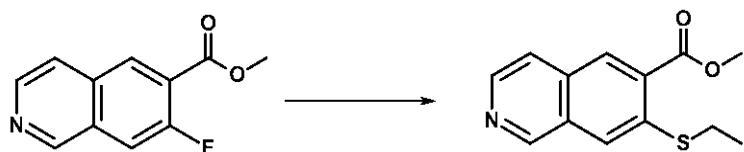
10

20

30

40

【化 8 2】

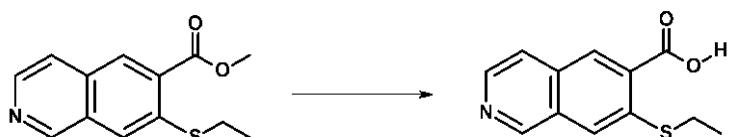


メチル 7 - フルオロイソキノリン - 6 - カルボキシレート (324.0 mg) と、ナトリウムエタンチオラート (162.5 mg) と、D M F (3 mL) との混合物を周囲温度で一晩攪拌した。溶媒をトルエンの添加後に蒸発させた。残渣を酢酸エチルに溶解させ、水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で蒸発させた。粗生成物を、ヘキサン / エチル 1 : 2 を用いたカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、所望の化合物 (235 mg, 60.1 % の収率) が得られた。¹H N M R (400 MHz, C D C l₃) p p m 9.21 (s , 1 H) ; 8.52 (d , 1 H) ; 8.42 (s , 1 H) ; 7.76 (s , 1 H) ; 7.64 (d , 1 H) ; 4.00 (s , t) ; 3.10 (q , 2 H) ; 1.46 (t , 3 H).

【0239】

工程 C : 7 - エチルスルファニルイソキノリン - 6 - カルボン酸

【化 8 3】



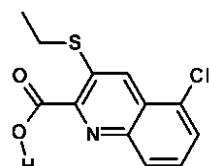
水 (2 mL) とメタノール (20 mL) との混合物中のメチル 7 - エチルスルファニルイソキノリン - 6 - カルボキシレート (1115.41 mg) の溶液に水酸化ナトリウム (225.5 mg) を周囲温度で加えた。溶液を周囲温度で一晩攪拌した。溶媒を蒸発させ、水の添加後、有機相を酢酸エチルで洗浄した。所望の生成物が沈殿するまで水層を希塩酸 (pH 4 ~ 5) で酸性化した。黄色の沈殿物をろ去し、減圧下で乾燥させ、さらに精製せずに次の工程に使用した。

¹H N M R (400 MHz, C D C l₃) p p m 9.69 (s , 1 H) ; 8.68 (d , 1 H) ; 8.61 (d , 1 H) ; 8.36 (2 d , 2 H) ; 3.13 (q , 2 H) ; 1.37 (t , 3 H).

【0240】

中間体 4 : 5 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸の合成

【化 8 4】



工程 A : メチル 3 - アミノ - 5 - クロロ - キノリン - 2 - カルボキシレート

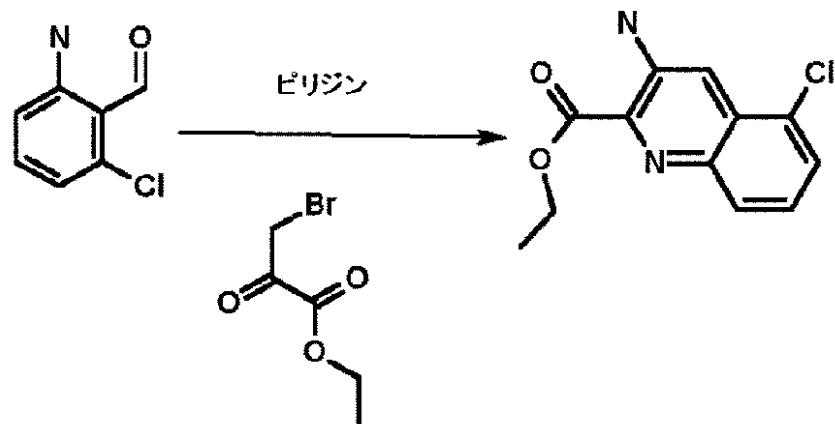
10

20

30

40

【化 8 5】



10

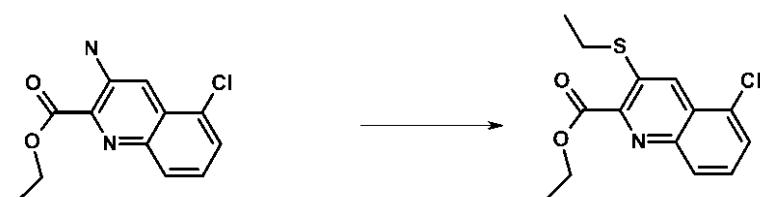
メチル 3 - アミノ - 5 - クロロ - キノリン - 2 - カルボキシレートを、中間体 7 (工程 A) について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した。¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 7.988 (dd, 1H) ; 7.725 (d, 1H) ; 7.546 (dd, 1H) ; 7.341 (dd, 1H) ; 5.752 (ブロードs, 2H) ; 4.556 (q, 2H) ; 1.534 (t, 3H).

【0241】

工程 B : メチル 5 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレート

20

【化 8 6】



エチル 5 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレートを、中間体 1 (工程 A) について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した：¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 8.441 (s, 1H) ; 8.073 (dd, 1H) ; 7.663 (d, 1H) ; 7.590 (dd, 1H) ; 4.562 (q, 2H) ; 3.101 (q, 2H) ; 1.493 (t, 3H) ; 1.450 (t, 3H).

30

【0242】

工程 C : 5 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸

【化 8 7】



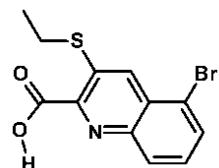
40

5 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸を、中間体 7 (工程 C) について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した：¹H NMR (300 MHz、DMSO) ppm 8.376 (s, 1H) ; 8.040 (d, 1H) ; 7.895 (dd, 1H) ; 7.753 (dd, 1H) ; 3.157 (q, 2H) ; 1.333 (t, 3H).

【0243】

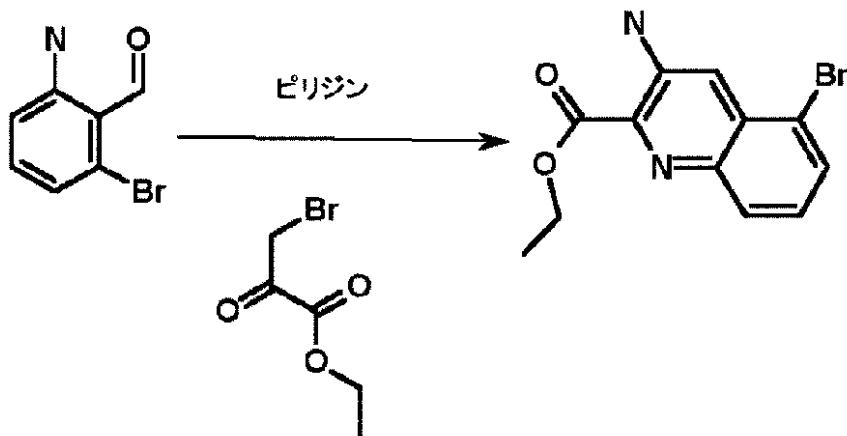
中間体 5 : 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸の合成

【化 8 8】



工程 A : エチル 3 - アミノ - 5 - ブロモ - キノリン - 2 - カルボキシレート

【化 8 9】



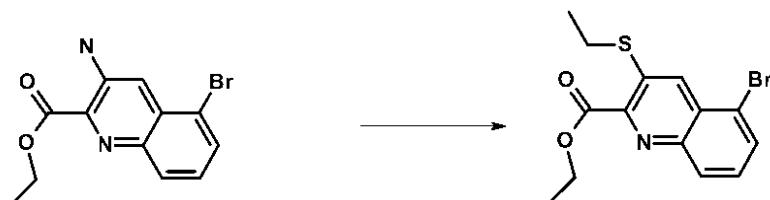
10

20

エチル 3 - アミノ - 5 - ブロモ - キノリン - 2 - カルボキシレートを、中間体 7 (工程 A)について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した。¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 8.03 (dd , 1 H) ; 7.75 (dd , 1 H) ; 7.70 (d , 1 H) ; 7.30 (dd , 1 H) ; 5.76 (s b , 2 H) ; 4.56 (q , 2 H) ; 1.511 (t , 3 H) .

【0244】

工程 B : エチル 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレート
【化 9 0】



30

エチル 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレートを、中間体 1 (工程 A)について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した : ¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 8.41 (s , 1 H) ; 8.12 (dd , 1 H) ; 7.88 (dd , 1 H) ; 7.53 (dd , 1 H) ; 4.56 (q , 2 H) ; 4.56 (q , 2 H) ; 1.51 (m , 6 H) .

【0245】

40

工程 C : 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸

【化 9 1】



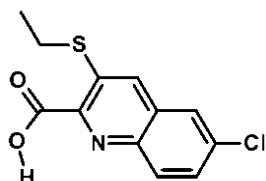
5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸を、中間体 7 (工程 C)について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した : ¹H NMR (300

50

MHz、DMSO) ppm 8.324 (s, 1H); 8.077 (d, 1H); 8.054 (d, 1H); 7.690 (dd, 1H); 3.146 (q, 2H); 1.347 (t, 3H).

【0246】

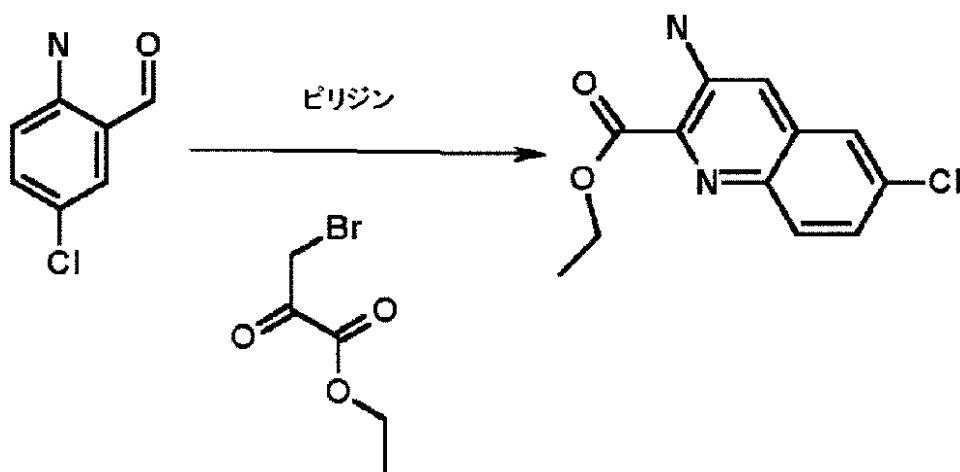
中間体6：6-クロロ-3-エチルスルファニル-キノリン-2-カルボン酸の合成
【化92】



10

工程A：エチル3-アミノ-6-クロロ-キノリン-2-カルボキシレート

【化93】

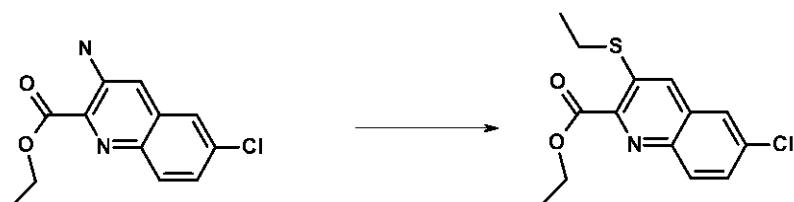


20

エチル3-アミノ-6-クロロ-キノリン-2-カルボキシレートを、中間体7（工程A）について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した。¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 7.98 (d, 1H); 7.54 (d, 1H); 7.35 (dd, 1H); 7.24 (s, 1H); 5.67 (sb, 2H)、4.54 (q, 2H); 1.50 (t, 3H).

【0247】

工程B：エチル6-クロロ-3-エチルスルファニル-キノリン-2-カルボキシレート
【化94】



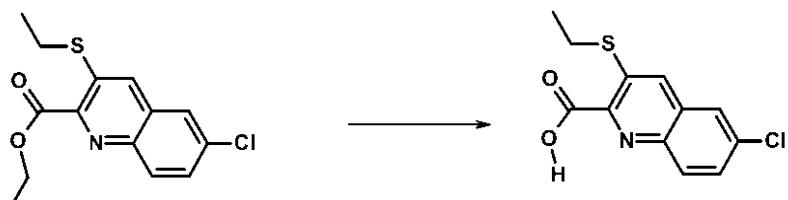
40

エチル6-クロロ-3-エチルスルファニル-キノリン-2-カルボキシレートを、中間体1（工程A）について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した：¹H NMR (300 MHz、DMSO) ppm 8.45 (s, 1H); 8.14 (d, 1H); 8.05 (d, 1H); 8.77 (dd, 1H); 4.42 (q, 2H); 3.11 (q, 2H); 1.384 - 1.276 (m, 6H).

【0248】

工程C：6-クロロ-3-エチルスルファニル-キノリン-2-カルボン酸

【化95】

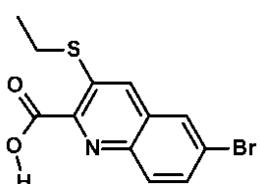


6 - クロロ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸を、中間体 7 (工程 C) について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成した: ¹H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 13.72 (ブロード s, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.13 (d, 1H); 8.04 (d, 1H); 7.75 (dd, 1H); 3.09 (q, 2H); 1.31 (t, 3H).

【0249】

中間体 7 : 6 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸の合成

【化96】

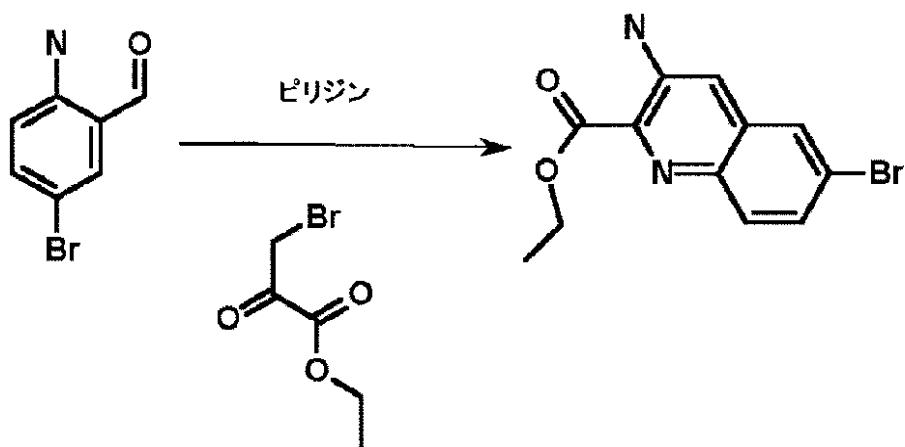


10

20

工程 A : エチル 3 - アミノ - 6 - ブロモ - キノリン - 2 - カルボキシレート

【化97】



30

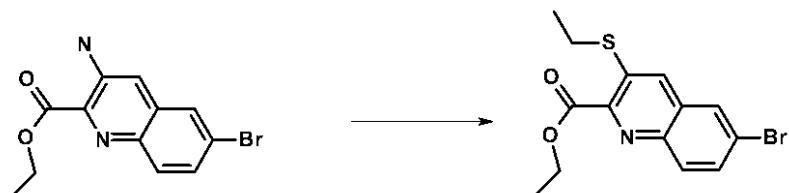
14.5 mL の EtOH 中のピリジン (415 mg, 0.40 mL, 5.25 mmol) の混合物に、EtOH (10 mL) 中のブロモピルビン酸エチル (1084 mg, 0.69 mL, 5 mmol) を 30 分間にわたって滴下してゆっくりと加えた。得られた混合物を 60 ~ 70 度で 1 時間加熱し、周囲温度に冷却した。5 - ブロモ - 2 - アミノベンズアルデヒド (990 mg, 4.95 mmol, 1 当量) およびピリジン (1 mL) を加え、5 時間にわたって還流状態で加熱した後、ピロリジン (838 mg, 1.0 mL, 11.78 mmol, 2.38 当量) を加えた。得られた混合物を還流状態でさらに 2 時間加熱した。反応混合物を濃縮し、残渣をクロマトグラフィー (酢酸エチル / ヘキサン 1 : 3) にかけたところ、所望の生成物 (719 mg, 49% の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 7.91 (d, 1H); 7.74 (d, 1H); 7.48 (dd, 1H); 7.25 (d, 1H); 5.67 (ブロード s, 2H); 4.55 (q, 2H); 1.53 (t, 3H).

40

【0250】

工程 B : エチル 6 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレート

【化98】

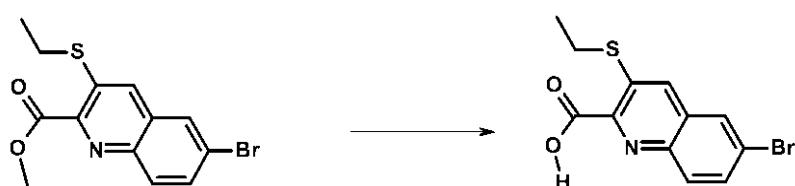


エチル 6 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレートを、中間体 1 (工程 A)について記載されるのと同様のプロトコルを用いて合成し、さらに精製せずに使用した：¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.01 (d, 1 H), 7.93 (d, 1 H), 7.73 (dd, 1 H), 4.55 (q, 2 H), 3.03 (q, 2 H); 1.39 - 1.51 (m, 6 H). 10

【0251】

工程 C : 6 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボン酸

【化99】



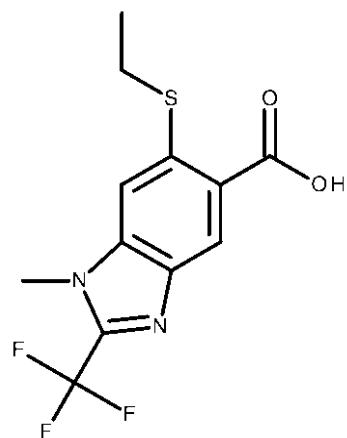
20

THF (6 ml) 中の化合物エチル 6 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - キノリン - 2 - カルボキシレート (351 mg, 1.03 mmol) の攪拌溶液に NaOH (1 M, 2.1 mL; 2.1 当量) の水溶液を加え、反応混合物を周囲温度で 4 時間攪拌した。反応の完了後、反応混合物を水 (15 mL) で希釈し、酢酸エチル (2 × 15 mL) で抽出した。次に、水相を 1 M の HCl 溶液によって pH = 4 になるまで酸性化し、酢酸エチル (3 × 20 mL) で抽出した。有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧で濃縮したところ、表題生成物 (310 mg, 96 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 13.75 (ブロード s, 1 H); 8.40 (s, 1 H); 8.29 (d, 1 H); 7.96 (d, 1 H); 7.86 (dd, 1 H); 3.09 (q, 2 H); 1.310 (t, 3 H). 30

【0252】

中間体 8 : 6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボン酸の合成

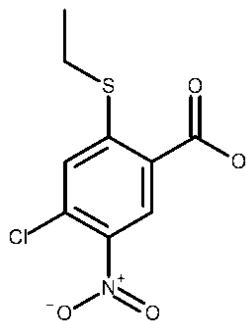
【化100】



40

工程 A : 4 - クロロ - 2 - エチルスルファニル - 5 - ニトロ - 安息香酸の合成

【化101】



10

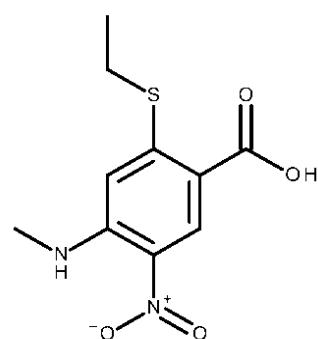
90 度 1 - メチル - 2 - ピロリドン (250 mL) 中の 4 - クロロ - 2 - フルオロ - 5 - ニトロ - 安息香酸 (20 g、 91.095 mmol) の溶液にナトリウム t - ブトキシド (9.6302 g、 100.20 mmol) を加えた。10 分後、エチルスルファニルナトリウム (9.366 g、 100.20 mmol) を加えた。反応物を 90 度 2 時間攪拌した。転化が完了し、2つの生成物が形成された。反応混合物を 1 リットルの水に注ぎ、pH を濃塩酸 (37 %) の添加によって酸性化したところ、沈殿物が形成された。固体のろ過により、2つの生成物の混合物が得られた。ろ液を静置させた。固体をエチルエーテル中で懸濁させ、ろ過した。固体 (純粋) が、ビス - エチルスルファニル生成物として同定された。ろ液を減圧下で濃縮したところ、4 - クロロ - 2 - エチルスルファニル - 5 - ニトロ - 安息香酸 (8.9 g、 34 mmol、 37 % の収率) が得られた。LC - MS (方法 A) : RT 1.00 (260, MH⁺) (262, MH⁺)

20

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 13.84 (s, 1 H) 8.52 (s, 1 H) ; 7.6 (s, 1 H) ; 3.09 (q, 2 H) ; 1.3 (t, 3 H).

【0253】

工程 B : 2 - エチルスルファニル - 4 - (メチルアミノ) - 5 - ニトロ - 安息香酸の合成
【化102】



30

テトラヒドロフラン (20 mL、 244 mmol) 中の 4 - クロロ - 2 - エチルスルファニル - 5 - ニトロ - 安息香酸 (8.9 g、 34 mmol) の溶液にテトラヒドロフラン (100 mL、 200 mmol) 中のメチルアミン (2 mol / L) をゆっくりと加えた。混合物を周囲温度で一晩攪拌した。わずかな転化が観察されたに過ぎなかった。懸濁液をオートクレーブに移し、30 mL のメチルアミン 2N を加え、反応物を 80 度 5 時間攪拌した。反応は完了せず、さらに 20 mL の 2N のメチルアミンを加え、次に、反応物を週末にわたってオートクレーブ中で攪拌した。反応が完了し、反応混合物を減圧下で濃縮した。固体を水に取り込み、水酸化ナトリウム 1N で塩基性化し、次に、酢酸エチルで抽出した。水相を濃塩酸 37 % で酸性化し、酢酸エチルで抽出した。全ての有機層を組み合わせて、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。次に、残渣をフラッシュクロマトグラフィーによって精製したところ、2 - エチルスルファニル - 4 - (メチルアミノ) - 5 - ニトロ - 安息香酸 (3.95 g、 15.4 mmol、 45 % の収率) が黄褐色の固体として得られた。LC - MS (方法 A) : RT 1.04 (257, MH⁺).

40

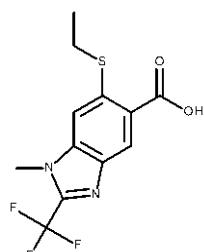
50

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 12.87 (s, 1H) 8.68 (s, 1H); 6.55 (s, 1H); 3.05 (s, 3H); 3.00 (q, 2H) 1.33 (t, 3H).

【0254】

工程C：6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - カルボン酸の合成

【化103】



10

0で2,2,2 - トリフルオロ酢酸(10 mL、129 mmol)中の2 - エチルスルファニル - 4 - (メチルアミノ) - 5 - ニトロ - 安息香酸(0.300 g、1.17 mol)の溶液に亜鉛(0.260 g、3.98 mmol)を加え、冷却浴を除去した。30分後、LC/MSによれば還元は完了し；わずかな環化した生成物が観察された。次に、褐色の溶液を70で加熱して、ジ - アミノ生成物を環化した。1時間後、LC/MSにより環化の完了が示された。反応混合物を半分になるまで濃縮し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を水および塩水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をフラッシュクロマトグラフィーによって精製したところ、6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - カルボン酸(0.14 g、0.46 mmol、39.3%の収率)が得られた。

20

LC - MS(方法A) : RT 1.06 (303, M⁺) (305, M⁺).

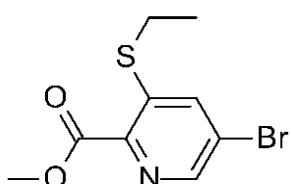
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 13.03 (s, 1H) 8.30 (s, 1H); 7.64 (s, 1H); 4.00 (s, 3H); 3.06 (q, 2H) 1.32 (t, 3H).

【0255】

30

中間体9：メチル5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレートの調製

【化104】



0で攪拌された、THF中のメチル5 - ブロモ - 3 - クロロ - ピリジン - 2 - カルボキシレート(0.100 g、0.399 mmol)(市販用の製品)の溶液にナトリウムエタノレート(0.034 g、0.399 mmol)を加えた。その温度で1時間後、氷浴を除去し、攪拌を20時間続けた。次に、反応混合物を水(15 mL)に注ぎ、EtOAcで2回抽出した。組み合わされた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、溶媒を減圧下で除去した。残渣をシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーにかけ、選択された画分を蒸発させたところ、メチル5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレートが無色の固体として得られた。

40

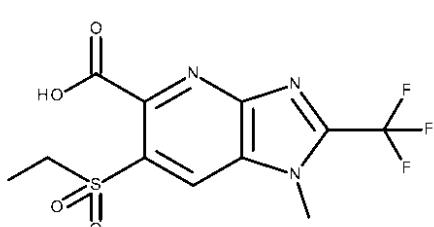
LCMS(方法1) : 276、278 (M + H) ; 保持時間 : 0.92 min.

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) ppm : 8.46 (s, 1H); 7.79 (s, 1H); 4.00 (s, 3H); 2.94 (q, 2H); 1.42 (t, 3H).

50

【0256】

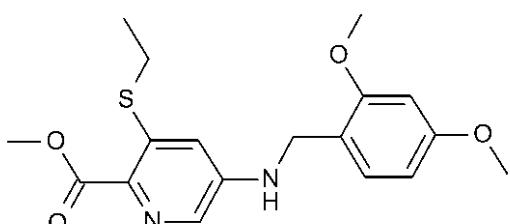
中間体 10 : 6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 5 - カルボン酸の合成
【化 105】



10

工程 A : メチル 5 - [(2 , 4 - ジメトキシフェニル) メチルアミノ] - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレートの合成

【化 106】



20

メチル 5 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート (中間体 9、5 . mmol 、 1380 . 75 mg) を乾燥トルエン (35 ml) に溶解させ、次に、炭酸セシウム (7 . 5 mmol) を加えた。混合物をアルゴンで脱気し、次に、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (0 . 11 mmol) 、 2 , 2 ' - ピス (ジフェニルホスフィノ) - 1 , 1 ' - ビナフチル (0 . 2 mmol) および 2 , 4 - ジメトキシベンジルアミン (5 mmol) を加えた。混合物を 105 (浴) でアルゴン下において攪拌した。混合物の暗紫色が、 15 分以内に淡黄色に変化した。 20 時間後、反応物を冷却し、溶媒を減圧下で除去した。残渣を 50 g のシリカゲル上で溶離剤ヘキサン中 50 % の酢酸エチル、次に、酢酸エチルで精製した。

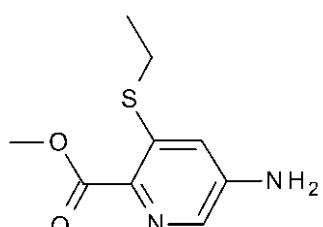
30

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 7 . 84 (d , 1 H) ; 7 . 15 (d , 1 H) ; 6 . 68 (d , 1 H) ; 6 . 49 - 6 . 42 (m , 2 H) ; 4 . 63 (t , 1 H) ; 4 . 32 (d , 2 H) ; 3 . 93 (s , 3 H) ; 3 . 84 (s , 3 H) ; 3 . 80 (s , 3 H) ; 2 . 83 (q , 2 H) ; 1 . 36 (t , 3 H) .

【0257】

工程 B : メチル 5 - アミノ - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレートの合成

【化 107】



40

メチル 5 - [(2 , 4 - ジメトキシフェニル) メチルアミノ] - 3 - エチルスルファニル - ピリジン - 2 - カルボキシレート (3 . 31 mmol 、 1 . 2 g) を周囲温度でジクロロメタン (20 ml) に溶解させ、次に、トリフルオロ酢酸 (3 . 31 mmol) を加えた。赤橙色の溶液を周囲温度で 5 時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去した。残渣を NaHCO₃ の飽和溶液でアルカリ化し、酢酸エチルで抽出した。有機相を分離し、乾

50

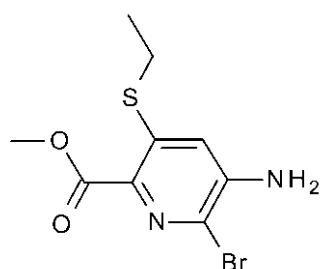
燥させ、濃縮した。残渣を 50 g のシリカゲル上で溶離剤酢酸エチルで精製したところ、薄いオレンジ色の固体が得られた。(530 mg、75%)

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 7.88 (d, 1H); 6.8 (d, 1H); 4.2 (s, 2H); 3.9 (s, 3H); 2.83 (q, 2H); 1.36 (t, 3H).

【0258】

工程C：メチル5-アミノ-6-ブロモ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレートの合成

【化108】



10

メチル5-アミノ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレート(0.93 mmol)を氷酢酸(10 ml)に溶解させ、次に、無水酢酸ナトリウム(1.22 mmol)を加えた。次に、臭素(0.93 mmol)を周囲温度で滴下して加えた。オレンジ色の混合物を周囲温度で2時間攪拌した。TLCにより、さらなる出発材料が示されなかった。揮発性物質を減圧下で除去し、残渣を酢酸エチルに溶解させた。有機相を炭酸水素ナトリウム溶液、続いてチオ硫酸ナトリウム溶液、最後に水で洗浄した。有機相を乾燥させ、濃縮した。残渣を25 g のシリカゲル上で溶離剤ヘキサン中50%の酢酸エチルで精製したところ、白色の固体(250 mg、92%)が得られた。

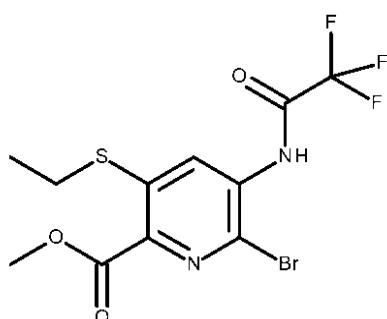
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 6.83 (d, 1H); 4.57 (s, 2H); 3.93 (s, 3H); 2.85 (q, 2H); 1.39 (t, 3H).

【0259】

工程D：メチル6-ブロモ-3-エチルスルファニル-5-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]ピリジン-2-カルボキシレートの合成

20

【化109】



30

メチル5-アミノ-6-ブロモ-3-エチルスルファニル-ピリジン-2-カルボキシレート(0.82 mmol)をアルゴン下において周囲温度で乾燥テトラヒドロフラン(10 ml)に溶解させ、次に、炭酸ナトリウムを加えた後、無水トリフルオロ酢酸(0.82 mmol)を加えた。懸濁液を周囲温度で16時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去し、残渣を酢酸エチルに溶解させた。溶液を水で洗浄し；有機相を乾燥させ、濃縮した。残渣を40 g のシリカゲル上で溶離剤ヘキサン/酢酸エチル(2:1)で精製したところ、白色の固体が得られた。

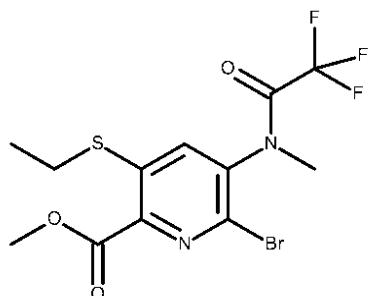
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.76 (s, 1H); 8.60 (s, 1H); 3.99 (s, 3H); 3.00 (q, 2H); 1.42 (t, 3H).

【0260】

40

50

工程 E : メチル 6 - プロモ - 3 - エチルスルファニル - 5 - [メチル - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) アミノ] ピリジン - 2 - カルボキシレートの合成
【化 110】



10

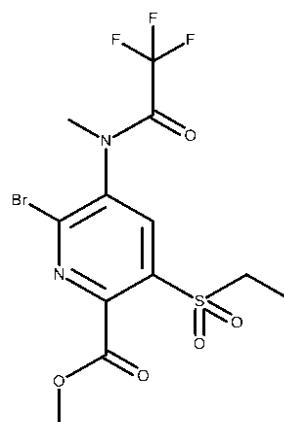
メチル 6 - プロモ - 3 - エチルスルファニル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) アミノ] ピリジン - 2 - カルボキシレート (0 . 3 m m o l , 1 1 6 m g) をアルゴン下において周囲温度で N , N - ジメチルホルムアミド (1 . 2 m l) に溶解させた。次に、炭酸カリウム (0 . 7 2 m m o l) を加えた後、ヨウ化メチル (0 . 3 m m o l) を加えた。混合物を周囲温度で 4 0 時間攪拌し、次に、水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機相を水で洗浄し、乾燥させ、濃縮した。残渣を 1 5 g のシリカゲル上で溶離剤ジクロロメタンで精製したところ、白色の固体が得られた。

¹H NMR (3 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m 7 . 5 6 (s , 1 H) ; 4 . 0 0 (s , 3 H) ; 3 . 3 5 (s , 3 H) 2 . 9 2 (q , 2 H) ; 1 . 4 2 (t , 3 H) . 20

【0261】

工程 F : メチル 6 - プロモ - 3 - エチルスルホニル - 5 - [メチル - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) アミノ] ピリジン - 2 - カルボキシレートの合成

【化 111】



30

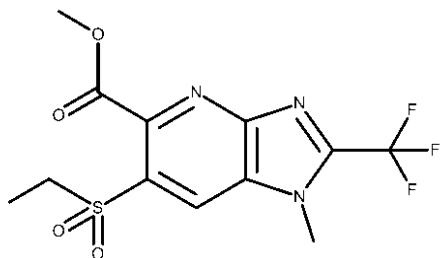
ジクロロメタン (7 m L) 中のメチル 6 - プロモ - 3 - エチルスルファニル - 5 - [メチル - (2 , 2 , 2 - トリフルオロアセチル) アミノ] ピリジン - 2 - カルボキシレート (2 0 0 m g) の溶液にメタ - クロロ過安息香酸 (2 5 3 m g) を加えた。黄色の溶液を周囲温度で 1 時間攪拌した。この後、反応混合物をチオ硫酸ナトリウム水溶液で希釈し、ジクロロメタンで抽出し、組み合わされた有機画分を炭酸ナトリウムで洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル、溶離剤ヘキサン中 50 % の酢酸エチルを用いて精製したところ、無色の樹脂が得られた。

¹H NMR (3 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m 8 . 2 4 (d , 1 H) ; 4 . 0 6 (s , 3 H) ; 3 . 7 0 (q , 2 H) ; 3 . 5 (s , 3 H) ; 1 . 3 5 (t , 3 H) . 40

【0262】

工程 G : メチル 6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 5 - カルボキシレートの合成

【化112】



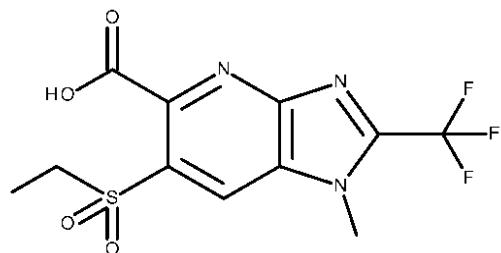
アルゴン下でDMSO(8ml)中のメチル6-プロモ-3-エチルスルホニル-5-
[メチル-(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]ピリジン-2-カルボキシレ
ート(160mg、0.37mmol)の溶液に三塗化ナトリウム(52mg、0.77
mmol)、続いてヨウ化銅(75mg、0.38mmol)を加えた。攪拌された混合
物をアルゴンで脱気し、次に、N,N'-ジメチルエチレンジアミン(57.4mg、0
.65mmol)を加えた。混合物を120度で53分間加熱しながら激しく攪拌した。
冷却された混合物を塩化アンモニウムの飽和溶液(25ml)および25mlの酢酸エチ
ルとともに30分間さらに攪拌した。次に、混合物を酢酸エチル(100ml)で希釈した。
有機相を塩水で洗浄した。有機相を乾燥させ、濃縮し、残渣を10gのシリカゲル上
で溶離剤ヘキサン中50%の酢酸エチルで精製したところ、無色の樹脂(20mg、15
.4%)が得られた。

¹H NMR(300MHz、CDCl₃) ppm 8.56(s, 1H); 4.11(s,
3H); 4.06(s, 3H); 3.65(q, 2H); 1.37(t, 3H).

【0263】

工程H：6-エチルスルホニル-1-メチル-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4
,5-b]ピリジン-5-カルボン酸の合成

【化113】



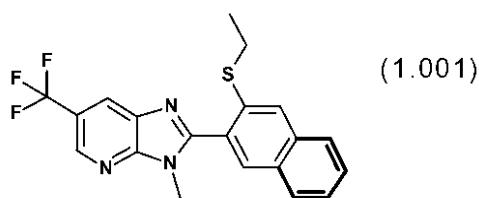
周囲温度でテトラヒドロフラン(10ml)中のメチル6-エチルスルホニル-1-メ
チル-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン-5-カルボキシレ
ートの溶液に水酸化リチウム(26.46mg、0.63mmol)、続いて水(4ml)
を加えた。混合物を周囲温度で一晩攪拌した。反応物の発生後、TLCを行い、出発材
料の完全な転化後、溶媒を蒸発させ、残渣を30mlの水に溶解させた。溶液を、1Mの
塩酸を用いてpH=3になるまで酸性化した。酸を3×50mlの酢酸エチルで抽出した
。収集された抽出物を乾燥させ、蒸発乾固させたところ、淡色の固体が得られた。

¹H NMR(300MHz、アセトン) ppm 8.86(s, 1H); 4.31(s,
3H); 3.63(q, 2H); 1.29(t, 3H).

【0264】

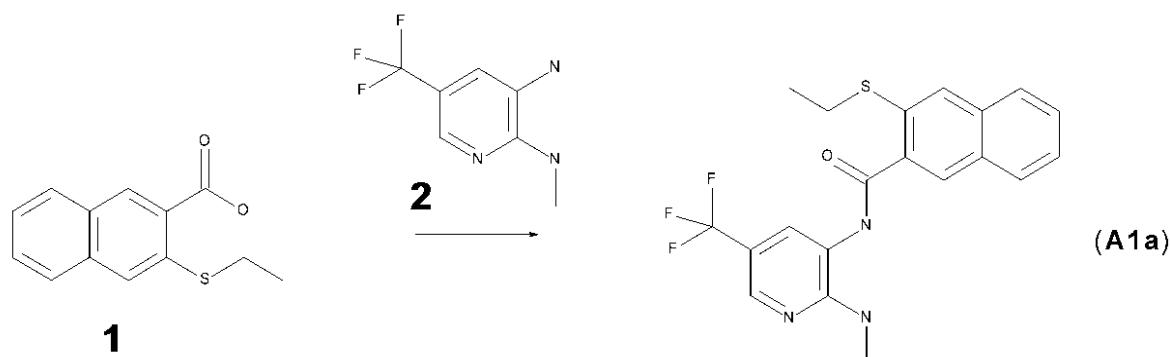
実施例P1：2-(3-エチルスルファニル-2-ナフチル)-3-メチル-6-(トリ
フルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン(A1、1.001)の調製：

【化114】



工程 A : 3 - エチルスルファニル - N - [2 - (メチルアミノ) - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] ナフタレン - 2 - カルボキサミド A 1 a の調製 : 10

【化115】



ピリジン (7 m l) 中の化合物 1 (0 . 5 4 g、 2 . 9 6 m m o l) の攪拌溶液に E D C I . H C l (0 . 6 8 g、 3 . 5 6 m m o l) を加えた後、化合物 2 (0 . 6 8 g、 3 . 5 6 m m o l) を加えた。全反応混合物を 1 2 0 ℃ で 8 時間攪拌した。反応を T L C によって監視した。出発アミンの完了後、反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチル (2 5 × 2 m L) で抽出した。組み合わされた有機層を水、塩水で洗浄し、 N a 2 S O 4 上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、ヘキサン - 酢酸エチルを用いたカラムクロマトグラフィー (1 0 0 ~ 2 0 0 シリカゲル) によって精製したところ、所望の化合物が白色の固体 (量 : 3 6 0 m g ; 収率 = 4 1 %) として得られた。¹ H N M R (4 0 0 M H z、 D M S O - d₆) : (p p m) 9 . 8 7 (s , 1 H) 、 8 . 2 9 (s , 2 H) 、 7 . 9 6 (m , 4 H) 、 7 . 5 9 (m , 2 H) 、 6 . 8 7 (s , 1 H) 、 3 . 0 8 (q , 2 H) 、 2 . 8 5 (s , 3 H) 、 1 . 2 9 (t , 3 H) . 30

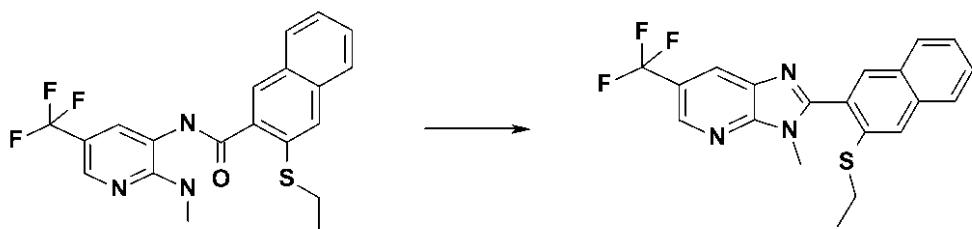
【0265】

化合物 A 4 a 3 - エチルスルファニル - N - [2 - (メチルアミノ) - 5 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] キノリン - 2 - カルボキサミド) を、出発材料として 3 - エチルスルファニルキノリン - 2 - カルボン酸を用いて同じ方法によって調製した。¹ H N M R (4 0 0 M H z、 C D C l₃) : (p p m) 9 . 8 3 (s , 1 H) 、 8 . 3 5 (s , 1 H) 、 8 . 0 5 (m , 2 H) 、 7 . 9 2 (s , 1 H) 、 7 . 7 9 (d , 1 H) 、 7 . 7 0 (m , 1 H) 、 7 . 6 3 (m , 1 H) 、 5 . 1 6 (s , 1 H) 、 3 . 0 9 - 3 . 0 2 (m , 5 H) 、 1 . 4 7 (t , 3 H) . 40

【0266】

工程 B : 2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ナフチル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン (A 1 、 1 . 0 0 1) の調製 :

【化116】



キシレン(5ml)中の化合物A1a(360mg、0.88mmol)の搅拌溶液にトス酸(506mg、2.67mmol)を加え、全反応混合物を16時間にわたって150℃に加熱した。反応をTLCによって監視した。出発材料の完了後、反応混合物を酢酸エチルで希釈し、水(2×10mL)で洗浄した。有機層をNa₂SO₄上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、ヘキサン-酢酸エチルを用いたカラムクロマトグラフィー(100~200シリカゲル)によって精製したところ、所望の化合物が白色の固体(量：243mg；収率=71%)として得られた。¹H NMR(400MHz、CDCl₃)：(ppm) 8.72(s, 1H)、8.34(s, 1H)、7.97(s, 1H)、7.89(s, 1H)、7.85(m, 2H)、7.60(m, 1H)、7.52(m, 1H)、3.78(s, 3H)、2.92(q, 2H)、1.26(t, 3H).

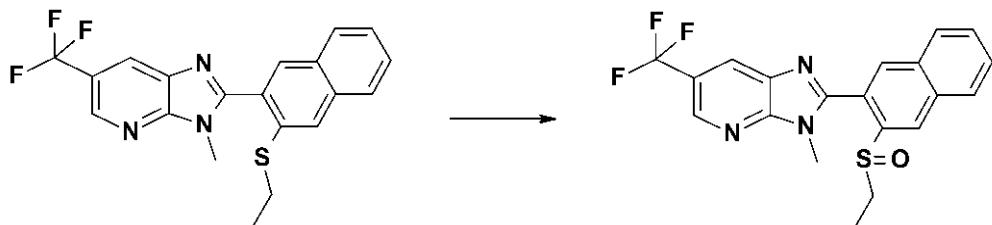
【0267】

表Aからの化合物A4(1.004)を、出発材料としてA4a(工程A)を用いて同じ方法によって調製した。¹H NMR(400MHz、CDCl₃)：(ppm) 8.75(s, 1H)、8.41(s, 1H)、8.13-8.09(m, 2H)、7.83(d, 1H)、7.72(m, 1H)、7.62(m, 1H)、4.08(s, 3H)、3.05(q, 2H)、1.38(t, 3H).

【0268】

実施例P2：2-(3-エチルスルフィニル-2-ナフチル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジン(A2、1.002)の調製：

【化117】



CH₂Cl₂(2ml)中の化合物A1(90mg、0.23mmol)の搅拌溶液にm-CPBA(44mg、0.25mmol)を室温で加えた。次に、反応混合物を2時間搅拌した。反応をTLCによって監視した。出発材料の完了後、反応混合物を飽和Na₂S₂O₃、NaHCO₃でクエンチし、CH₂Cl₂(10×2mL)で抽出した。CH₂Cl₂層をNa₂SO₄上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、粗生成物をペンタンで研和したところ、所望の化合物が白色の固体(量：71mg；収率=76%)として得られた。¹H NMR(400MHz、CDCl₃)：(ppm) 8.80(s, 1H)、8.70(s, 1H)、8.32(s, 1H)、8.11-8.08(m, 2H)、7.99(m, 1H)、7.71(m, 2H)、3.92(s, 3H)、3.37(m, 1H)、2.91(m, 1H)、1.27(t, 3H).

【0269】

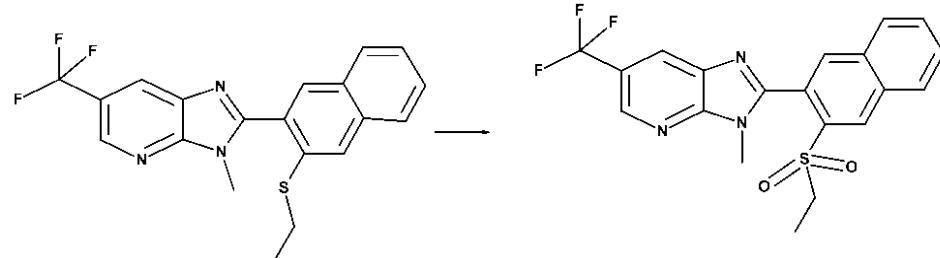
表Aからの化合物A5(1.005)を、出発材料としてA4(1.004)を用いて同じ方法によって調製した。¹H NMR(400MHz、CDCl₃)：(ppm) 9.11(s, 1H)、8.78(s, 1H)、8.37(s, 1H)、8.25(d, 1H)、8.07(d, 1H)、7.90(m, 1H)、7.74(m, 1H)、4.5(50

s, 3 H)、3.73 (m, 1 H)、3.07 (m, 1 H)、1.47 (t, 3 H).

【0270】

実施例 P3 : 2 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ナフチル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン (A3, 1.003) の調製 :

【化118】



10

CH_2Cl_2 (3 ml) 中の化合物 A1 (90 mg, 0.23 mmol) の攪拌溶液に m - C P B A (158 mg, 0.92 mmol) を周囲温度で加えた。次に、反応混合物を 2 時間攪拌した。反応を T L C によって監視した。出発材料の完了後、反応混合物を飽和 $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ および NaHCO_3 でクエンチし、 CH_2Cl_2 (20 × 2 ml) で抽出した。 CH_2Cl_2 層を Na_2SO_4 上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、粗生成物をペンタンで研和したところ、所望の化合物が白色の固体 (量: 80 mg; 収率 = 82%) として得られた。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : (ppm) 8.75 (m, 2 H)、8.29 (s, 1 H)、8.14 (m, 1 H)、8.03 (s, 1 H)、7.98 (m, 1 H)、7.79 (m, 2 H)、3.74 (s, 3 H)、3.45 (q, 2 H)、1.26 (t, 3 H).

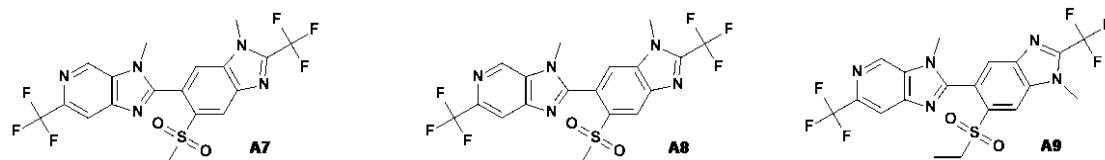
【0271】

さらに、表 A からの化合物 A6 (1.006) を、出発材料として A4 (1.004) を用いて同じ方法によって調製した。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) : (ppm) 9.08 (s, 1 H)、8.77 (s, 1 H)、8.32 (s, 1 H)、8.25 (d, 1 H)、8.13 (d, 1 H)、8.02 (t, 1 H)、7.84 (t, 1 H)、3.93 (s, 3 H)、3.87 (q, 2 H)、1.39 (t, 3 H).

【0272】

実施例 P4 : 2 - [6 - エチルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A7、2 - [6 - エチルスルホニル - 3 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A8 および 2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A9 の調製 :

【化119】

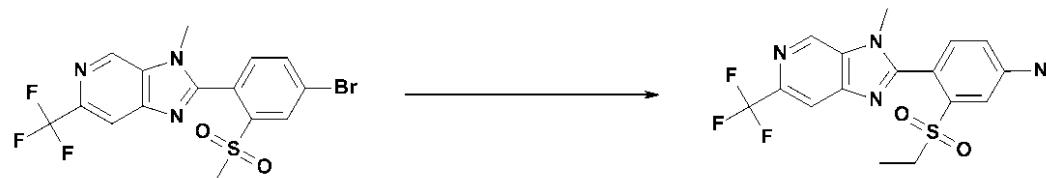


30

工程 A : 3 - エチルスルホニル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリンの調製

40

【化120】



ジメチルスルホキシド（12 mL）中の2 - (4 - ブロモ - 2 - エチルスルホニル - フエニル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン(国際公開第2015 / 000715号に記載されるように調製される、471.71 mg)の攪拌溶液にヨウ化銅 (220.0 mg) およびアジ化ナトリウム (140 mg) を加えた。攪拌された混合物をアルゴンで脱気し、次に、D M E D A (ジメチルエチレンジアミン、164 mg) を加えた。混合物を110 °C で55分間加熱し、次に、冷却し、30分間にわたって塩化アンモニウムの飽和溶液とともに攪拌した。次に、混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。組み合わされた有機相を水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチルで溶離しながら、シリカゲル (60 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、表題化合物 (49 % の収率) が得られた：¹H NMR (300 MHz、アセトン-D₆) ppm 9.14 (s, 1H) ; 8.44 (d, 1H) ; 8.10 (d, 1H) ; 7.73 (d, 1H) ; 6.01 (br s, 2H) ; 3.93 (s, 3H) ; 3.79 (q, 2H) ; 1.27 (t, 3H) .

【0273】

工程B：5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリンの調製：

【化121】

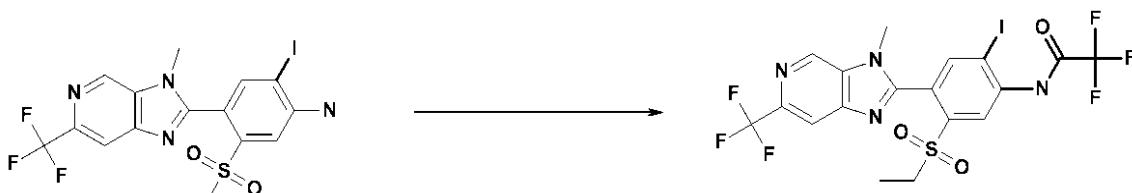


酢酸 (3 mL) 中の3 - エチルスルホニル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリン (99.94 mg) の攪拌溶液にN I S (61.42 mg) を加えた。溶液を周囲温度で一晩攪拌した。次に、溶媒を減圧下で除去した。残渣を酢酸エチルに溶解させ、Na₂CO₃溶液、続いて水で洗浄した。有機相を乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチル : ヘキサン (1 : 1) で溶離しながら、シリカゲル (15 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、表題化合物 (90.5 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 8.91 (s, 1H) ; 8.06 (s, 1H) ; 7.79 (s, 1H) ; 7.43 (s, 1H) ; 4.79 (bs, 2H) ; 3.76 (s, 3H) ; 3.32 (q, 2H) ; 1.24 (t, 3H) .

【0274】

工程C：N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセトアミドの調製：

【化122】



10

20

30

40

50

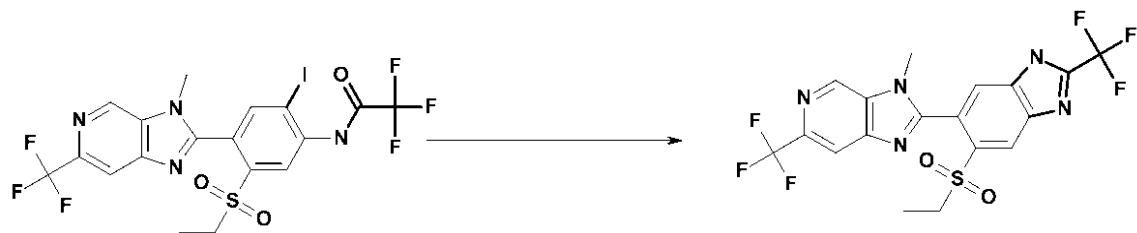
乾燥 THF (15 mL) 中の 5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリン (387.8 mg) の攪拌溶液に Na₂CO₃ (128.1 mg) および無水トリフルオロ酢酸 (0.27 mL) を加えた。透明な無色溶液を周囲温度で 24 時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去した。残渣を Na₂CO₃ の飽和溶液で処理し、次に、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機相を水で洗浄し、乾燥させ、濃縮したところ、白色の固体が得られた。化合物をさらに精製せずに次の工程に使用した。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 9.00 (s, 1H); 8.95 (s, 1H); 8.55 (bs, 1H); 8.09 - 8.07 (m, 2H); 3.78 (s, 3H); 3.26 (q, 2H); 1.27 (t, 3H).

10

【0275】

工程 D : 2 - [6 - エチルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) - 3H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A 7 の調製 :

【化123】



20

ジメチルスルホキシド (10 mL) 中の N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセトアミド (260.7 mg) の攪拌溶液にヨウ化銅 (90 mg) およびアジ化ナトリウム (60.0 mg) を加えた。攪拌された混合物をアルゴンで脱気し、次に、DMEA (ジメチルエチレンジアミン、65.6 mg) を加えた。混合物を 110 °C で 55 分間加熱し、次に、冷却し、30 分間にわたって塩化アンモニウムの飽和溶液とともに攪拌した。次に、混合物を酢酸エチルで繰り返し抽出した。組み合わされた有機相を水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチルで溶離しながら、シリカゲル (60 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、表題化合物 (78% の収率) が得られた：¹H NMR (300 MHz, Acetone-d₆) ppm 9.16 (s, 1H); 8.59 (s, 1H); 8.26 (s, 1H); 8.13 (s, 1H); 8.01 (s, 1H); 3.86 (s, 3H); 3.54 (m, 2H); 1.20 (t, 3H).

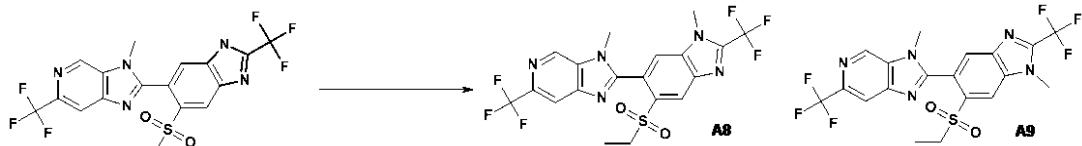
30

【0276】

工程 E : 2 - [6 - エチルスルホニル - 3 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A 8 および 2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A 9 の調製 :

40

【化124】



アセトン (20 mL) 中の 2 - [6 - エチルスルホニル - 2 - (トリフルオロメチル) - 3H - ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A 7 (157.5 mg) の攪拌溶液に K₂CO₃ (138

50

m g) およびヨードメタン (0 . 0 6 m L) を加えた。混合物を周囲温度で 1 7 時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去した。次に、残渣を酢酸エチルに溶解させ、水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチル : ヘキサン (1 : 1) で溶離しながら、シリカゲル (6 0 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、2 - [6 - エチルスルホニル - 3 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 8 (4 3 % の収率) および 2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 9 (4 0 % の収率) が得られた。

10

【 0 2 7 7 】

2 - [6 - エチルスルホニル - 3 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 9 : ¹H NMR (6 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m 1 . 2 8 (t , 3 H) 3 . 5 1 (b r s , 2 H) 3 . 7 4 (s , 3 H) 4 . 1 7 (s , 3 H) 8 . 0 5 (s , 1 H) 8 . 1 2 (s , 1 H) 8 . 4 4 (s , 1 H) 8 . 9 7 (s , 1 H) .

【 0 2 7 8 】

2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 8 : ¹H NMR (6 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m 1 . 2 2 (t , 3 H) 3 . 0 8 - 3 . 5 7 (m , 2 H) 3 . 7 7 (s , 3 H) 4 . 0 6 (s , 3 H) 7 . 6 9 (s , 1 H) 8 . 1 2 (s , 1 H) 8 . 7 9 (s , 1 H) 8 . 9 7 (s , 1 H) .

20

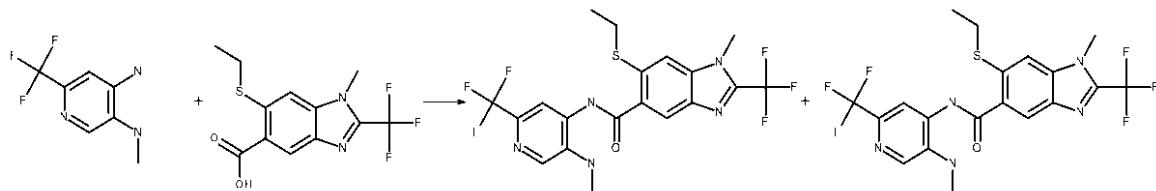
【 0 2 7 9 】

実施例 P 4 b : 2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 9 の代替的な調製

工程 A : 6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキサミドおよび 6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキサミドの調製

30

【 化 1 2 5 】



ジクロロメタン (5 m l) 中の 6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボン酸 (1 3 8 m g 、既に調製された) の懸濁液に 1 滴の N , N - ジメチルホルムアミド、続いて塩化オキサリル (1 . 8 当量、 0 . 1 0 3 m L) を加えた。ガス発生の終了後、反応混合物は、淡黄色溶液の形態であった。それを 6 0 ° の浴温度で減圧下において蒸発させた。残渣は、5 - プロモ - 5 - プロモ - 3 - エチルスルファニル - ベンゾチオフェン - 2 - カルボン酸塩化物の暗赤色の結晶になり、残渣を 6 m l のテトラヒドロフランに再度溶解させた。酢酸エチル (5 m l) 中の N 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 , 4 - ジアミン (8 5 m g 、市販の C A S 1 6 4 3 1 3 9 - 9 1 - 6) の溶液に N , N - ジエチルエタンアミン (2 . 5 当量、 0 . 1 5 7 m L) を加え、次に、得られた溶液を氷浴で冷却してから、前の塩化アシル溶液をゆっくりと加えた。得られた混合物を周囲温度で 1 時間攪拌した。溶液を炭酸水素ナトリウムの飽和水溶液の添加によって中和し、生成物を酢酸エチルで 2 回抽出した

40

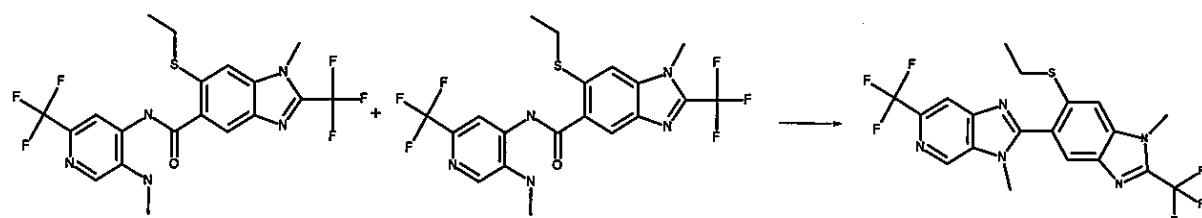
50

。有機溶液を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で蒸発させたところ、粗生成物が得られた。6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキサミドと、6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキサミドとの混合物が、酢酸エチル / シクロヘキサンで溶離しながらのシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィー後に得られ、それをさらに精製せずに使用した。L C - M S (方法 A) : R T 0 . 9 5 (4 7 6 , M H +) (4 7 8 , M H +) .

【 0 2 8 0 】

工程 B : 2 - [6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 3 9 の調製 :

【 化 1 2 6 】



酢酸 (3 . 2 m l) 中の 6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキサミドと、6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - N - [5 - (メチルアミノ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 4 - ピリジル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - カルボキサミド (0 . 1 6 g) との混合物をマイクロ波中で 1 時間にわたって 1 5 0 に加熱した。反応を T L C によって監視した。出発材料の完了後、反応混合物を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄した。有機層をチオ硫酸ナトリウム上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、シクロヘキサン - 酢酸エチルを用いたカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、2 - [6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジンが黄色の固体 (9 6 m g ; 収率 = 6 2 %) として得られた。

¹ H N M R (4 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m 1 . 2 2 (t , 3 H) 2 . 8 6 (q , 2 H) 3 . 7 6 (s , 3 H) 4 . 0 3 (s , 3 H) 7 . 6 0 (s , 1 H) 7 . 9 8 (s , 1 H) 8 . 1 6 (s , 1 H) 8 . 9 4 (s , 1 H)

L C - M S (方法 A) : R T 1 . 0 4 (4 6 1 , M H +) .

【 0 2 8 1 】

工程 C : 2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 9 の調製

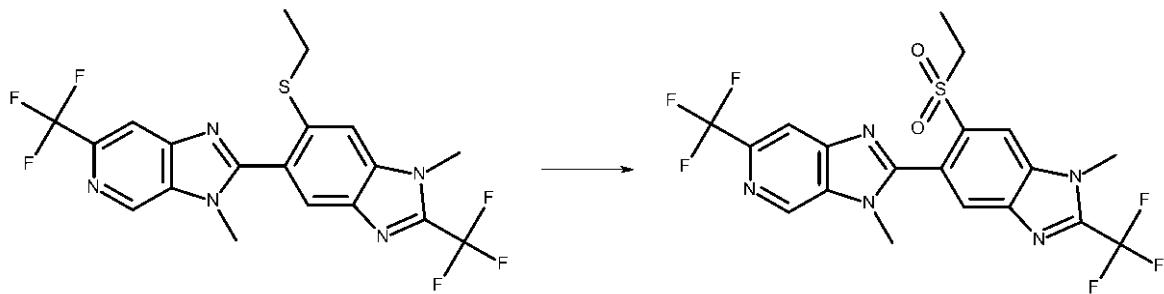
10

20

30

40

【化127】



10

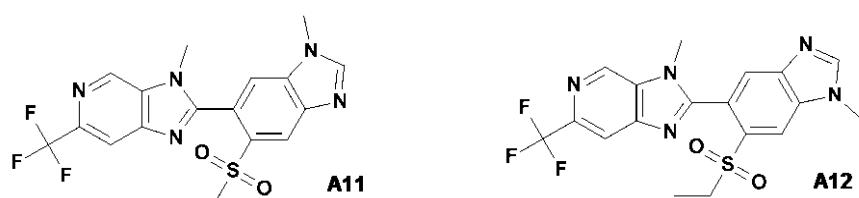
CH_2Cl_2 (10 ml) 中の 2 - [6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 39 (90 mg) の攪拌溶液に 3 - クロロペルオキシ安息香酸 (2.05 当量、92 mg) を周囲温度で加えた。次に、反応混合物を 1 時間攪拌した。反応を TLC によって監視した。出発材料の完了後、反応混合物を飽和チオ硫酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウムでクエンチし、ジクロロメタンで (2 回) 抽出した。有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥させた。ろ過し、濃縮し、粗生成物を、シクロヘキサン - 酢酸エチルを用いたカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、所望の化合物が白色の固体 (97 mg; 収率 = 100%) として得られた。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) ppm 1.28 (t, 3 H) 3.51 (br s, 2 H) 3.74 (s, 3 H) 4.17 (s, 3 H) 8.05 (s, 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.44 (s, 1 H) 8.97 (s, 1 H). LC-MS (方法 A): RT 0.97 (492, MH^+).

【0282】

実施例 P 5 : 2 - (6 - エチルスルホニル - 3 - メチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 11 および 2 - (6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 12 の調製 :

【化128】



30

工程 A : N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] ホルムアミドの調製。

【化129】



40

乾燥ギ酸 (5.89 mL) 中の 5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリン (199 mg) の攪拌溶液を 17 時間にわたって還流させた。次に、溶媒を減圧下で除去し、残渣を酢酸エチルに溶解させ、 Na_2CO_3 の溶液で洗浄した。有機相を分離し、水で洗浄し、乾燥させた。溶媒の蒸発により、固体 (86% の収率) が得られ、それをさらに精

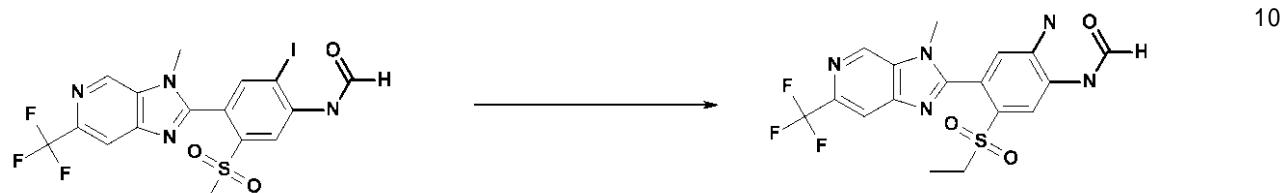
50

製せずに次の工程に使用した。¹H NMR (300 MHz、アセトン-D₆) ppm 9.25 (bs, 1H) ; 9.15 (s, 1H) ; 9.10 (s, 1H) ; 8.70 (bs, 1H) ; 8.40 (s, 1H) ; 8.12 (s, 1H) ; 3.89 (s, 3H) ; 3.49 (q, 2H) ; 1.22 (t, 3H) .

【0283】

工程B：N-[2-アミノ-5-エチルスルホニル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]ホルムアミドの調製：

【化130】

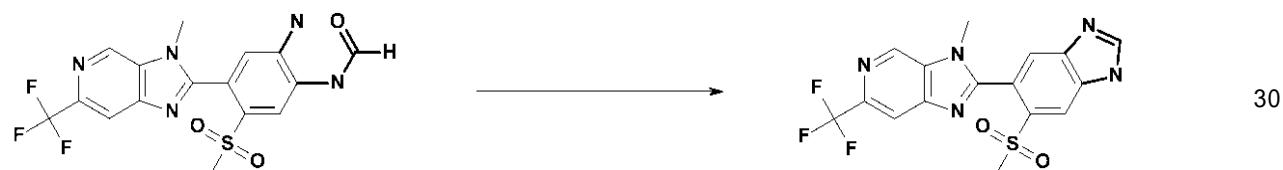


実施例P4、工程Dに記載されるのと同様のプロトコルを使用したが、環化された化合物は得られなかった(50%の収率)。N-[2-アミノ-5-エチルスルホニル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]ホルムアミド。化合物をさらに精製せずに次の工程に使用した。¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 8.93 (s, 1H) ; 8.45 (s, 1H) ; 8.08 (s, 1H) ; 7.92 - 7.86 (m, 1H) ; 7.68 (bs, 1H) ; 6.86 (s, 1H) ; 4.74 (bs, 2H) ; 3.77 (s, 3H) ; 3.27 (q, 2H) ; 1.23 (t, 3H) .

【0284】

工程C：2-(6-エチルスルホニル-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジンA10：

【化131】

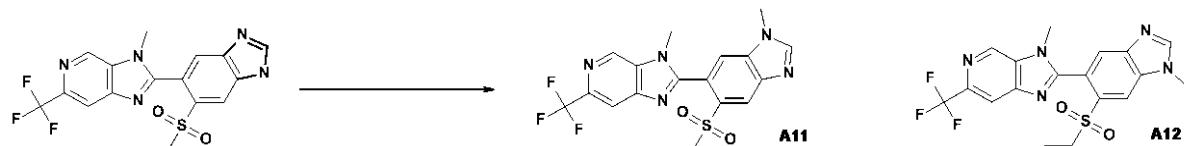


酢酸(5 mL)中のN-[2-アミノ-5-エチルスルホニル-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]ホルムアミド(59.84 mg)の攪拌溶液を17時間にわたって還流させた。次に、溶媒を減圧下で除去した。残渣を酢酸エチルに溶解させ、Na₂CO₃の過剰な飽和溶液で洗浄した。有機相を分離し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチル：メタノール(9:1)で溶離しながら、シリカゲル(15 g)上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、2-(6-エチルスルホニル-1H-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジンA10が得られた。¹H NMR (300 MHz、アセトン-d₆) ppm 9.14 (s, 1H) ; 8.60 (s, 1H) ; 8.48 (s, 1H) ; 8.12 (s, 1H) ; 8.08 (s, 1H) ; 3.84 (s, 3H) ; 3.50 (m, 2H) ; 1.17 (t, 3H) .

【0285】

工程D：2-(6-エチルスルホニル-3-メチル-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジンA11および2-(6-エチルスルホニル-1-メチル-ベンズイミダゾール-5-イル)-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジンA12の調製：

【化132】



実施例 P 4、工程 E に記載されるのと同様のプロトコルである。化合物は、シリカゲル上で分離可能でなかったが、HPLC キラル上で分離可能であった。

【0286】

分取 HPLC 方法 :

Waters 製の自動精製システム : 2767サンプルマネージャ (sample Manager)、2489紫外光 / 可視光検出装置、2545クオータナリーグラジエントモジュール (Quaternary Gradient Module)。

カラム : Daicel CHIRALPAK (登録商標) IC、 $5 \mu\text{m}$ 、 $1.0 \text{ cm} \times 25 \text{ cm}$

移動相 : ヘプタン / EtOAc / DEA 60 / 40 / 0.1 %

流量 : 1.0 mL/min

検出 : UV 230 nm

試料濃度 : EtOAc / DCM / MeOH 中の 23 mg/mL

注入 : $200 \sim 600 \mu\text{l}$

【0287】

【表15】

| 第1の溶出ピーク | 第2の溶出ピーク |
|-------------------------|-------------------------|
| 保持時間 (分) 約 0.89 | 保持時間 (分) 約 1.39 |
| 量 (mg) 戻り画分 | 量 (mg) 戻り画分 |
| 化学的純度 (265nmにおける面積%) 99 | 化学的純度 (265nmにおける面積%) 99 |

【0288】

2 - (6 - エチルスルホニル - 3 - メチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 11 (ピーク 2) :
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) ppm 8.94 (s, 1H) ; 8.68 (s, 1H) ; 8.19 (s, 1H) ; 8.10 (s, 1H) ; 7.59 (s, 1H) ; 3.96 (s, 3H) ; 3.75 (s, 3H) ; 3.42 - 3.20 (m, 2H) ; 1.22 (t, 3H) .

【0289】

2 - (6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 12 (ピーク 1) :
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) ppm 8.95 (s, 1H) ; 8.34 (s, 1H) ; 8.22 (s, 1H) ; 8.10 (s, 1H) ; 7.95 (s, 1H) ; 4.06 (s, 3H) ; 3.73 (s, 3H) ; 3.48 (m, 2H) ; 1.26 (t, 3H) .

【0290】

実施例 P 6 : 2 - (6 - エチルスルホニル - 2 - メチル - 3H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 13、2 - (6 - エチルスルホニル - 2 , 3 -ジメチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 14 および 2 - (6 - エチルスルホニル - 1 , 2 - デジメチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル)

10

20

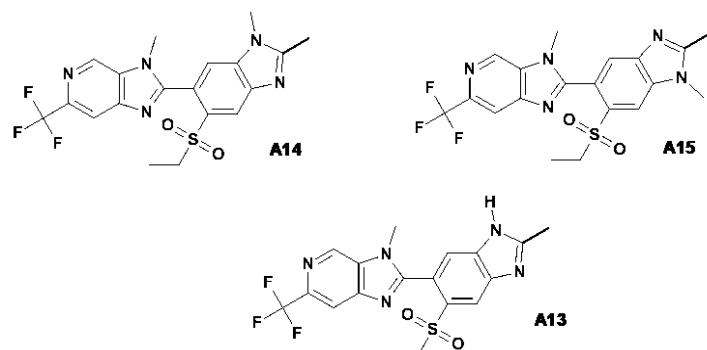
30

40

50

- 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン A 15 の調製 :

【化 133】



10

工程 A : N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] アセトアミドの調製 :

【化 134】



20

トルエン (5. mL) 中の 5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリン (20.1 mg) の攪拌溶液にピリジン (0.07 mL)、塩化アセチル (0.06 mL) を加えた。反応物を 7 時間にわたって還流させた。次に、揮発性物質を減圧下で除去し、残渣を酢酸エチルに溶解させ、0.1 M の HCl、次に水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチルで溶離しながら、シリカゲル (25 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] アセトアミド (82 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 9.07 (s, 1H); 8.93 (s, 1H); 8.08 (s, 1H); 7.98 (s, 1H); 7.68 (bs, 1H); 3.77 (s, 3H); 3.30 (q, 2H); 2.35 (s, 3H); 1.26 (t, 3H).

【0291】

工程 B : N - [2 - アミノ - 5 - エチルスルホニル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] アセトアミドの調製 :

【化 135】



30

実施例 P 5、工程 B と同一のプロトコルを使用した。表題化合物の分析データ：¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.91 (s, 1H); 8.40 (s, 1H); 8.07 (s, 1H); 7.93 (s, 1H); 6.81 (s, 1H); 4.86 (bs, 2H); 3.75 (s, 3H); 3.24 (q, 2H); 2.28 (s, 3H)

50

; 1 . 2 4 (t , 3 H) .

【 0 2 9 2 】

工程 C : 2 - (6 - エチルスルホニル - 2 - メチル - 3 H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 1 3 の調製 :

【 化 1 3 6 】

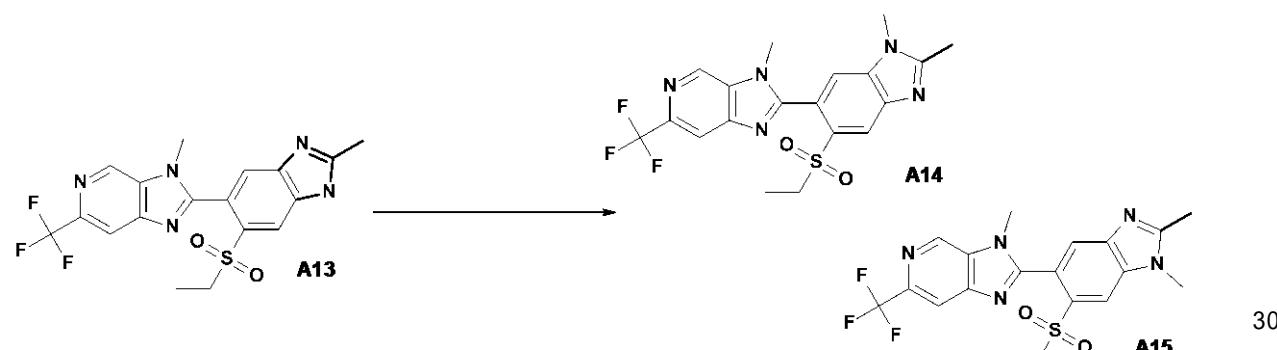


実施例 P 5 、工程 C と同一のプロトコルを使用した。得られた化合物をさらに精製せず
に次の工程に使用した。

【 0 2 9 3 】

工程 D : 2 - (6 - エチルスルホニル - 2 , 3 - ジメチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 1 4 および 2 - (6 - エチルスルホニル - 1 , 2 - ジメチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 1 5 の調製 :

【 化 1 3 7 】



実施例 P 4 、工程 E に記載されるのと同様のプロトコルである。化合物は、シリカゲル
上で分離可能でなかった。 2 - (6 - エチルスルホニル - 2 , 3 - ジメチル - ベンズイミ
ダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c
] ピリジン A 1 4 と、 2 - (6 - エチルスルホニル - 1 , 2 - ジメチル - ベンズイミダゾ
ール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピ
リジン A 1 5 との混合物が、 8 9 % の収率で得られた。次に、それらは、 H P L C キラル
上で分離可能であった。

【 0 2 9 4 】

分取 H P L C 方法 :

W a t e r s 製の自動精製システム : 2 7 6 7 サンプルマネージャ (s a m p l e M
a n a g e r) 、 2 4 8 9 紫外光 / 可視光検出装置、 2 5 4 5 クオータナリーグラジエン
トモジュール (Q u a t e r n a r y G r a d i e n t M o d u l e) 。

カラム : D a i c e l C H I R A L P A K (登録商標) I C 、 5 μ m 、 1 . 0 c m × 2
5 c m

移動相 : ヘブタン / E t O A c / D E A 5 0 / 5 0 / 0 . 1 %

流量 : 1 0 m l / 分

検出 : U V 2 3 0 n m

試料濃度 : E t O A c / D C M / M e O H 中の 1 5 m g / m L

注入 : 4 0 0 ~ 8 0 0 μ l

10

20

30

40

50

【0295】

【表16】

| 第1の溶出ピーク | 第2の溶出ピーク |
|------------------------|------------------------|
| 保持時間(分) 約0.74 | 保持時間(分) 約1.39 |
| 量(mg) 戻り画分 | 量(mg) 戻り画分 |
| 化学的純度(265nmにおける面積%) 98 | 化学的純度(265nmにおける面積%) 99 |

10

【0296】

2 - (6 - エチルスルホニル - 2 , 3 - ジメチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 14 (ピーク2) : ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) ppm 8.95 (s, 1H); 8.53 (s, 1H); 8.10 (s, 1H); 7.46 (s, 1H); 3.83 (s, 3H); 3.76 (s, 3H); 3.32 (m, 2H); 2.74 (s, 3H); 1.20 (t, 3H).

【0297】

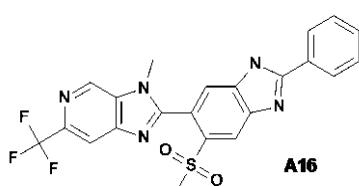
2 - (6 - エチルスルホニル - 1 , 2 - ジメチル - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 15 (ピーク1) : ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) ppm 8.95 (s, 1H); 8.21 (s, 1H); 8.10 (s, 1H); 7.79 (s, 1H); 3.93 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 3.46 (m, 2H); 2.75 (s, 3H); 1.25 (t, 3H).

20

【0298】

2 - (6 - エチルスルホニル - 2 - フェニル - 3H - ベンズイミダゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 16 を、実施例 P 6、工程 A ~ 工程 C に記載されているのと同じ一連の工程を用いて調製した。

【化138】



30

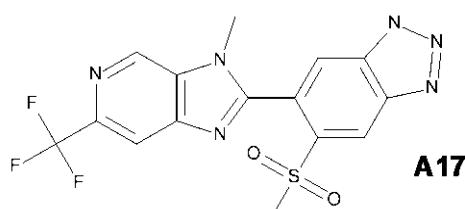
LC - MS (方法A) RT 0.95、4.86 (MH⁺)、4.84 (M - H⁺).

【0299】

実施例 P 7 : 2 - (6 - エチルスルホニル - 3H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 17 の調製 :

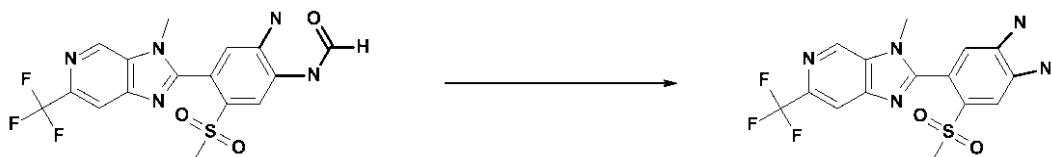
【化139】

40



工程 A : 4 - エチルスルホニル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] ベンゼン - 1 , 2 - ジアミンの調製 :

【化140】



メタノール (7 mL) 中の N - [2 - アミノ - 5 - エチルスルホニル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] ホルムアミド (実施例 P 5、工程 Bにおいて調製される、90 mg) の攪拌溶液に水 (1 mL) および水酸化ナトリウム (20 mg) を周囲温度で加えた。混合物を 17 時間にわたって還流させた。溶媒を蒸発させ、残渣を酢酸エチルに溶解させた。有機相を水で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチル中 10 % の MeOH で溶離しながら、シリカゲル (10 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、4 - エチルスルホニル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] ベンゼン - 1 , 2 - ジアミン (60 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.89 (s, 1 H); 8.06 (d, 1 H); 7.45 (s, 1 H); 6.74 (s, 1 H); 3.97 (brs, 2 H); 3.74 (s, 3 H); 3.23 (q, 2 H); 1.21 (t, 3 H).

【0300】

工程 B : 2 - (6 - エチルスルホニル - 3H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 17 の調製 :

【化141】

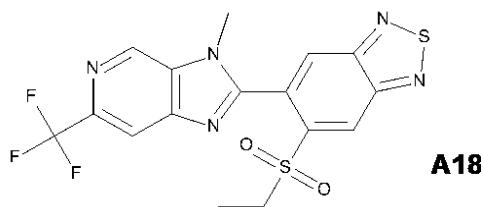


酢酸 (3 mL) 中の 4 - エチルスルホニル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] ベンゼン - 1 , 2 - ジアミン (80 mg) の攪拌溶液に周囲温度で水 (1 mL) 中の亜硝酸ナトリウム (69 mg) の溶液を加えた。混合物を周囲温度で 2 時間攪拌した。次に、溶媒を減圧下で蒸発させ、残渣を酢酸エチルおよび水に溶解させた。有機相を分離し、Na₂CO₃ の飽和溶液で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチル中 10 % の MeOH で溶離しながら、シリカゲル (30 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、2 - (6 - エチルスルホニル - 3H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 17 (73 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, Acetone-D₆) ppm 9.18 (s, 1 H); 8.82 (s, 1 H); 8.47 (s, 1 H); 8.15 (s, 1 H); 3.88 (s, 3 H); 3.59 (q, 2 H); 1.21 (t, 3 H).

【0301】

実施例 P 8 : 5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 2 , 1 , 3 - ベンゾチアジアゾール A 18 の調製 :

【化142】



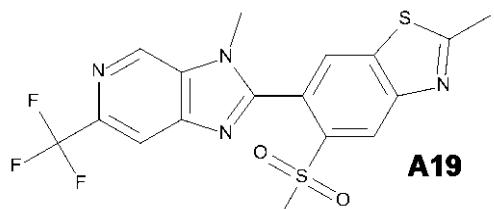
乾燥トルエン (10 mL) 中の 4 - エチルスルホニル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] ベンゼン - 1 , 2 - ジアミン (実施例 P 7、工程 A において調製される、99.85 mg) の攪拌溶液に塩化チオニル (0.06 mL) を加えた。混合物を 2 時間にわたってアルゴン下で還流させた。次に、溶媒を蒸発させ、残渣を酢酸エチルに溶解させた。有機相を飽和溶液 NaHCO₃ で洗浄し、乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をヘキサン : 酢酸エチル (1 : 1) で溶離しながら、シリカゲル (10 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 2 , 1 , 3 - ベンゾチアゾール A 18 (47 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.99 (s, 2 H); 8.26 (s, 1 H); 8.13 (s, 1 H); 3.83 (s, 3 H); 3.50 (q, 2 H); 1.30 (t, 3 H).

10

【0302】

実施例 P 9 : 5 - エチルスルホニル - 2 - メチル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール A 19 の調製：

【化143】



20

乾燥トルエン (7 mL) 中の N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] アセトアミド (実施例 P 6、工程 A において調製される、171.22 mg) の攪拌溶液にローソン試薬 (76.85 mg) を加えた。混合物を 17 時間にわたってアルゴン下で還流させた。次に、溶媒を蒸発させ、残渣を酢酸エチルで溶離しながらシリカゲル (35 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、5 - エチルスルホニル - 2 - メチル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール A 19 (80.5 % の収率) が得られた。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.96 (s, 1 H); 8.77 (s, 1 H); 8.10 (s, 1 H); 8.02 (s, 1 H); 3.77 (s, 3 H); 3.37 (q, 2 H); 2.98 (s, 3 H); 1.25 (t, 3 H).

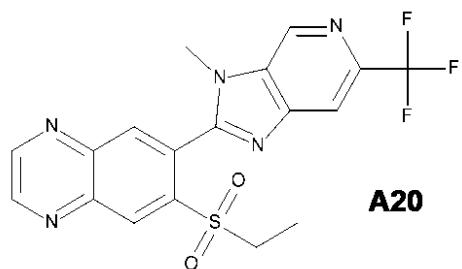
30

【0303】

実施例 P 10 : 6 - エチルスルホニル - 7 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] キノキサリン A 20 の調製：

40

【化 1 4 4】



エタノール(5 mL)中の4-エチルスルホニル-5-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]ベンゼン-1,2-ジアミン(実施例P7、工程Aにおいて調製される、171.22mg)の攪拌溶液にグリオキサール(水溶液中40%)の溶液を加えた。混合物を1時間にわたってアルゴン下で還流させた。次に、溶媒を蒸発させ、残渣を5mLの冷メタノールで研和した。固体をろ過によって単離し、少量の冷メタノールで洗浄し、乾燥させたところ、6-エチルスルホニル-7-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]キノキサリンA20(38%の収率)が得られた。¹H NMR(300MHz, CDCl₃) ppm 9.15(s, 1H); 9.12(s, 1H); 9.05(s, 1H); 9.00(s, 1H); 8.34(s, 1H); 8.13(s, 1H); 3.83(s, 3H); 3.53(q, 2H); 1.31(t, 3H).

【 0 3 0 4 】

化合物 A-28 および A-29 を、上述されるプロトコルおよびトリフルオロメチルグリオキサール(20%水溶液)を用いて調製した。化合物 A-28 および A-29 を 30 g のシリカゲル上で溶離剤ヘキサン：酢酸エチル 1 : 1 で精製した。

【 0 3 0 5 】

A 2 8 : ^1H N M R (6 0 0 M H z , C D C l ₃) p p m 1 . 3 4 (t , 3 H) , 3 . 5 6 (m , 2 H) , 3 . 8 5 (s , 3 H) , 8 . 1 6 (s , 1 H) , 8 . 4 7 (s , 1 H) , 9 . 0 3 (s , 1 H) , 9 . 1 5 (s , 1 H) , 9 . 4 7 (s , 1 H) .

[0 3 0 6]

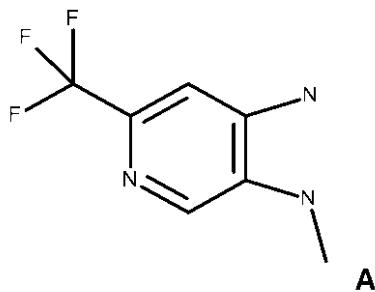
A 29: ^1H NMR (600 MHz, CDCl₃) ppm 1.33 (t, 3 H), 3.53 (m, 2 H), 3.85 (s, 3 H), 8.16 (s, 1 H), 8.46 (s, 1 H), 9.03 (s, 1 H), 9.18 (s, 1 H), 9.44 (s, 1 H).

[0 3 0 7]

実施例 P 1 1 : 3 - エチルスルファニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] キノロン A 2 1 、 3 - エチルスルホニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] キノロン A 2 2 、 2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ナフチル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 2 3 および 2 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ナフチル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 2 4 の調製。

化合物 A 2 1 および A 2 3 を、実施例 P 1 に記載されているプロトコルを用いて中間体 1 または 2 を用いて、およびジアミド A (スキームを参照、国際公開第 2015 / 000715 号において調製される) を用いて調製し、次に、A 2 2 および A 2 4 を、実施例 P 3 に記載されているのと同一の方法により、A 2 1 および A 2 3 の酸化によって調製した。

【化 1 4 5】

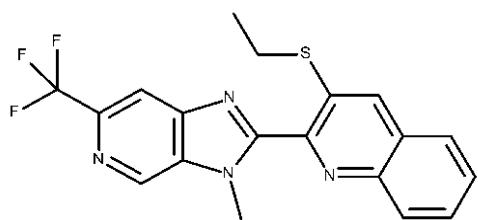


10

【0 3 0 8】

化合物 A 2 1 :

【化 1 4 6】



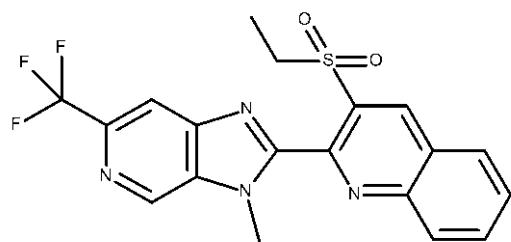
20

¹H N M R (3 0 0 M H z, C D C l₃) p p m 9 . 0 5 (s , 1 H)、 8 . 2 8 (s , 1 H)、 8 . 2 0 (s , 1 H)、 8 . 1 6 (d , 1 H)、 7 . 8 9 (d , 1 H)、 7 . 7 9 (m , 1 H)、 7 . 7 0 (m , 1 H)、 4 . 1 4 (s , 3 H)、 3 . 1 0 (q , 2 H)、 1 . 4 2 (t , 3 H) .

【0 3 0 9】

化合物 A 2 2 :

【化 1 4 7】



30

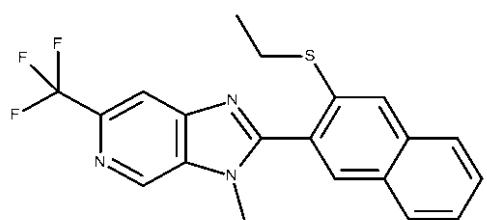
¹H N M R (3 0 0 M H z, C D C l₃) p p m 9 . 1 2 (s , 1 H)、 9 . 0 4 (s , 1 H)、 8 . 3 0 (d , 1 H)、 8 . 1 7 (m , 2 H)、 8 . 0 7 (t , 1 H)、 7 . 9 0 (t , 1 H)、 3 . 9 9 (s , 3 H)、 3 . 8 8 (q , 2 H)、 1 . 4 2 (t , 3 H) .

40

【0 3 1 0】

化合物 A 2 3 :

【化 1 4 8】



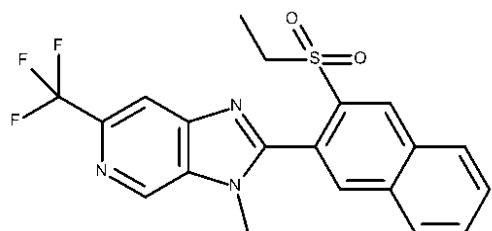
50

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.95 (s, 1H)、8.16 (s, 1H)、8.00 (s, 1H)、7.92 (s, 1H)、7.87 (d, 1H)、7.63 (t, 1H)、7.55 (m, 1H)、7.70 (m, 1H)、3.82 (s, 3H)、2.92 (q, 2H)、1.26 (t, 3H).

【0311】

化合物A24：

【化149】



10

¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.96 (s, 1H)、8.77 (s, 1H)、8.16 (m, 1H)、8.12 (s, 1H)、8.05 (s, 1H)、8.01 (m, 1H)、7.82 (m, 2H)、3.78 (s, 3H)、3.42 (m, 2H)、1.26 (t, 3H).

【0312】

実施例P12：7-エチルスルファニル-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]イソキノリンA25、7-エチルスルホニル-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]イソキノリンA26、7-エチルスルホニル-6-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-2-オキシド-イソキノリン-2-イウムA27の調製。

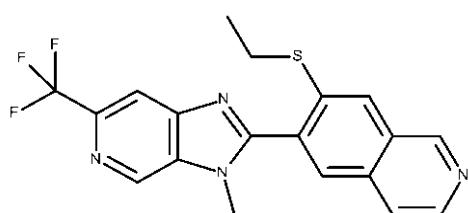
20

化合物A25を、P1に記載されているプロトコルを用いて中間体3を用いて調製し、次に、A26およびA27を、実施例P3に記載されているのと同一の方法により、A25の酸化によって調製し、A27の場合、2.5当量のm-CPPBAを使用した。

【0313】

化合物A25：

【化150】



30

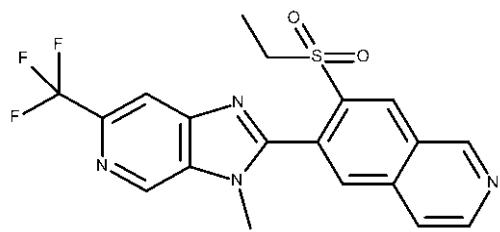
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 9.32 (s, 1H)、8.98 (s, 1H)、8.61 (d, 1H)、8.17 (s, 1H)、7.99 (s, 2H)、7.68 (d, 1H)、3.84 (s, 3H)、3.00 (q, 2H)、1.32 (t, 3H).

40

【0314】

化合物A26：

【化151】

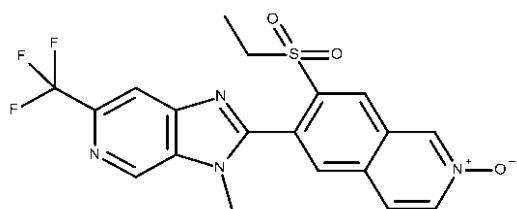


¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 9.60 (s, 1H)、8.98 (s, 1H)、8.93 (s, 1H)、8.89 (d, 1H)、8.12 (s, 1H)、8.06 (s, 1H)、7.83 (d, 1H)、3.80 (s, 3H)、3.44 (br. s., 2H)、1.28 (t, 3H). 10

【0315】

化合物A27：

【化152】



20

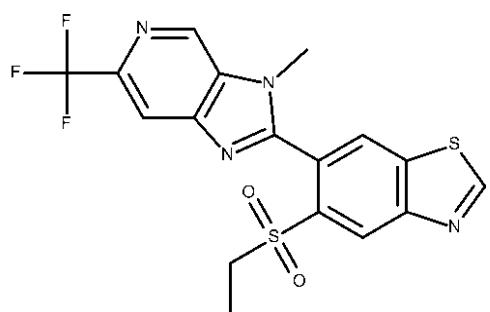
¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 8.97 (d, 2H)、8.59 (s, 1H)、8.36 (dd, 1H)、8.12 (s, 1H)、7.98 (s, 1H)、7.82 (d, 1H)、3.80 (s, 3H)、3.44 (m, 2H)、1.28 (t, 3H). 30

【0316】

実施例P13：5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 , 3 - ベンゾチアゾールA30の調製。

30

【化153】

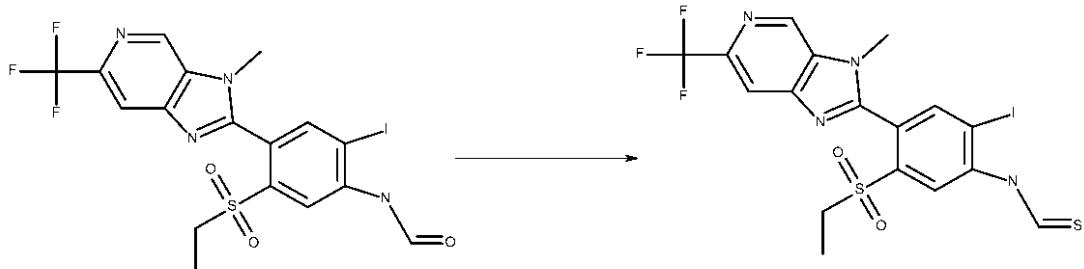


A30

40

工程A：N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] チオホルムアミドの調製

【化154】

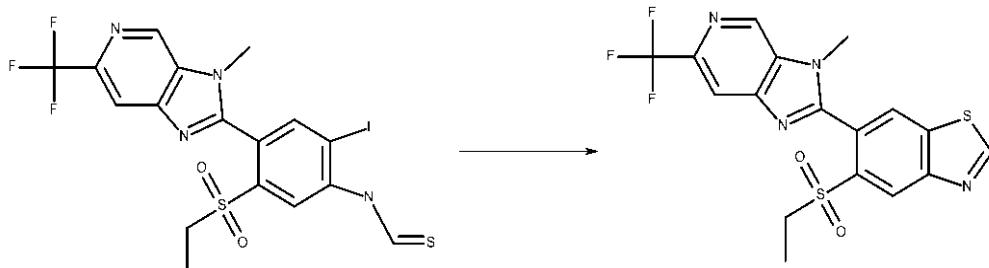


乾燥トルエン (8 mL) 中の N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] ホルムアミド (102.3 mg、実施例 P 5、工程 Aにおいて調製される) の攪拌溶液にローソン試薬 (50 mg) を加えた。混合物を 15 分間にわたってアルゴン下で還流させた。次に、溶媒を 2 mL の溶液になるまで濃縮し、残渣をヘキサン / 酢酸エチル 1 : 1 で溶離しながらシリカゲル (20 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] チオホルムアミド (80 mg) が得られた。¹H NMR (300 MHz、DMSO) ppm 12.02 (s, 1 H); 9.85 - 9.77 (m, 1 H); 9.26 (s, 1 H); 8.55 - 7.92 (m, 3 H); 3.77 (s, 3 H); 3.51 (q, 2 H); 1.17 (t, 3 H). 10

【0317】

工程 B : 5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール A 30 の調製

【化155】

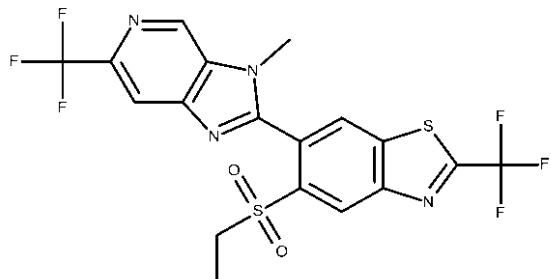


N - [5 - エチルスルホニル - 2 - ヨード - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] フェニル] チオホルムアミド (89 mg) をアルゴン下においてジメトキシエタン (7 mL) 中で懸濁させ、炭酸セシウム (78.24 mg)、ヨウ化銅 (3.8 mg) および 1 , 10 - フェナントロリン (7.2 mg) を加えた。混合物を 17 時間にわたってアルゴン下で還流させた。溶媒を減圧下で蒸発させ、残渣を酢酸エチルで溶離しながらシリカゲル (25 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 1 , 3 - ベンゾチアゾール A 30 (68 mg) が得られた。¹H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 9.35 (s, 1 H); 8.99 (s, 1 H); 8.97 (s, 1 H); 8.19 (s, 1 H); 8.11 (s, 1 H); 3.78 (s, 3 H); 3.39 (m, 2 H); 1.27 (t, 3 H). 30

【0318】

実施例 P 14 : 5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 2 - (トリフルオロメチル) - 1 , 3 - ベンゾチアゾール A 31 の調製。

【化156】



A31

10

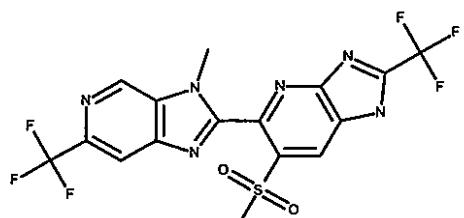
化合物A31を、出発材料N-[5-エチルスルホニル-2-ヨード-4-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]フェニル]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド(実施例P4、工程C)を用いて、実施例P9に記載されているプロトコルを用いて調製した。¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) ppm 9.07 (s, 1 H); 8.98 (s, 1 H); 8.24 (s, 1 H); 8.12 (s, 1 H); 3.78 (s, 3 H); 3.41 (q, 2 H); 1.26 (t, 3 H).

【0319】

実施例P15: 6-エチルスルホニル-5-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-2-(トリフルオロメチル)-1H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンA34、6-エチルスルホニル-1-メチル-5-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジンA33および6-エチルスルホニル-3-メチル-5-[3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジンA32の調製:

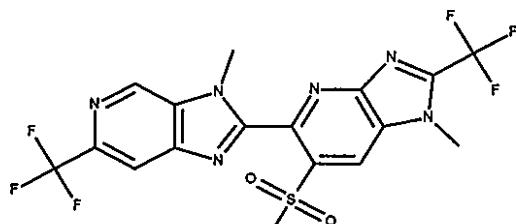
20

【化157】



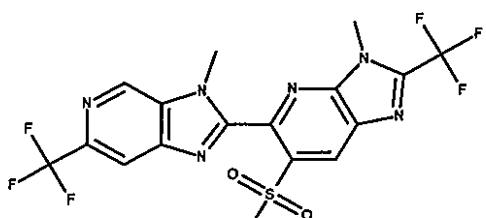
A34

30



A33

40

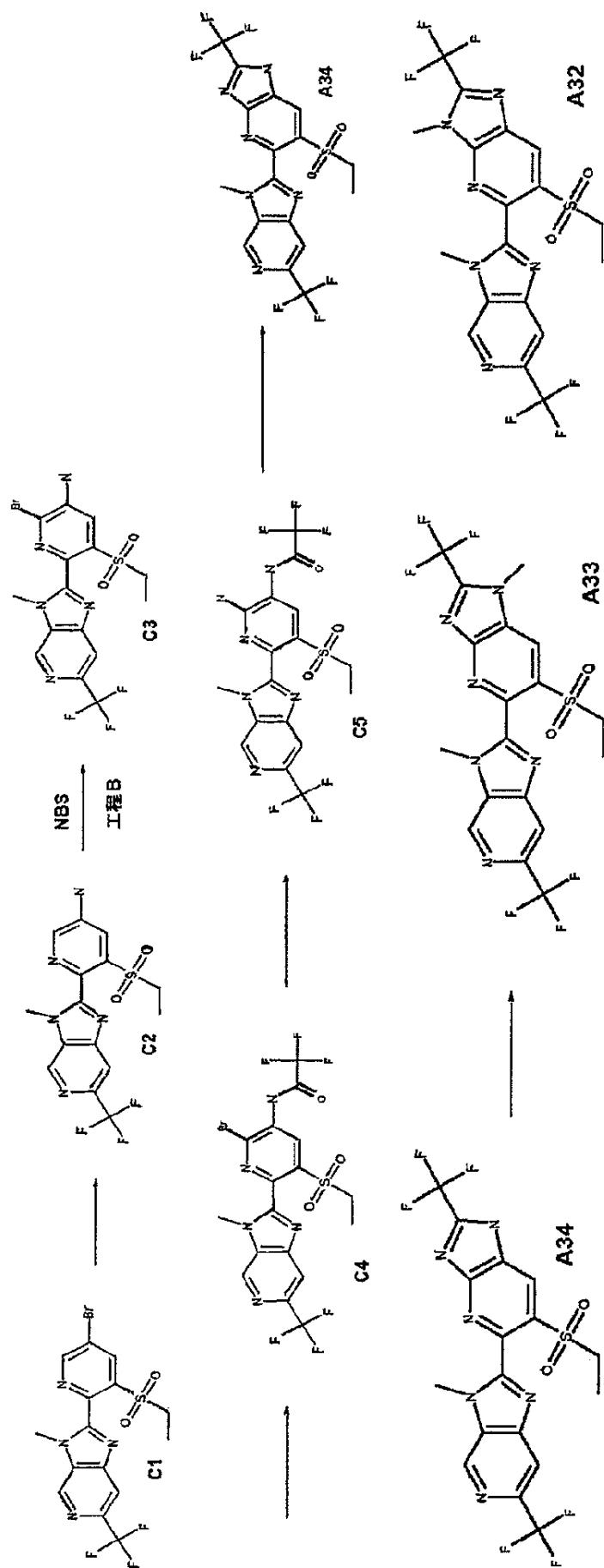


A32

50

化合物 A 3 4、A 3 3 および A 3 2 を、出発材料として 2 - (5 - プロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (C 1、国際公開第 2 0 1 5 / 0 0 0 7 1 5 号に記載されているように調製される) を用いて、および以下のスキームに記載されている工程 B 中の N I S を N B S に置き換えて、同じ条件を用いて実施例 P 4 に記載されているように調製した。

【化 158】



【0320】

10

20

30

40

50

C 2 : ^1H NMR (300 MHz、アセトン-d₆) ppm 9.14 (s, 1 H) ; 8.44 (d, 1 H) ; 8.10 (d, 1 H) ; 7.73 (d, 1 H) ; 6.01 (br s, 2 H) ; 3.93 (s, 3 H) ; 3.79 (q, 2 H) ; 1.27 (t, 3 H).

【0321】

C 3 : ^1H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 8.94 (s, 1 H) ; 8.07 (d, 1 H) ; 7.71 (s, 1 H) ; 3.90 (s, 3 H) ; 3.78 (q, 2 H) ; 1.36 (t, 3 H).

【0322】

C 4 : ^1H NMR (300 MHz、アセトン-d₆) ppm 9.18 (s, 1 H) ; 9.13 (s, 1 H) ; 8.13 (d, 1 H) ; 3.99 (s, 3 H) ; 3.76 (q, 2 H) ; 1.29 (t, 3 H).

【0323】

C 5 : ^1H NMR (300 MHz、アセトン-d₆) ppm 10.10 (bs, 1 H) ; 9.18 (s, 1 H) ; 8.27 (s, 1 H) ; 8.14 (s, 1 H) ; 6.98 (bs, 2 H) ; 3.98 (s, 3 H) ; 3.65 (q, 2 H) ; 1.25 (t, 3 H).

【0324】

A 34 : ^1H NMR (300 MHz、アセトン-d₆) ppm 9.15 (s, 1 H) ; 8.54 (s, 1 H) ; 8.11 (s, 1 H) ; 3.88 (s, 3 H) ; 3.69 (q, 2 H) ; 1.24 (t, 3 H).

【0325】

A 33 : ^1H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 9.00 (s, 1 H) ; 8.77 (s, 1 H) ; 8.11 (s, 1 H) ; 4.19 (s, 3 H) ; 3.94 (m, 5 H) ; 1.40 (t, 3 H).

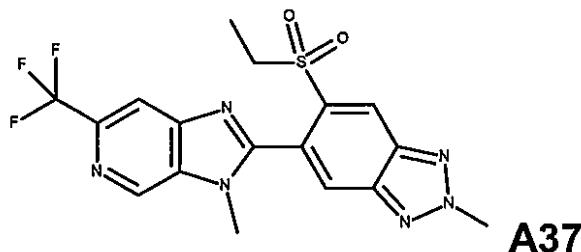
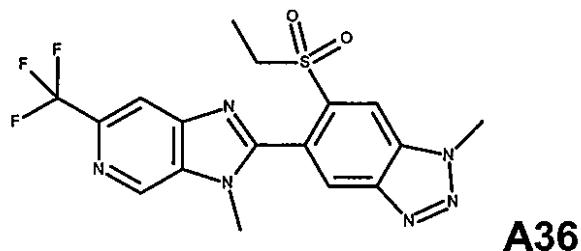
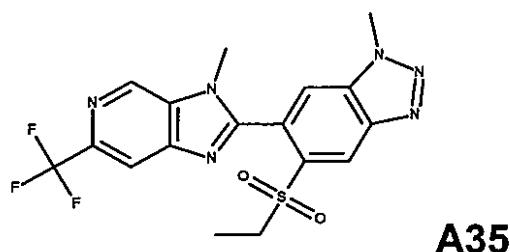
【0326】

A 32 : ^1H NMR (300 MHz、CDCl₃) ppm 9.02 (s, 2 H) ; 8.13 (s, 1 H) ; 4.12 (s, 3 H) ; 3.87 (s, 3 H) ; 3.70 (q, 2 H) ; 1.35 (t, 3 H).

【0327】

実施例 P 16 : 5 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン - 2 - イル] ベンゾトリアゾール A 35、6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン - 2 - イル] ベンゾトリアゾール A 36 および 5 - エチルスルホニル - 2 - メチル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン - 2 - イル] ベンゾトリアゾール A 37 の調製：

【化159】



2 - (6 - エチルスルホニル - 3 H - ベンゾトリアゾール - 5 - イル) - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン A 17 から出発して、実施例 P 4 、工程 E に記載されるのと同様のプロトコルである。化合物 A 36 および A 37 は、シリカゲル上で分離可能でなく、以下の方法を用いて逆相上で HPLC によって分離された。

【0328】

Waters 製の自動精製システム : 2767 サンプルマネージャ (sample Manager) 、 2489 紫外光 / 可視光検出装置、 2545 クオータナリーグラジエントモジュール (Quaternary Gradient Module) 。カラム : Phenomenex Gemini NX C18 、 4 μm の粒度、 80 オングストローム、 75 × 30 . 00 mm 、 DAD 波長 (nm) : 220 および 254 。溶媒勾配 : 逆相、分取 HPLC のための A = 水 (社内 - HPLC 品質) および B = アセトニトリル。

【0329】

【表17】

| 時間 | A% | B% | 流量(ml/分) |
|------|----|-----|----------|
| 0.00 | 70 | 30 | 50.00 |
| 0.01 | 70 | 30 | 50.00 |
| 6.00 | 30 | 70 | 50.00 |
| 7.90 | 30 | 70 | 50.00 |
| 8.00 | 0 | 100 | 50.00 |
| 8.90 | 0 | 100 | 50.00 |
| 9.00 | 70 | 30 | 50.00 |
| 10.0 | 70 | 30 | 50.00 |

【0330】

10

20

30

40

50

A 3 5 : ^1H NMR (300 MHz、アセトン-d₆) ppm 9.18 (s, 1 H) ; 8.83 (s, 1 H) ; 8.38 (s, 1 H) ; 8.15 (s, 1 H) ; 4.52 (s, 3 H) ; 3.88 (s, 3 H) ; 3.57 (m, 2 H) ; 1.21 (t, 3 H).

【0331】

A 3 6 : ^1H NMR (600 MHz、CDCl₃) ppm 1.29 (t, J = 7.4 Hz, 3 H) 3.53 (br s, 2 H) 3.77 (s, 3 H) 4.53 (s, 3 H) 8.13 (s, 1 H) 8.28 (s, 1 H) 8.54 (s, 1 H) 8.99 (s, 1 H)

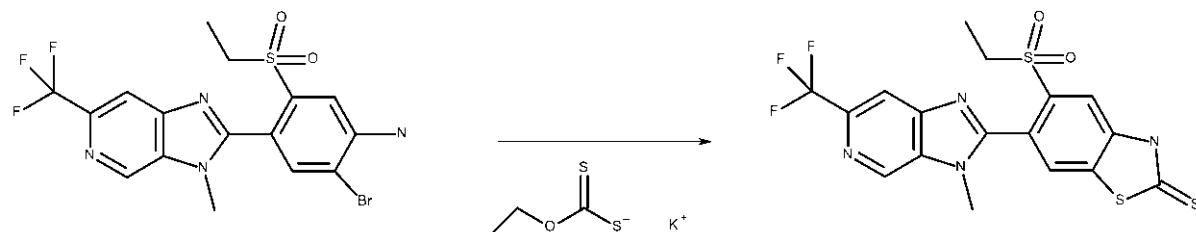
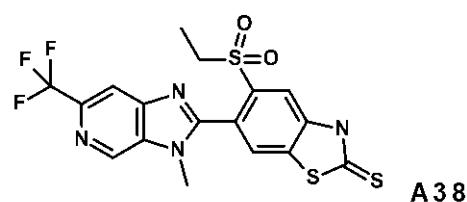
【0332】

A 3 7 : ^1H NMR (600 MHz、CDCl₃) ppm 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3 H) 3.46 (br s, 2 H) 3.78 (s, 3 H) 4.69 (s, 3 H) 8.09 (s, 1 H) 8.12 (s, 1 H) 8.87 (s, 1 H) 8.98 (s, 1 H)

【0333】

実施例 P 1 7 : 5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 3 H - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - チオン A 3 8 の調製 :

【化160】

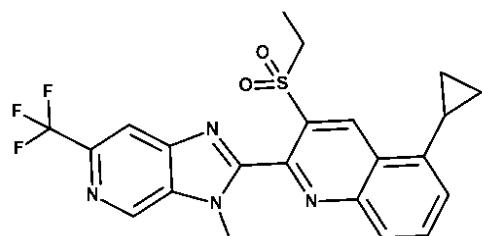


2 - ブロモ - 5 - エチルスルホニル - 4 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] アニリン (C 3、実施例 P 1 5 を参照、139 mg) をアルゴン下において1時間にわたって120 °C で乾燥 D M F 中のキサントゲン酸カリウム (市販されている、105.8 mg) とともに加熱した。溶液を塩化アンモニウムの飽和溶液で処理し、酢酸エチルで抽出した。有機相および水相を分離し、有機相を乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチルで溶離しながら、シリカゲル (25 g) 上でのカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、5 - エチルスルホニル - 6 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 3 H - 1 , 3 - ベンゾチアゾール - 2 - チオン A 3 8 (95 %の純度、60 mg) が得られた。L C - M S (方法 A) R T 0.91 (459, MH⁺) . ^1H NMR (400 MHz、DMSO-d₆) ppm 9.25 (s, 1 H) 、 8.26 (s, 1 H) 、 8.16 (s, 1 H) 、 7.88 (s, 1 H) 、 3.74 (s, 3 H) 、 3.54 (q, 2 H) 、 1.12 (t, 3 H) .

【0334】

実施例 P 1 8 : 5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] キノリン A 4 3 の調製 :

【化161】



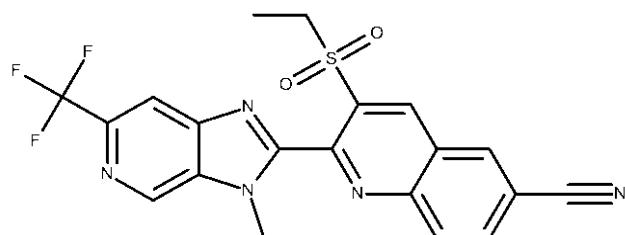
トルエン (2 mL) 中の 5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] キノロン A 4 2 (表 8 を参照、0 . 1 mmol) の溶液にシクロプロピルボロン酸 (15 mg、0 . 17 mol) および K_3PO_4 (75 mg、0 . 35 mmol) およびトリシクロヘキシリホスフィン (4 mg、0 . 01 mmol) を加えた。混合物を 10 分間脱気し、 $Pd(OAc)_2$ (2 mg、0 . 007 mmol) を加えた。混合物を 100 °C で 2 時間加熱した。混合物を Celite のプラグに通してろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー (CombiFlash Rf 150; 10 g の SiO_2 ; iHEX : EA = 4 : 1) によって精製したところ、所望の生成物 (26 mg; 56 . 5 %) が得られた。

1H NMR : 表 8 を参照されたい。

【0335】

実施例 P 19 : 3 - エチルスルホニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] キノリン - 6 - カルボニトリル A 5 0 の調製 :

【化162】

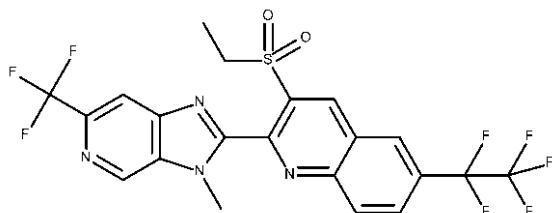


4 mL の DMF : 水 (99 : 1) の混合物中の 6 - クロロ - 3 - エチルスルホニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] キノロン A 4 9 (表 8 を参照、86 mg、0 . 19 mmol) 、 $Pd_{2}db_{a_3}$ (27 mg、0 . 03 mmol) 、 $S-Phos$ (32 mg、0 . 08 mmol) および $Zn(CN)_2$ (45 mg、0 . 38 mmol) の溶液をマイクロ波反応器中で 30 分間にわたって 170 °C に加熱した。溶液を水で希釈し、酢酸エチルで (2 回) 抽出した。組み合わせられた有機層を組み合わせて、 $MgSO_4$ 上で乾燥させ、ろ過し、濃縮したところ、油が得られた。油をシリカゲル、FCC (CombiFlash Rf 150; 10 g の SiO_2 ; iHEX : EA = 3 : 1 : 2 : 1) 上で精製したところ、表題化合物 (42 mg; 49 . 6 % の収率) が得られた。 1H NMR : 表 8 を参照されたい。

【0336】

実施例 P 20 : 3 - エチルスルホニル - 2 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 6 - (1,1,2,2,2 - ペンタフルオロエチル) キノリン A 5 2 の調製 :

【化163】

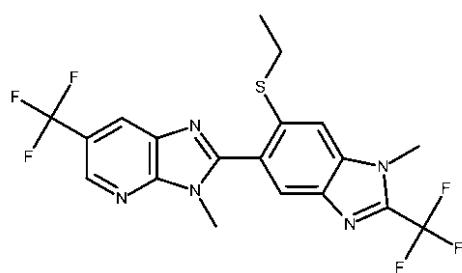


アルゴン下において 5 mL のマイクロ波 (MW) バイアルに A45 (表8を参照、24 mg、0.48 mmol)、NMP (3972 mg、3.845 mL、39.7 mmol、82.5) および pentafluoroethylator (369.2 mg、0.96 mmol) を充填した。混合物を 90 °C で 3 時間攪拌し、1 当量の pentafluoroethylator を加え、マイクロ波 (MW) バイアルを 90 °C でさらに 1 時間置いた。反応混合物を水 (30 mL) で希釈し、酢酸エチル (3 × 30 mL) で 2 回抽出した。組み合わされた有機相を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を酢酸エチル / シクロヘキサンで溶離しながら、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーにかけた。選択された画分を蒸発させたところ、表題化合物 (118 mg) が得られた。¹H NMR : 表8を参照されたい。

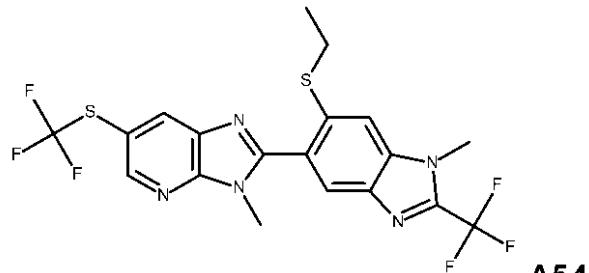
【0337】

実施例 P20 : 2 - [6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン A53、2 - [6 - エチルスルファニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン A54、2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル)イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン A55、2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン A56 および 2 - [6 - エチルスルホニル - 1 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール - 5 - イル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルフィニル)イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン A57 の調製 :

【化164】



A53

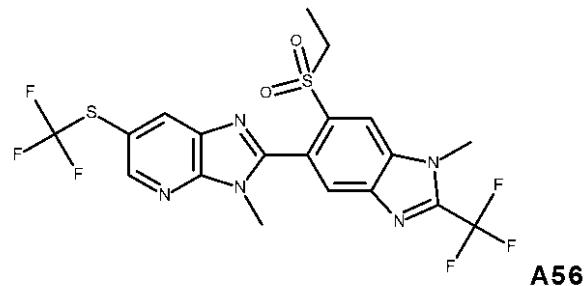
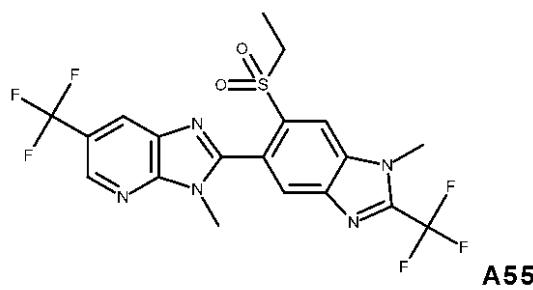


A54

A53 および A54 を、中間体 8 とともに N2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 , 3 - ジアミン (cas : 1643139 - 91 - 6) および N2 - メチル - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル)ピリジン - 2 , 3 - ジアミン (cas : 1383840 - 73 - 0) を用いて同じプロトコルによって合成した。

【0338】

【化165】



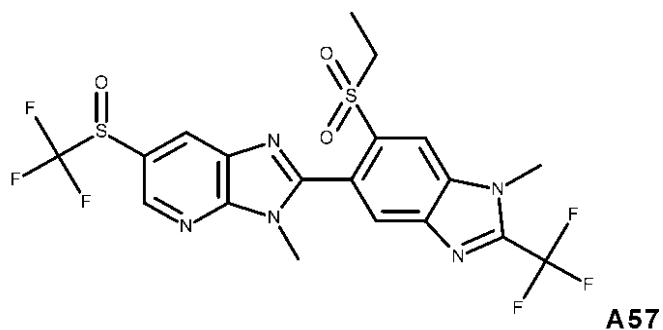
10

A55およびA56を、2-[6-エチルスルファニル-1-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール-5-イル]-3-メチル-6-(トリフルオロメチル)イミダゾ[4,5-b]ピリジンA53および2-[6-エチルスルファニル-1-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンズイミダゾール-5-イル]-3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-b]ピリジンA54を用いて、A3のための同じプロトコルによって合成した。

【0339】

【化166】

20



30

A57を化合物A56とともに副生成物として単離した。

【0340】

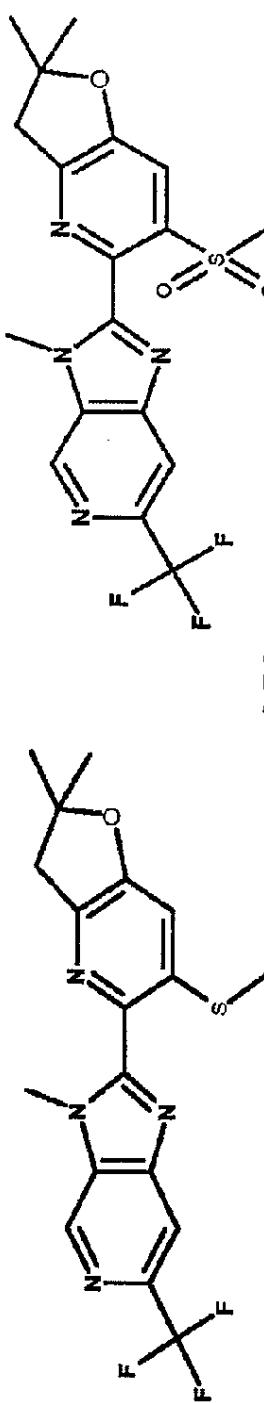
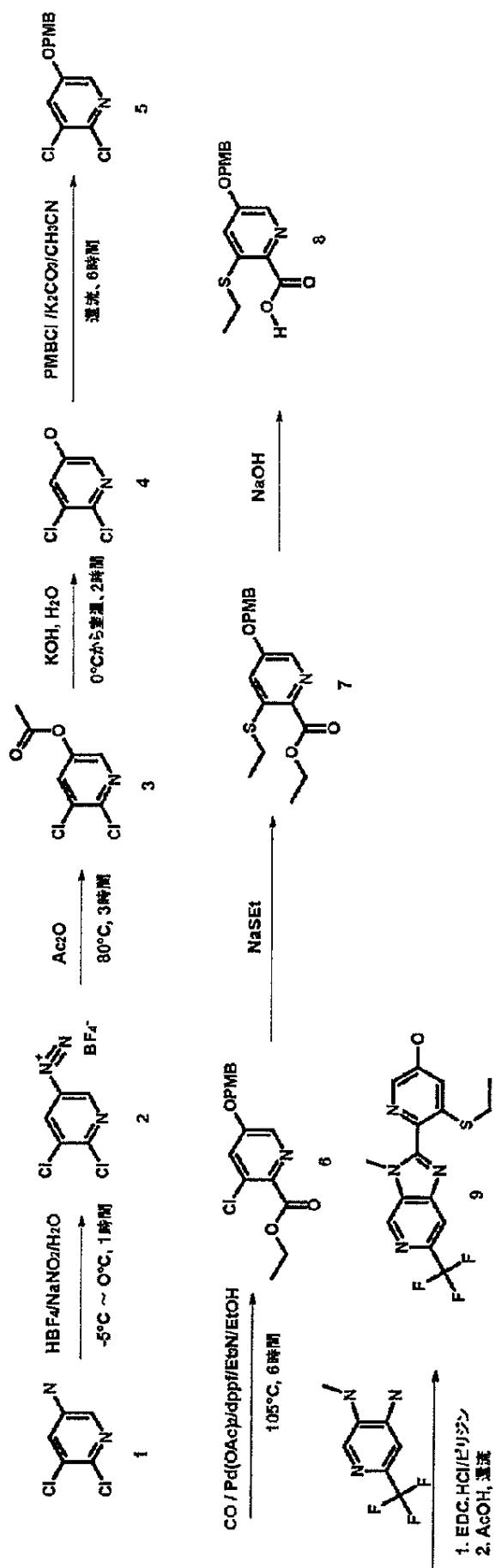
【表 1 8】

| | NMR | LC/MS | |
|-----|---|--|----|
| A53 | ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.23 (t, 3 H), 2.88 (q, 2 H), 3.74 (s, 3 H), 4.03 (s, 3 H), 7.59 (s, 1 H), 7.97 (s, 1 H), 8.35 (d, 1 H), 8.74 (d, 1 H). | LC-MS (方法 A): RT 1.12 (461, MH ⁺). | |
| A54 | ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.24 (t, 4 H), 2.89 (q, 2 H), 3.72 (s, 3 H), 4.03 (s, 3 H) 7.58 (s, 1 H) 7.96 (s, 1 H) 8.42 (d, 1 H) 8.68 (d, 1 H). | LC-MS (方法A): RT 1.18 (492, MH ⁺). | 10 |
| A55 | ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.28 (t, 3 H), 3.56 (q, 2 H), 3.70 (s, 3 H), 4.16 (s, 3 H), 8.04 (s, 1 H), 8.30 (d, 1 H), 8.43 (s, 1 H), 8.76 (d, 1 H). | LC-MS (方法A): RT 1.03 (492, MH ⁺). | 20 |
| A56 | ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃)δ ppm 1.28 (m, 3 H), 3.56 (q, 2 H), 3.69 (s, 3 H), 4.16 (s, 3 H), 8.04 (s, 1 H), 8.37 (d, 1 H), 8.43 (s, 1 H), 8.70 (d, 1 H). | LC-MS (方法A): RT 1.09 (525, MH ⁺). | |
| A57 | ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.28 (m, 3 H), 3.56 (q, 2 H,) 3.73 (s, 3 H), 4.16 (s, 3 H), 8.06 (s, 1 H), 8.44 (s, 1 H), 8.57 (s, 1 H), 8.77 (d, 1 H). | LC-MS (方法A): RT 0.96 (540, MH ⁺). | 30 |

【0 3 4 1】

実施例 P 2 0 : 6 - エチルスルファニル - 2 , 2 - ジメチル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 3 H - フロ [3 , 2 - b] ピリジン A 5 8 および 6 - エチルスルホニル - 2 , 2 - ジメチル - 5 - [3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 2 - イル] - 3 H - フロ [3 , 2 - b] ピリジン A 5 9 の調製 :

【化167】

**A59**

温度が -5 ~ 0 に低下されたとき、100 ml の水中の NaNO₂ (7.21 g、12.6 mmol) の溶液を 200 ml の HBF₄ (40%) 中の化合物 1 (16.3 g、10.0 mmol) の混合物に加えた。0 で 1 時間攪拌した後、反応混合物をろ過した。ろ過残渣を水で 2 回、および 0 のエーテルで 2 回洗浄した。粗生成物 (24.6 g、収率：93%) を次の工程に使用した。

【0342】

工程 A：化合物 3 の調製

温度が 70 ~ 90 に加熱されたとき、化合物 2 (24.6 g) を 250 ml の酢酸にゆっくりと加えた。次に、混合物溶液を 80 ~ 90 で 2 時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、水に注ぎ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、生成物 3 (7.7 g、収率：37%) が得られた。

¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) (ppm) : 2.32 (s, 3H), 8.17 (d, 1H), 8.33 (d, 1H).

【0343】

工程 C：化合物 4 の調製

7 ml の水中の KOH (728 mg、13 mmol) の溶液を 0 で 10 ml の THF 中の化合物 3 (1 g、4.8 mmol) の溶液に加えた。添加後、混合物を周囲温度で 2 時間攪拌した。次に、混合物に希塩酸を加えて、pH 値を弱アルカリ性に調整し、ろ過した。ろ過残渣を再結晶化によって精製したところ、化合物 4 (517 mg、収率：65%) が得られた。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) (ppm) : 7.47 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 10.72 (s, 1H).

【0344】

工程 D：化合物 5 の調製

130 ml の CH₃CN 中の化合物 4 (8.15 g、0.05 mmol) と、PMBc 1 (11.78 g、0.075 mmol) と、K₂CO₃ (13.8 g、0.1 mmol) との混合物を 6 時間にわたって窒素下で還流させた。次に、反応混合物をろ過した。ろ液を濃縮し、再結晶化によって精製したところ、化合物 5 (8.8 g、収率：67%) が得られた。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) (ppm) : 3.81 (s, 3H), 5.00 (s, 2H), 6.91 (d, 2H), 7.30 (d, 2H), 7.37 (s, 1H), 8.03 (s, 1H).

【0345】

工程 E：化合物 6 の調製

120 ml のエタノール中の化合物 5 (10 g、35 mmol) と、Pd(OAc)₂ (158 mg、0.7 mmol) と、dppf (975 mg、1.8 mmol) と、Et₃N (10.2 g、70 mmol) との混合物を高圧容器に入れ、CO ガスを加えた。圧力を 20 バールで制御した。次に、反応混合物を 100 ~ 120 で 6 時間攪拌した。反応後、混合物をろ過した。ろ液を濃縮し、シリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、生成物 6 (6 g、収率：53%) が得られた。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) (ppm) : 1.31 (t, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.33 (q, 2H), 5.20 (s, 2H), 6.95 (d, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.78 (d, 1H), 8.36 (d, 1H).

【0346】

工程 F：化合物 7 の調製

化合物 6 (11 g、34.2 mmol) を DMF (60 ml) に溶解させ、次に、温度が 0 に低下されたとき、Et₃SnNa (5.75 g、68.4 mmol) を加えた。混合物を室温で 0.5 時間攪拌した後、それを水に注ぎ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を再結晶化によって精製したところ、化合物 7 (4.77 g、収率：61%) が得られた。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) (ppm) : 1.33 (t, 3H), 1.40

10

20

30

40

50

(t , 3 H)、2 . 8 3 (q , 2 H)、3 . 7 9 (s , 3 H)、4 . 4 2 (q , 2 H)、5 . 0 9 (s , 3 H)、6 . 9 0 (d , 2 H)、7 . 1 1 (s , 1 H)、7 . 3 2 (d , 2 H)、8 . 1 6 (s , 1 H) .

【 0 3 4 7 】

工程 G : 化合物 8 の調製

9 0 m l の水および9 0 m l のT H F 中の化合物 7 (1 0 . 6 4 g、3 0 . 6 6 m m o 1)と、N a O H (3 . 6 7 g、9 2 m m o 1)との混合物を周囲温度で1 6 時間攪拌した。次に、反応混合物を希塩酸に注ぎ、酢酸エチルで3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を再結晶化によって精製したところ、生成物 8 (9 g、収率：9 2 %)が得られた。¹H N M R (4 0 0 M H z、C D C l₃) (p p m) : 1 . 3 6 (t , 3 H)、2 . 8 5 (q , 2 H)、3 . 8 0 (s , 3 H)、5 . 1 2 (s , 2 H)、6 . 9 2 (d , 2 H)、7 . 1 4 (s , 1 H)、7 . 3 3 (d , 2 H)、7 . 9 9 (s , 1 H)、1 0 . 9 8 (s , 1 H) .

【 0 3 4 8 】

工程 H : 化合物 9 の調製

5 0 m l のピリジン中のN 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 , 4 - ジアミン (國際公開第2 0 1 5 0 0 0 7 1 5 号において調製される、2 . 5 g、1 5 . 6 m m o 1)と、化合物 8 (5 g、1 5 . 6 m m o 1)と、E D C . H C l (3 . 3 g、1 7 . 2 m m o 1)との混合物を1 6 時間にわたって還流させた。次に、混合物を濃縮し、酢酸エチルで希釈し、N a H C O₃飽和溶液で3 回洗浄した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。1 0 0 m l の酢酸中の粗生成物を一晩還流させた。次に、混合物を濃縮し、N a₂C O₃飽和溶液を加えて、P H 値を弱アルカリ性に調整した。混合物溶液を酢酸エチルで3 回希釈し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、生成物 9 (1 . 9 3 g、収率：3 5 %)が得られた。¹H N M R (4 0 0 M H z、D M S O - d 6) (p p m) : 1 . 1 8 (t , 3 H)、2 . 9 1 (q , 2 H)、3 . 9 3 (s , 3 H)、7 . 3 0 (s , 1 H)、8 . 0 8 (s , 1 H)、8 . 1 9 (s , 1 H)、9 . 1 5 (s , 1 H)、1 0 . 7 0 (s , 1 H) . ¹⁹F - N M R (3 0 0 M z、C D C l₃) : - 6 4 . 3 5 (s , 3 F) .

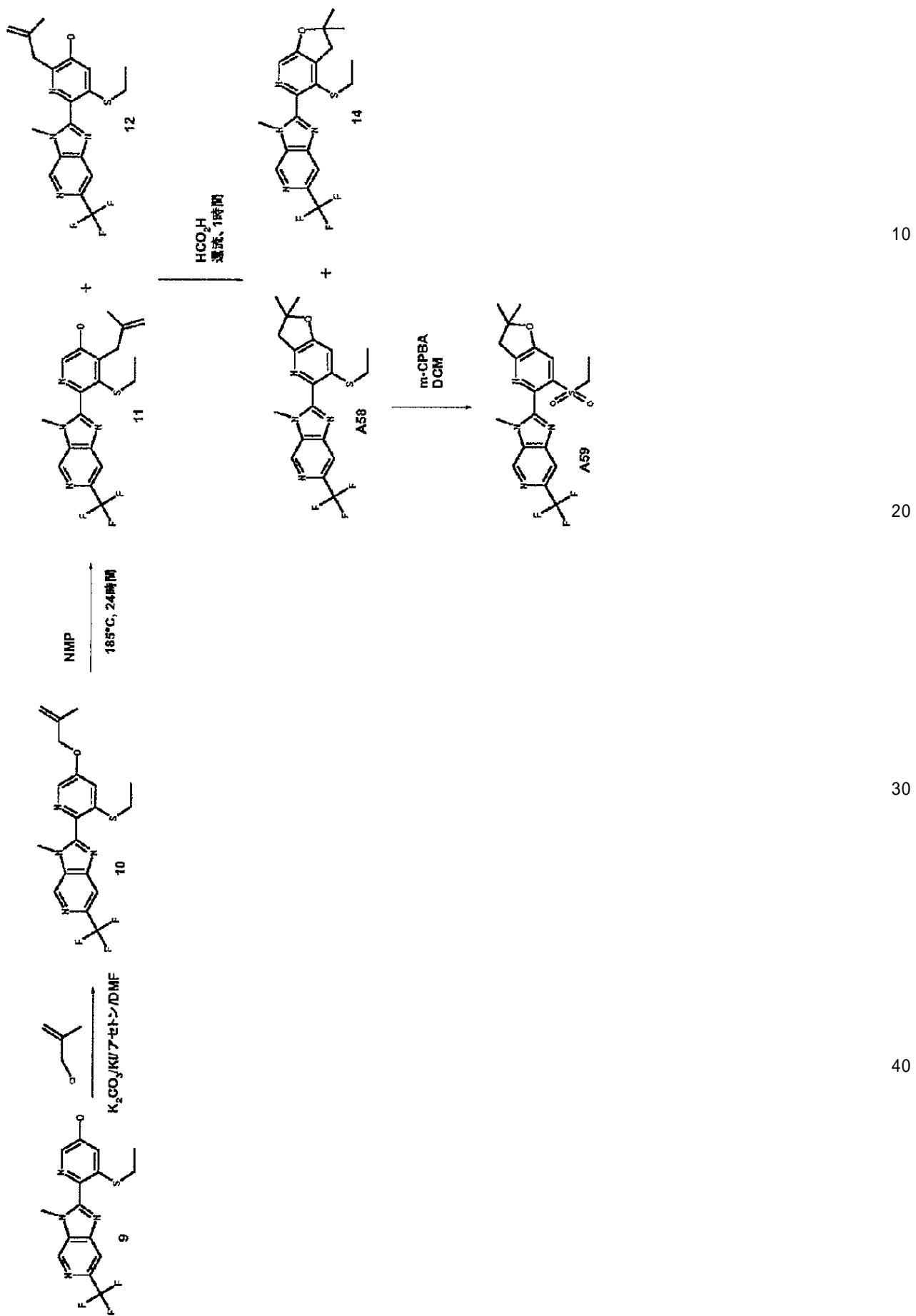
【 0 3 4 9 】

10

20

30

【化168】



工程 I : 化合物 10 の調製

4 m l のアセトンおよび1 m l のD M F 中の化合物9(1 mmol、354 mg)、メチルアリルクロリド(109 mg、1.2 mmol)、K₂CO₃(0.8 mmol、110 mg)、およびKI(0.012 mmol、2 mg)を8時間にわたって還流させた。次に、混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、生成物10(240 mg、収率：58%)が得られた。¹H NMR(400 MHz、CDCl₃) (ppm) : 1.33(t, 3H)、1.85(s, 3H)、2.91(q, 2H)、4.02(s, 3H)、4.59(s, 2H)、5.10(d, 2H)、5.27(s, 1H)、7.25(d, 1H)、8.15(s, 1H)、8.19(d, 1H)、8.90(s, 1H). ¹⁹F-NMR(300 MHz、CDCl₃) : -66.33(s, 3F).

【0350】

工程J：化合物A58の調製

10 m l のNMP中の化合物10(3.1 mmol、0.83 g)を24時間にわたって185℃で窒素下において攪拌した。次に、混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。10 m l のHCO₂H中の粗生成物を1時間にわたって還流させた。次に、混合物溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、生成物A58(100 mg、収率：12%)および副生成物14(41 mg、収率：5%)が得られた。

【0351】

化合物A58：¹H NMR(400 MHz、CDCl₃) (ppm) : 1.27(t, 3H)、1.57(s, 6H)、2.85(q, 2H)、3.15(s, 2H)、3.94(s, 3H)、7.08(s, 1H)、8.14(s, 1H)、8.90(s, 1H). ¹⁹F-NMR(300 MHz、CDCl₃) : -70.7(s, 3F). 化合物13を91%の純度で単離し、さらに精製せずに次の工程に使用した。

【0352】

化合物14(副生成物)：¹H NMR(400 MHz、CDCl₃) (ppm) : 1.10(t, 3H)、1.57(s, 6H)、2.68(q, 2H)、3.19(s, 2H)、3.88(s, 3H)、8.12(s, 1H)、8.13(s, 1H)、8.90(s, 1H). ¹⁹F-NMR(300 MHz、CDCl₃) : -70.7(s, 3F).

【0353】

工程J：化合物A59の調製。

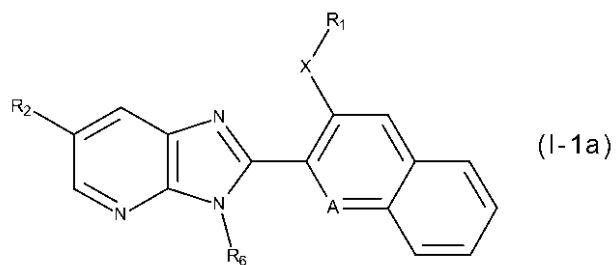
10 m l のDCM中の化合物A58(0.24 mmol、100 mg)およびm-CPBA(0.87 mmol、150 mg)を周囲温度で4時間攪拌した。次に、混合物をNaHCO₃の飽和溶液および水中のNa₂SO₃に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上のカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題生成物(70 mg、収率：66%)が得られた。¹H NMR(400 MHz、CDCl₃) (ppm) : 1.31(t, 3H)、1.62(s, 6H)、3.26(s, 2H)、3.60(q, 2H)、3.83(s, 3H)、7.66(s, 1H)、8.08(s, 1H)、8.94(s, 1H); ¹⁹F-NMR(300 MHz、CDCl₃) : -71.61(s, 3F).

【0354】

表5：

この表は、式I-1a:

【化169】



10

の化合物を開示する。

【0355】

【表19】

| 化合物番号 | X | R ₁ | R ₂ | A | R ₆ |
|---------------|-----------------|----------------------------------|-----------------|----|-----------------|
| A1 (1.001) | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH ₃ |
| A2 (1.002) | SO | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH ₃ |
| A3 (1.003) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH ₃ |
| A4 (1.004) | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | CH ₃ |
| A5 (1.005) | SO | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | CH ₃ |
| A6 (1.006) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | CH ₃ |

20

30

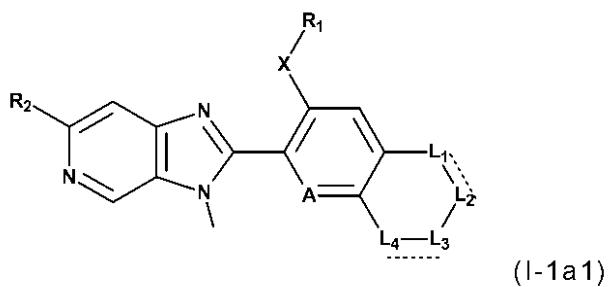
【0356】

表6：

この表は、式I-1a1：

40

【化170】



の化合物を開示する。

【0357】

【表 20 - 1】

| 化合物番号 | X | R ₁ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|----------------|-----------------|----------------------------------|-----------------|----|-------------------|--------------------------------|-------------------|----------------|
| A7 (2.094) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | NH | C-CF ₃ | N | - |
| A8 (2.126) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | - |
| A9 (2.114) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A10 (2.102) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | NH | C-H | N | - |
| A11 (2.118) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | C-H | N-CH ₃ | - |
| A12 (2.106) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-H | N | - |
| A13 (2.098) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | NH | C-CH ₃ | N | - |
| A14 (2.122) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | C-CH ₃ | N-CH ₃ | - |
| A15 (2.110) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CH ₃ | N | - |
| A16 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | NH | C-Ph | N | - |
| A17 (2.046) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | NH | N | N | - |
| A18 (2.042) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | S | N | - |
| A19 (2.086) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | S | C-CH ₃ | N | - |
| A20 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | CH | CH | N |
| A25 (2.021) | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH | N | CH | CH |
| A26 (2.022) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH | N | CH | CH |
| A27 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH | N ⁺ -O ⁻ | CH | CH |
| A28 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | CH | C-CF ₃ | N |
| A29 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | C-CF ₃ | CH | N |
| A30 (2.070) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | CH | S | - |
| A31 (2.078) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | C-CF ₃ | S | - |
| A32 (2.128) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | N | C-CF ₃ | N-CH ₃ | - |

10

20

30

40

【表 20 - 2】

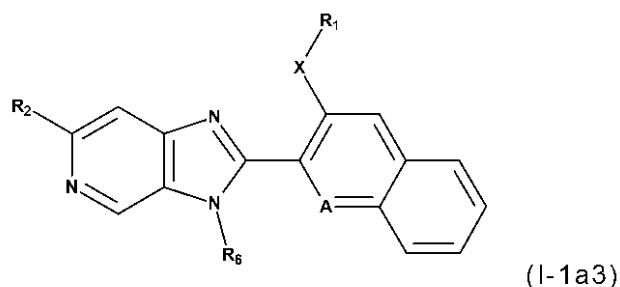
| 化合物番号 | X | R ₁ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|----------------|-----------------|----------------------------------|-----------------|----|-------------------|----------------------------------|-------------------|----------------|
| A33 (2.116) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A34 (2.096) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | NH | C-CF ₃ | N | - |
| A35 (2.054) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | N | N-CH ₃ | - |
| A36 (2.058) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | N | N | - |
| A37 (2.050) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | N-CH ₃ | N | - |
| A38 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N | C-SH | S | - |
| A39 (2.113) | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A58 | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | O | C(CH ₃) ₂ | CH ₂ | - |
| A59 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | O | C(CH ₃) ₂ | CH ₂ | - |

【0358】

表 7 :

この表は、式 I - 1 a 3 :

【化171】



の化合物を開示する。

【0359】

10

20

30

40

【表 2 1】

| 化合物番号 | X | R ₁ | R ₂ | A | R ₆ |
|----------------|-----------------|----------------------------------|-----------------|----|-----------------|
| A21 (2.004) | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | CH ₃ |
| A22 (2.006) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | N | CH ₃ |
| A23 (2.001) | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH ₃ |
| A24 (2.003) | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | CH ₃ |

10

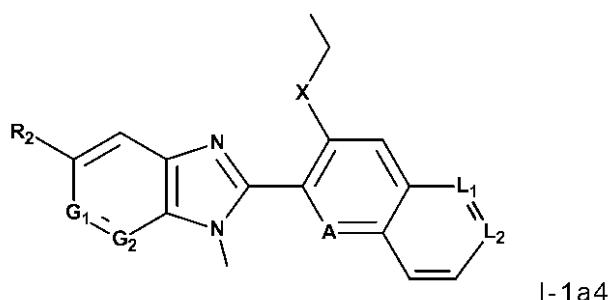
【0 3 6 0】

20

表 8 :

この表は、式 I - 1 a 4 :

【化 1 7 2】



30

の化合物を開示する。

【0 3 6 1】

【表 2 2 - 1】

| 化合物番号 | X | G ₁ | G ₂ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | 分析データ / 情報 |
|-------|-----------------|----------------|----------------|-----------------|---|----------------|----------------|---|
| A39 | S | N | CH | CF ₃ | N | CCl | CH | 実施例 P1 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、中間体 4 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.21, 423 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.309 (s, 1 H); 8.505 (s, 1 H); 8.341 (s, 1 H); 8.124 (d, 1 H); 7.955 (d, 1 H); 7.813 (dd, 1 H); 4.061 (s, 3 H); 3.183 (q, 2 H); 1.306 (t, 3 H)。 10 |
| A40 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CCl | CH | 実施例 P3 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、A39 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.10 455 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.328 (s, 1 H); 9.248 (d, 1 H); 8.349 (d, 1 H); 8.306 (m, 1 H); 8.193-8.117 (m, 2 H); 3.941 (s, 3 H); 3.915 (q, 2 H); 1.249 (t, 3 H)。 20 |
| A41 | S | N | CH | CF ₃ | N | CBr | CH | 実施例 P1 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、中間体 5 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.21, 469(MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.309 (s, 1 H); 8.452 (s, 1 H); 8.342 (d, 1 H); 8.174 - 8.112 (m, 2 H); 7.750 (dd, 1 H); 4.066 (s, 3 H); 3.173 (q, 2 H); 1.320 (t, 3 H)。 30 |
| A42 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CBr | CH | 実施例 P3 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、A41 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.09 501 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.327 (s, 1 H); 9.215 (s, 1 H); 8.331 (m, 3 H); 8.075 (dd, 1 H); 3.939 (s, 3 H); 3.917 (q, 2 H); 1.248 (t, 3 H)。 40 |

【表 2 2 - 2】

| 化合物番号 | X | G ₁ | G ₂ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | 分析データ / 情報 |
|-------|-----------------|----------------|----------------|-----------------|---|----------------|----------------|---|
| A43 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | C-シクロプロピル | CH | 実施例 P18: ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.570 (d, 1 H); 9.004 (s, 1 H); 8.137 (s, 1 H); 8.088 (dd, 1 H); 7.912 (dd; 1 H); 7.599 (d; 1 H); 3.943 (s, 3 H); 3.848 (q, 2 H); 2.497 (m; 1 H); 1.402 (t, 3 H); 1.241 (m; 2 H); 0.895 (m; 2 H)。 10 |
| A44 | S | N | CH | CF ₃ | N | CH | CBr | 実施例 P1 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、中間体 7 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.19, 469 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.294 (s, 1 H); 8.541 (s, 1 H); 8.383 (d, 1 H); 8.321 (d, 1 H); 8.041 (d, 1 H); 7.922 (dd; 1 H); 4.040 (s, 3 H); 3.112 (q, 2 H); 1.282 (t, 3 H)。 20 |
| A45 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CH | CBr | 実施例 P3 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、A44 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.11, 501(MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.320 (s, 2 H); 8.825 (d, 1 H); 8.331 (d, 1 H); 8.30-8.20 (m, 2 H); 3.925 (s, 3 H); 3.844 (q, 2 H); 1.228 (t, 3 H)。 30 |
| A46 | S | N | CH | CF ₃ | N | CH | CCl | 実施例 P1 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、中間体 6 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.18, 423 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.295 (s, 1 H); 8.546 (s, 1 H); 8.324 (s, 1 H); 8.219 (d, 1 H); 8.118 (d, 1 H); 7.815 (dd, 1 H); 4.043 (s, 3 H); 3.114 (q, 2 H); 1.284 (t, 3 H)。 40 |

【表 2 2 - 3】

| 化合物番号 | X | G ₁ | G ₂ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | 分析データ / 情報 |
|-------|-----------------|----------------|----------------|-----------------|---|----------------|----------------|--|
| A47 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CH | CCl | 実施例 P3 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、A46 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.10, 455 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.328 (s, 1 H); 9.324 (d, 1 H); 8.670 (d, 1 H); 8.331 (d, 1 H); 8.300 (d, 1 H); 8.158 (dd, 1 H); 3.927 (s, 3 H); 3.847 (q, 2 H); 1.230 (t, 3 H)。 10 |
| A48 | S | CH | N | CF ₃ | N | CH | CCl | 実施例 P1 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、中間体 6 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.28, 423 (MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 8.900 (dd, 1 H); 8.707 (dd, 1 H); 8.531 (s, 1 H); 8.212 (d, 1 H); 8.120 (d, 1 H); 8.707 (d, 1 H); 3.998 (s, 3 H); 3.120 (q, 2 H); 1.297 (t, 3 H)。 20 |
| A49 | SO ₂ | CH | N | CF ₃ | N | CH | CCl | 実施例 P3 に記載されるのと同様のプロトコルを用いて、A48 から調製された。LC-MS (方法 1) RT 1.17, 455(MH ⁺)。 ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.331 (s, 1 H); 8.925 (dd, 1 H); 8.717 (dd, 1 H); 8.668 (d, 1 H); 8.309 (d, 1 H); 8.156 (dd, 1 H); 3.888 (q, 2 H); 3.834 (s, 3 H); 1.244 (t, 3 H)。 30 |
| A50 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CH | CCN | ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.452 (s, 1 H); 9.332 (s, 1 H); 9.151 (s, 1 H); 8.433 (s, 1 H); 8.429 (s, 1 H); 8.48 (d, 1 H); 3.951 (s, 3 H); 3.880 (q, 2 H); 1.245 (t, 3 H)。 40 |

【表 2 2 - 4】

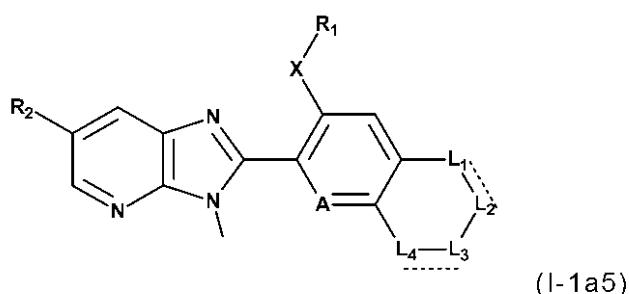
| 化合物番号 | X | G ₁ | G ₂ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | 分析データ / 情報 |
|-------|-----------------|----------------|----------------|-----------------|---|----------------|--------------------------------|--|
| A51 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CH | C-シクロプロピル | A43について記載されるように調製された: ¹ H NMR (300 MHz, DMSO) ppm 9.306 (s, 1 H); 9.152 (s, 1 H); 8.315 (d, 1 H); 8.171 (s, 1 H); 8.154 (d, 1 H); 7.882 (dd, 1 H); 3.904 (s, 3 H;) 3.818 (q, 2 H); 2.254 (m; 1 H; 1.242-0.80 (m; 7 H)。 |
| A52 | SO ₂ | N | CH | CF ₃ | N | CH | CC ₂ F ₅ | ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 1.39 - 1.42 (m, 3 H) 3.90 (q, J=7.34 Hz, 2 H) 3.95 - 4.01 (m, 3 H) 8.11 - 8.23 (m, 2 H) 8.37 - 8.50 (m, 2 H) 9.04 (s, 1 H) 9.21 (s, 1 H)。 |

【0362】

表9:

この表は、式 I - 1 a 5 :

【化173】



の化合物を開示する。

【0363】

10

20

30

【表 2 3】

| 化合物番号 | X | R ₁ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ |
|-------|-----------------|----------------------------------|----------------------|----|-------------------|-------------------|----------------|----------------|
| A53 | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A54 | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ S | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A55 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A56 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ S | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |
| A57 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ S(O) | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - |

10

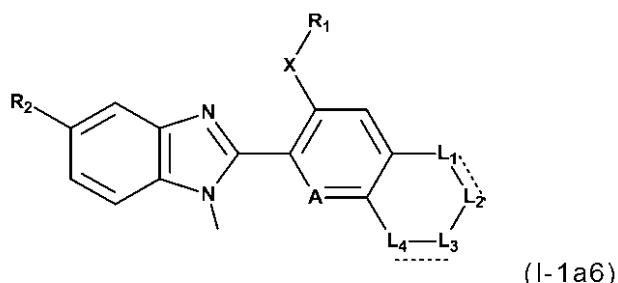
【0 3 6 4】

表 1 0 :

20

この表は、式 I - 1 a 6 :

【化 1 7 4】



30

の化合物を開示する。

【0 3 6 5】

【表 2 4】

| 化合物番号 | X | R ₁ | R ₂ | A | L ₁ | L ₂ | L ₃ | L ₄ | 分析データ / 情報 |
|-------|-----------------|----------------------------------|-----------------|----|-------------------|-------------------|----------------|----------------|---|
| A60 | S | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - | N1-メチル-4-(トリフルオロメチル)ベンゼン-1,2-ジアミン(市販されている)および中間体8を用いて、A39(実施例P4b)について記載されるように調製された: ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.14 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.62 (dd, 1 H), 7.56 (s, 1 H), 7.51 (d, 1 H), 4.02 (s, 3 H), 3.65 (s, 3 H), 2.85 (q, 2 H), 1.22 (t, 3 H)。 10 |
| A61 | SO ₂ | -CH ₂ CH ₃ | CF ₃ | CH | N-CH ₃ | C-CF ₃ | N | - | A9(実施例P3、工程C)について記載されるように A60 から調製された: ¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ ppm 8.42 (s, 1 H), 8.08 (s, 1 H), 8.03 (s, 1 H), 7.64 (dd, 1 H), 7.53 (d, 1 H), 4.15 (s, 3 H), 3.61 (s, 3 H), 3.55 (br. s., 2 H), 1.26 (t, 3 H)。 20 30 |

【0366】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的に、殺ダニ的に、および/または殺真菌的に活性な成分を加えることにより、かなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。式Iの化合物と、他の殺虫的に、殺ダニ的に、および/または殺真菌的に活性な成分との混合物が、より広い意味で、相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、昆虫がそれらの異なる発育段階で防除され得ること、あるいはそれらの製造中、例えば粉碎または混合中、それらの貯蔵中またはそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

【0367】

本明細書における活性成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の活性成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイドおよびバチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) 調製物。

【0368】

式Iの化合物と、活性成分との以下の混合物が好ましい(「TX」という略語は、「本発明の表1～10に記載される化合物からなる群から選択される1つの化合物」を意味す

40

50

る) :

石油(628) + TX からなる物質の群から選択される補助剤、
 1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(9
 10) + TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/ケミカル
 アブストラクト名)(1059) + TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチル
 アセドアミド(IUPAC名)(1295) + TX、4-クロロフェニルフェニルスルホ
 ナ(IUPAC名)(981) + TX、アバメクチン(1) + TX、アセキノシル(3)
 + TX、アセトプロール[CCN] + TX、アクリナトリン(9) + TX、アルジカルブ
 (16) + TX、アルドキシカルブ(863) + TX、-シペルメトリン(202) +
 TX、アミジチオン(870) + TX、アミドフルメト[CCN] + TX、アミドチオエ
 ート(872) + TX、アミトン(875) + TX、アミトンシュウ酸水素塩(875)
 + TX、アミトラズ(24) + TX、アラマイド(881) + TX、三酸化ニヒ素(88
 2) + TX、AVI 382(化合物コード) + TX、AZ 60541(化合物コード)
) + TX、アジンホス-エチル(44) + TX、アジンホス-メチル(45) + TX、ア
 ゾベンゼン(IUPAC名)(888) + TX、アゾシクロチン(46) + TX、アゾト
 エート(889) + TX、ベノミル(62) + TX、ベノキサホス[CCN] + TX、ベ
 ンゾキシメート(71) + TX、安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN] + TX、
 ビフェナゼート(74) + TX、ビフェントリン(76) + TX、ビナパクリル(907)
) + TX、プロフェンバレート + TX、プロモシクレン(918) + TX、プロモホス
 (920) + TX、プロモホス-エチル(921) + TX、プロモプロピレート(94)
 + TX、ブプロフェジン(99) + TX、ブトカルボキシム(103) + TX、ブトキシ
 カルボキシム(104) + TX、ブチルピリダベン + TX、多硫化カルシウム(IUPA
 C名)(111) + TX、カンフェクロル(941) + TX、カーバノレート(943)
 + TX、カルバリル(115) + TX、カルボフラン(118) + TX、カルボフェノチ
 オン(947) + TX、CGA 50'439(開発コード)(125) + TX、キノメ
 チオナト(126) + TX、クロルベンシド(959) + TX、クロルジメホルム(96
 4) + TX、クロルジメホルム塩酸塩(964) + TX、クロルフェナビル(130)
 + TX、クロルフェネトール(968) + TX、クロルフェンソン(970) + TX、クロ
 ルフェンスルフィド(971) + TX、クロルフェンビンホス(131) + TX、クロロ
 ベンジレート(975) + TX、クロロメブホルム(977) + TX、クロロメチウロン
 (978) + TX、クロロプロピレート(983) + TX、クロルピリホス(145) +
 TX、クロルピリホス-メチル(146) + TX、クロルチオホス(994) + TX、シ
 ネリンI(696) + TX、シネリンII(696) + TX、シネリン(696) + TX
 、クロフェンテジン(158) + TX、クロサンテル[CCN] + TX、クマホス(17
 4) + TX、クロタミトン[CCN] + TX、クロトキシホス(1010) + TX、クフ
 ラネブ(1013) + TX、シアントエート(1020) + TX、シフルメトフェン(C
 AS登録番号:400882-07-7) + TX、シハロトリソ(196) + TX、シヘ
 キサチン(199) + TX、シペルメトリン(201) + TX、DCPM(1032) +
 TX、DDT(219) + TX、デメフィオン(1037) + TX、デメフィオン-O(1037)
 + TX、デメフィオン-S(1037) + TX、デメトン(1038) + TX
 、デメトン-メチル(224) + TX、デメトン-O(1038) + TX、デメトン-O
 -メチル(224) + TX、デメトン-S(1038) + TX、デメトン-S-メチル(224)
 + TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039) + TX、ジアフェンチウロ
 ン(226) + TX、ジアリホス(1042) + TX、ジアジノン(227) + TX、ジ
 クロフルアニド(230) + TX、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス+ TX、
 ジコホル(242) + TX、ジクロトホス(243) + TX、ジエノクロル(1071)
 + TX、ジメホックス(1081) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジナクチン
 (653) + TX、ジネクックス(1089) + TX、ジネクス-ジクレキシン(1089)
 + TX、ジノブトン(269) + TX、ジノカップ(270) + TX、ジノカップ-4 [C
 CN] + TX、ジノカップ-6 [CCN] + TX、ジノクトン(1090) + TX、ジ
 50

ノペントン(1092) + TX、ジノスルホン(1097) + TX、ジノテルボン(1098) + TX、ジオキサチオン(1102) + TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1103) + TX、ジスルフィラム[CCN] + TX、ジスルホトン(278) + TX、DNOCl(282) + TX、ドフェナビン(1113) + TX、ドラメクチン[CCN] + TX、エンドスルファン(294) + TX、エンドチオン(1121) + TX、EPN(297) + TX、エプリノメクチン[CCN] + TX、エチオン(309) + TX、エトエート-メチル(1134) + TX、エトキサゾール(320) + TX、エトリムホス(1142) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェナザキン(328) + TX、酸化フェンブタスズ(330) + TX、フェノチオカルブ(337) + TX、フェンプロパトリン(342) + TX、フェンピラド + TX、フェンピロキシメート(345) + TX、フェンソン(1157) + TX、フェントリファニル(1161) + TX、フェンバレレート(349) + TX、フィプロニル(354) + TX、フルアクリピリム(360) + TX、フルアズロン(1166) + TX、フルベンジミン(1167) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシリトリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルオルベンシド(1174) + TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC 1137(開発コード)(1185) + TX、ホルメタネート(405) + TX、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムバラネート(1193) + TX、-HCH(430) + TX、グリオジン(1205) + TX、ハルフェンプロックス(424) + TX、ヘプテノホス(432) + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1216) + TX、ヘキシチアゾクス(441) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、イソカルボホス(473) + TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473) + TX、イベルメクチン[CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ヨードフェンホス(1248) + TX、リンダン(430) + TX、ルフェヌロン(490) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX、メカルバム(502) + TX、メホスホラン(1261) + TX、メスルフェン[CCN] + TX、メタクリホス(1266) + TX、メタミドホス(527) + TX、メチダチオン(529) + TX、メチオカルブ(530) + TX、メトミル(531) + TX、臭化メチル(537) + TX、メトルカルブ(550) + TX、メビンホス(556) + TX、メキサカルベート(1290) + TX、ミルベメクチン(557) + TX、ミルベマイシンオキシム[CCN] + TX、ミパホックス(1293) + TX、モノクロトホス(561) + TX、モルホチオン(1300) + TX、モキシデクチン[CCN] + TX、ナレド(567) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、NC-512(化合物コード) + TX、ニフルリジド(1309) + TX、ニコマイシン[CCN] + TX、ニトリラカルブ(1313) + TX、ニトリラカルブ1 : 1 塩化亜鉛錯体(1313) + TX、NNI-0101(化合物コード) + TX、NNI-0250(化合物コード) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(602) + TX、オキシデプロホス(1324) + TX、オキシジスルホトン(1325) + TX、pp' - DDT(219) + TX、バラチオン(615) + TX、ペルメトリン(626) + TX、石油(628) + TX、フェンカプトン(1330) + TX、フェントエート(631) + TX、ホレート(636) + TX、ホサロン(637) + TX、ホスホラン(1338) + TX、ホスマット(638) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホキシム(642) + TX、ピリミホス-メチル(652) + TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347) + TX、ポリナクチン(653) + TX、プロクロノール(1350) + TX、プロフェノホス(662) + TX、プロマシル(1354) + TX、プロパルギット(671) + TX、プロペタンホス(673) + TX、プロポクサー(678) + TX、プロチダチオン(1360) + TX、プロトエート(1362) + TX、ピレトリンI(696) + TX、ピレトリンII(696) + TX、ピリダベン(699) + TX、
10
20
30
40
50

ピリダフェンチオン(701) + TX、ピリミジフェン(706) + TX、ピリミテート(1370) + TX、キナルホス(711) + TX、キンチオキス(1381) + TX、R - 1492(開発コード)(1382) + TX、RA - 17(開発コード)(1383) + TX、ロテノン(722) + TX、シュラーダン(1389) + TX、セブホス + TX、セラメクチン[CCN] + TX、SI - 0009(化合物コード) + TX、ソファミド(1402) + TX、スピロジクロフェン(738) + TX、スピロメシフェン(739) + TX、SSI - 121(開発コード)(1404) + TX、スルフィラム[CCN] + TX、スルフルアミド(750) + TX、スルホテップ(753) + TX、硫黄(754) + TX、SZI - 121(開発コード)(757) + TX、 -フルバリネット(398) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、TEPP(1417) + TX、テルバム + TX、テトラクロルビンホス(777) + TX、テトラジホン(786) + TX、テトラナクチン(653) + TX、テトラスル(1425) + TX、チアフェノックス + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオファノックス(800) + TX、チオメトン(801) + TX、チオキノックス(1436) + TX、ツリンギエンシン[CCN] + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアラテン(1443) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリナクチン(653) + TX、バミドチオン(847) + TX、バニリプロール[CCN]およびYI - 5302(化合物コード) + TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤。 10

ベトキサジン[CCN] + TX、ジオクタン酸銅(IUPAC名)(170) + TX、硫酸銅(172) + TX、シブトリン[CCN] + TX、ジクロン(1052) + TX、ジクロロフェン(232) + TX、エンドタール(295) + TX、フェンチン(347) + TX、消石灰[CCN] + TX、ナーバム(566) + TX、キノクラミン(714) + TX、キノナミド(1379) + TX、シマジン(730) + TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347) + TXからなる物質の群から選択される殺藻剤。 20

アバメクチン(1) + TX、クルホマート(1011) + TX、ドラメクチン[CCN] + TX、エマメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、エブリノメクチン[CCN] + TX、イベルメクチン[CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム[CCN] + TX、モキシデクチン[CCN] + TX、ピペラジン[CCN] + TX、セラメクチン[CCN] + TX、スピノサド(737)およびチオファネート(1435) + TXからなる物質の群から選択される駆虫剤。 30

クロラロース(127) + TX、エンドリン(1122) + TX、フェンチオン(346) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)およびストリキニーネ(745) + TXからなる物質の群から選択される殺鳥剤。

1 - ヒドロキシ - 1H - ピリジン - 2 - チオン(IUPAC名)(1222) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748) + TX、8 - ヒドロキシキノリン硫酸塩(446) + TX、プロノポール(97) + TX、ジオクタン酸銅(IUPAC名)(170) + TX、水酸化銅(IUPAC名)(169) + TX、クレゾール[CCN] + TX、ジクロロフェン(232) + TX、ジビリチオン(1105) + TX、ドジシン(1112) + TX、フェナミノスルフ(1144) + TX、ホルムアルdehyド(404) + TX、ヒドラルガフェン[CCN] + TX、カスガマイシン(483) + TX、塩酸カスガマイシン水和物(483) + TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)(IUPAC名)(1308) + TX、ニトラビル(580) + TX、オクチリノン(590) + TX、オキソリン酸(606) + TX、オキシテトラサイクリン(611) + TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩(446) + TX、プロベナゾール(658) + TX、ストレプトマイシン(744) + TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン(744) + TX、テクロフタラム(766) + TX、およびチオメルサール[CCN] + TXからなる物質の群から選択される殺菌剤。 40

コカクモンハマキ(Adoxophyes orana)GV(12) + TX、アグロ 50

バクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) (13) + TX、ムチカブリダニ属 (*Amblyseius spp.*) (19) + TX、アナグラファ・ファルシフェラ (*Anagrapha falcifera*) NPY (28) + TX、アナグルス・アトムス (*Anagrus atomus*) (29) + TX、アフェリヌス・アブドミナリス (*Aphelinus abdominalis*) (33) + TX、アフィジウス・コレマニ (*Aphidius colemani*) (34) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (35) + TX、オートグラファ・カリフォルニカ (*Autographa californica*) NPY (38) + TX、バチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) (48) + TX、バチルス・スフェリクス・ネイデ (*Bacillus sphaericus Neide*) (学名) (49) + TX、バチルス・チューリングンシス・ベルリナー (*Bacillus thuringiensis Berliner*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亜種イスラエンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亜種クルスターイ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) (53) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniartii*) (54) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (151) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (178) + TX、コドリンガ (*Cydia pomonella*) GV (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacus sibirica*) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクトツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPY (431) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) および H. メギディス (*H. megidis*) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (442) + TX、レプトマスティクス・ダクチロビィ (*Leptomastix dactylopii*) (488) + TX、マクロロフス・カリギノスス (*Macrolophus caliginosus*) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPY (494) + TX、メタフィカス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (522) + TX、メタリジウム・アニソブリエ変種アクリヅム (*Metarhizium anisopliae var. acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウム・アニソブリエ変種アニソブリエ (*Metarhizium anisopliae var. anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPY および N. レコンティ (*N. lecontei*) NPY (575) + TX、オリウス属 (*Orius spp.*) (596) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (644) + TX、シロイチモジョトウ (*Spodoptera exigua*) 多力ブシド核多角体病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (742) + TX、スタイナーネマ・カルボカブサエ (*St 10*

20

30

40

50

einerinema carpopcapsae) (742) + TX、スタイナー・ネマ・フェルティニアエ(Steinerinema feltiae) (742) + TX、スタイナー・ネマ・グラッセリ(Steinerinema glaseri) (742) + TX、スタイナー・ネマ・リオブラベ(Steinerinema riobrave) (742) + TX、スタイナー・ネマ・リオブラビス(Steinerinema riobravis) (742) + TX、スタイナー・ネマ・スカプテリシ(Steinerinema scapterisci) (742) + TX、スタイナー・ネマ属(Steinerinema spp.) (742) + TX、トリコグラムマ属(*Trichogramma* spp.) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス(*Typhlodromus occidentalis*) (844) およびバーティシリウム・レカニ(Verticillium lecanii) (848) + TXからなる物質の群から選択される生物剤、ヨードメタン(IUPAC名)(542)および臭化メチル(537) + TXからなる物質の群から選択される土壤滅菌剤、

アフォレート[CCN] + TX、ビサジル[CCN] + TX、ブルファン[CCN] + TX、ジフルベンズロン(250) + TX、ジマチフ[CCN] + TX、ヘメル[CCN] + TX、ヘンパ[CCN] + TX、メテパ[CCN] + TX、メチオテパ[CCN] + TX、メチルアフォレート[CCN] + TX、モルジド[CCN] + TX、ペンフルロン[CCN] + TX、テパ[CCN] + TX、チオヘンパ[CCN] + TX、チオテパ[CCN] + TX、トレタミン[CCN] およびウレデパ[CCN] + TXからなる物質の群から選択される不妊化剤、

(E)-デカ-5-エン-1-イルアセテートおよび(E)-デカ-5-エン-1-オール(IUPAC名)(222) + TX、(E)-トリデカ-4-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(829) + TX、(E)-6-メチルヘプタ-2-エン-4-オール(IUPAC名)(541) + TX、(E, Z)-テトラデカ-4, 10-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(779) + TX、(Z)-ドデカ-7-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(285) + TX、(Z)-ヘキサデカ-11-エナール(IUPAC名)(436) + TX、(Z)-ヘキサデカ-11-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(437) + TX、(Z)-ヘキサデカ-13-エン-11-イン-1-イルアセテート(IUPAC名)(438) + TX、(Z)-イコス-13-エン-10-オン(IUPAC名)(448) + TX、(Z)-テトラデカ-7-エン-1-アール(IUPAC名)(782) + TX、(Z)-テトラデカ-9-エン-1-オール(IUPAC名)(783) + TX、(Z)-テトラデカ-9-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(784) + TX、(7E, 9Z)-ドデカ-7, 9-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(283) + TX、(9Z, 11E)-テトラデカ-9, 11-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(780) + TX、(9Z, 12E)-テトラデカ-9, 12-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(781) + TX、14-メチルオクタデカ-1-エン(IUPAC名)(545) + TX、4-メチルノナン-5-オールおよび4-メチルノナン-5-オン(IUPAC名)(544) + TX、-マルチストリアチン[CCN] + TX、ブレビコミン[CCN] + TX、コドレルア[CCN] + TX、コドレモン(167) + TX、キュールア(179) + TX、ディスパールア(277) + TX、ドデカ-8-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(286) + TX、ドデカ-9-エン-1-イルアセテート(IUPAC名)(287) + TX、ドデカ-8+TX、10-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名)(284) + TX、ドミニカルア[CCN] + TX、4-メチルオクタン酸エチル(IUPAC名)(317) + TX、オイゲノール[CCN] + TX、フロンタリン[CCN] + TX、ゴシップルア(420) + TX、グランドルア(421) + TX、グランドルアI(421) + TX、グランドルアII(421) + TX、グランドルアIII(421) + TX、グランドルアIV(421) + TX、ヘキサルア[CCN] + TX、イブスジエノール[CCN] + TX、イブセノール[CCN] + TX、ジャポニルア(481) + TX、リネアチン[CCN] + TX、リトルア[CCN] + TX、ループルア[CC]

10

20

30

40

50

N] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 [CCN] + TX、メチルオイゲノール (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルフルラルア [CCN] + TX、オリクタルア (317) + TX、オストラモン [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (736) + TX、スルカトール [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルアA (839) + TX、トリメドルアB₁ (839) + TX、トリメドルアB₂ (839) + TX、トリメドルアC (839) およびトランク - コール (trunc - call) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

2 - (オクチルチオ)エタノール (IUPAC名) (591) + TX、ブトピロノキシリル (933) + TX、ブトキシ (ポリプロピレングリコール) (936) + TX、アジピン酸ジブチル (IUPAC名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX、コハク酸ジブチル (IUPAC名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN] + TX、ジメチルカルベート [CCN] + TX、フタル酸ジメチル [CCN] + TX、エチルヘキサンジオール (1137) + TX、ヘキサアミド [CCN] + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート [CCN] およびピカリジン [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫忌避剤、

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) エタン (IUPAC名) (1056) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン および 1, 3 - ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1 - プロモ - 2 - クロロエタン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) エチルアセテート (IUPAC名) (1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート (IUPAC名) (1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1109) + TX、2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (935) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1084) + TX、2 - (4 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC名) (986) + TX、2 - クロロビニルジエチルホスフェート (IUPAC名) (984) + TX、2 - イミダゾリドン (IUPAC名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC名) (1246) + TX、2 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノフェニルメチルカルバメート (IUPAC名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチルラウレート (IUPAC名) (1433) + TX、3 - プロモ - 1 - クロロプロパ - 1 - エン (IUPAC名) (917) + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート (IUPAC名) (1283) + TX、4 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (IUPAC名) (1285) + TX、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート (IUPAC名) (1085) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセフェート (2) + TX、アセタミプリド (4) + TX、アセチオン [CCN] + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUPAC名) (861) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシカルブ (863) + TX、アルドリン (864) + TX、アレトリン (17) + TX、アロサミジン [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、 - シペルメトリン (202) + TX、 - エクジソン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX

X、アミジチオン(870)+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミノカルブ(873)+TX、アミトン(875)+TX、アミトンシュウ酸水素塩(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アナバシン(877)+TX、アチダチオン(883)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アザジラクチン(41)+TX、アザメチホス(42)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾトエート(889)+TX、バチルス・チューリゲンシス(*Bacillus thuringiensis*)デルタエンドトキシン(52)+TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム[CCN]+TX、多硫化バリウム(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(892)+TX、バルトリン[CCN]+TX、Bayer 22/190(開発コード)(893)+TX、Bayer 22408(開発コード)(894)+TX、ベンジオカルブ(58)+TX、ベンフラカルブ(60)+TX、ベンスルタップ(66)+TX、-シフルトリノ(194)+TX、-シペルメトリン(203)+TX、ビフェントリン(76)+TX、ビオアレトリン(78)+TX、ビオアレトリンS-シクロペンテニル異性体(79)+TX、ビオエタノメトリン[CCN]+TX、ビオベルメトリン(908)+TX、ビオレスメトリン(80)+TX、ビス(2-クロロエチル)エーテル(IUPAC名)(909)+TX、ビストリフルロン(83)+TX、ホウ砂(86)+TX、プロフェンバレート+TX、プロムフェンビンホス(914)+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモ-DDT[CCN]+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホス-エチル(921)+TX、ブフェンカルブ(924)+TX、ブプロフェジン(99)+TX、ブタカルブ(926)+TX、ブタチオホス(927)+TX、ブトカルボキシム(103)+TX、ブトネート(932)+TX、ブトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン+TX、カズサホス(109)+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、シアノ化カルシウム(444)+TX、多硫化カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロル(941)+TX、カーバノレート(943)+TX、カルバリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(945)+TX、四塩化炭素(IUPAC名)(946)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、カルボスルファン(119)+TX、カルタップ(123)+TX、カルタップ塩酸塩(123)+TX、セバジン(725)+TX、クロルビシクレン(960)+TX、クロルダン(128)+TX、クロルデコン(963)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルム塩酸塩(964)+TX、クロルエトキシホス(129)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェンビンホス(131)+TX、クロルフルアズロン(132)+TX、クロルメホス(136)+TX、クロロホルム[CCN]+TX、クロロビクリン(141)+TX、クロルホキシム(989)+TX、クロルプラゾホス(990)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、クロマフェノジド(150)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリン(696)+TX、シス-レスメトリン+TX、シスメトリン(80)+TX、クロシトリン+TX、クロエトカルブ(999)+TX、クロサンテル[CCN]+TX、クロチアニジン(165)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、ヒ酸銅[CCN]+TX、オレイン酸銅[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クミトエート(1006)+TX、クロタミトン[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クルホマート(1011)+TX、氷晶石(177)+TX、CS 708(開発コード)(1012)+TX、シアノフェンホス(1019)+TX、シアノホス(184)+TX、シアントエート(1020)+TX、シクレトリノ[CCN]+TX、シクロプロトリノ(188)+TX、シフルトリノ(193)+TX、シハロトリノ(196)+TX、シペルメトリン(201)+TX、シフェノトリノ(206)+TX、シロマジン(209)+TX、サイチオアート[CCN]+TX、d-リモネン[CCN]+TX、d-テトラメトリン(788)+TX、DAEP(1031)+TX、ダゾメット(216)+TX、DDT(219)+TX、デカルボフラン(110)

034) + TX、デルタメトリン(223) + TX、デメフィオン(1037) + TX、
 デメフィオン-O(1037) + TX、デメフィオン-S(1037) + TX、デメトン
 (1038) + TX、デメトン-メチル(224) + TX、デメトン-O(1038) +
 TX、デメトン-O-メチル(224) + TX、デメトン-S(1038) + TX、デメ
 トン-S-メチル(224) + TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039) + TX
 10、ジアフェンチウロン(226) + TX、ジアリホス(1042) + TX、ジアミダホス
 (1044) + TX、ジアジノン(227) + TX、ジカブチオン(1050) + TX、
 ジクロフェンチオン(1051) + TX、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス +
 TX、ジクレシル[CCN] + TX、ジクロトホス(243) + TX、ジシクラニル(2
 44) + TX、ジエルドリン(1070) + TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3 -
 イルホスフェート(IUPAC名)(1076) + TX、ジフルベンズロン(250) +
 TX、ジロール[CCN] + TX、ジメフルトリン[CCN] + TX、ジメホックス(1
 081) + TX、ジメタン(1085) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジメト
 リン(1083) + TX、ジメチルビンホス(265) + TX、ジメチラン(1086)
 + TX、ジネクス(1089) + TX、ジネクス-ジクレキシン(1089) + TX、ジ
 ノプロプ(1093) + TX、ジノサム(1094) + TX、ジノセブ(1095) + T
 X、ジノテフラン(271) + TX、ジオフェノラン(1099) + TX、ジオキサベン
 ゾホス(1100) + TX、ジオキサカルブ(1101) + TX、ジオキサチオン(11
 02) + TX、ジスルホトン(278) + TX、ジチクロホス(1108) + TX、DN
 OC(282) + TX、ドラメクチン[CCN] + TX、DSP(1115) + TX、エ
 20 クジステロン[CCN] + TX、EI 1642(開発コード)(1118) + TX、エ
 マメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、EMPc(1
 120) + TX、エンペントリン(292) + TX、エンドスルファン(294) + TX
 、エンドチオン(1121) + TX、エンドリン(1122) + TX、EPBP(112
 3) + TX、EPN(297) + TX、エポフェノナン(1124) + TX、エプリノメ
 クチン[CCN] + TX、エスフェンバレート(302) + TX、エタホス[CCN]
 + TX、エチオフェンカルブ(308) + TX、エチオン(309) + TX、エチプロー
 ル(310) + TX、エトエート-メチル(1134) + TX、エトプロホス(312)
 + TX、ギ酸エチル(IUPAC名)[CCN] + TX、エチル-DDD(1056) +
 TX、二臭化工チレン(316) + TX、二塩化工チレン(化学名)(1136) + TX
 30 、エチレンオキシド[CCN] + TX、エトフェンプロックス(319) + TX、エトリ
 ムホス(1142) + TX、EXD(1143) + TX、ファンファー(323) + TX
 、フェナミホス(326) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェンクロルホ
 ス(1148) + TX、フェネタカルブ(1149) + TX、フェンフルトリン(115
 0) + TX、フェニトロチオン(335) + TX、フェノブカルブ(336) + TX、フ
 ェノキサクリム(1153) + TX、フェノキシカルブ(340) + TX、フェンピリ
 リン(1155) + TX、フェンプロパトリ(342) + TX、フェンピラド + TX、
 フェンスルホチオン(1158) + TX、フェンチオン(346) + TX、フェンチオン
 -エチル[CCN] + TX、フェンバレート(349) + TX、フィプロニル(354)
) + TX、フロニカミド(358) + TX、フルベンジアミド(CAS登録番号: 272
 451-65-7) + TX、フルコフロン(1168) + TX、フルシクロクスロン(3
 66) + TX、フルシリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、
 フルフェネリム[CCN] + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルフェンブ
 ロックス(1171) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルバリネート(118
 4) + TX、FMC 1137(開発コード)(1185) + TX、ホノホス(1191)
) + TX、ホルメタネート(405) + TX、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホ
 ルモチオン(1192) + TX、ホルムバラネート(1193) + TX、ホスマチラン(1194) + TX、ホスピレート(1195) + TX、ホスチアゼート(408) + TX
 40
 、
 ホスチエタン(1196) + TX、フラチオカルブ(412) + TX、フレトリン(12
 50

7 4) + TX、O , O - ジエチルO - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン - 4 - イルホ
スホロチオエート (IUPAC名) (1075) + TX、O , O , O ' , O ' - テトラブ
ロピルジチオピロホスフェート (IUPAC名) (1424) + TX、オレイン酸 (IUPAC名) (593) + TX、オメトエート (594) + TX、オキサミル (602) +
TX、オキシデメトン - メチル (609) + TX、オキシデプロホス (1324) + TX
、オキシジスルホトン (1325) + TX、pp' - DDT (219) + TX、パラ - ジ
クロロベンゼン [CCN] + TX、パラチオン (615) + TX、パラチオン - メチル (616) + TX、ベンフルロン [CCN] + TX、ペンタクロロフェノール (623) +
TX、ラウリン酸ペントクロロフェニル (IUPAC名) (623) + TX、ペルメトリ
ン (626) + TX、石油 (628) + TX、PH 60 - 38 (開発コード) (132
8) + TX、フェンカプトン (1330) + TX、フェノトリン (630) + TX、フェ
ントエート (631) + TX、ホレート (636) + TX、ホサロン (637) + TX、
ホスホラン (1338) + TX、ホスマット (638) + TX、ホスニクロール (133
9) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスフィン (IUPAC名) (640)
+ TX、ホキシム (642) + TX、ホキシム - メチル (1340) + TX、ピリメタホ
ス (1344) + TX、ピリミカルブ (651) + TX、ピリミホス - エチル (1345
) + TX、ピリミホス - メチル (652) + TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性
体 (IUPAC名) (1346) + TX、ポリクロロテルペン (慣用名) (1347) +
TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、カリウムチオシアネート [CCN] + TX、ブ
ラレトリン (655) + TX、プレコセンI [CCN] + TX、プレコセンII [CCN
] + TX、プレコセンIII [CCN] + TX、プリミドホス (1349) + TX、プロ
フェノホス (662) + TX、プロフルトリノ [CCN] + TX、プロマシル (1354
) + TX、プロメカルブ (1355) + TX、プロバホス (1356) + TX、プロペタ
ンホス (673) + TX、プロポクサー (678) + TX、プロチダチオン (1360)
+ TX、プロチオホス (686) + TX、プロトエート (1362) + TX、プロトリフ
エンビュート [CCN] + TX、ピメトロジン (688) + TX、ピラクロホス (689
) + TX、ピラゾホス (693) + TX、ピレスメトリン (1367) + TX、ピレトリ
ンI (696) + TX、ピレトリノII (696) + TX、ピレトリノ (696) + TX
、ピリダベン (699) + TX、ピリダリル (700) + TX、ピリダフェンチオン (7
01) + TX、ピリミジフェン (706) + TX、ピリミテート (1370) + TX、ピ
リプロキシフェン (708) + TX、クアッシア [CCN] + TX、キナルホス (711
) + TX、キナルホス - メチル (1376) + TX、キノチオン (1380) + TX、キ
ンチオキス (1381) + TX、R - 1492 (開発コード) (1382) + TX、ラフ
オキサニド [CCN] + TX、レスメトリン (719) + TX、ロテノン (722) + T
X、RU 15525 (開発コード) (723) + TX、RU 25475 (開発コード)
(1386) + TX、リアニア (1387) + TX、リアノジン (慣用名) (1387
) + TX、サバジラ (725) + TX、シュラーダン (1389) + TX、セブホス + T
X、セラメクチン [CCN] + TX、SI - 0009 (化合物コード) + TX、SI - 0
205 (化合物コード) + TX、SI - 0404 (化合物コード) + TX、SI - 040
5 (化合物コード) + TX、シラフルオフェン (728) + TX、SN 72129 (開
発コード) (1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウ
ム (444) + TX、フッ化ナトリウム (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1
399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム (1400) + TX、ナトリウムペ
ンタクロロフェノキシド (623) + TX、セレン酸ナトリウム (IUPAC名) (140
1) + TX、ナトリウムチオシアネート [CCN] + TX、ソファミド (1402) + T
X、スピノサド (737) + TX、スピロメシフェン (739) + TX、スピロテトラマ
ト (CCN) + TX、スルコフロン (746) + TX、スルコフロン - ナトリウム (74
6) + TX、スルフルアミド (750) + TX、スルホテップ (753) + TX、フッ化
スルフリル (756) + TX、スルプロオス (1408) + TX、タール油 (758) +
TX、 - フルバリネート (398) + TX、タジムカルブ (1412) + TX、TDE 50

(1 4 1 4) + TX、テブフェノジド(7 6 2) + TX、テブフェンピラド(7 6 3) + TX、テブピリムホス(7 6 4) + TX、テフルベンズロン(7 6 8) + TX、テフルトリン(7 6 9) + TX、テメホス(7 7 0) + TX、TEPP(1 4 1 7) + TX、テラレトリン(1 4 1 8) + TX、テルバム+ TX、テルブホス(7 7 3) + TX、テトラクロエタン[CCN] + TX、テトラクロルビンホス(7 7 7) + TX、テトラメトリン(7 8 7) + TX、- シペルメトリン(2 0 4) + TX、チアクロプリド(7 9 1) + TX、チアフェノックス+ TX、チアメトキサム(7 9 2) + TX、チクロホス(1 4 2 8) + TX、チオカルボキシム(1 4 3 1) + TX、チオシクラム(7 9 8) + TX、チオシクラムシュウ酸水素塩(7 9 8) + TX、チオジカルブ(7 9 9) + TX、チオファノックス(8 0 0) + TX、チオメトン(8 0 1) + TX、チオナジン(1 4 3 4) + TX、チオスルタップ(8 0 3) + TX、チオスルタブ - ナトリウム(8 0 3) + TX、ツリンギエンシン[CCN] + TX、トルフェンピラド(8 0 9) + TX、トラロメトリン(8 1 2) + TX、トランスフルトリン(8 1 3) + TX、トランスペルメトリン(1 4 4 0) + TX、トリアミホス(1 4 4 1) + TX、トリアザメート(8 1 8) + TX、トリアゾホス(8 2 0) + TX、トリアズロン+ TX、トリクロルホン(8 2 4) + TX、トリクロルメタホス - 3 [CCN] + TX、トリクロロナート(1 4 5 2) + TX、トリフェノホス(1 4 5 5) + TX、トリフルムロン(8 3 5) + TX、トリメタカルブ(8 4 0) + TX、トリプレン(1 4 5 9) + TX、バミドチオン(8 4 7) + TX、バニリプロール[CCN] + TX、ベラトリジン(7 2 5) + TX、ベラトリン(7 2 5) + TX、XMC(8 5 3) + TX、キシリルカルブ(8 5 4) + TX、YI - 5 3 0 2 (化合物コード) + TX、- シペルメトリン(2 0 5) + TX、ゼタメトリン(z et a me th r i n) + TX、リン化亜鉛(6 4 0) + TX、ゾラプロホス(1 4 6 9) およびZX I 8 9 0 1 (開発コード)(8 5 8) + TX、シアントラニリプロール[7 3 6 9 9 4 - 6 3 - 1 9 + TX、クロルアントラニリプロール[5 0 0 0 0 8 - 4 5 - 7] + TX、シエノピラフェン[5 6 0 1 2 1 - 5 2 - 0] + TX、シフルメトフェン[4 0 0 8 8 2 - 0 7 - 7] + TX、ピリフルキナゾン[3 3 7 4 5 8 - 2 7 - 2] + TX、スピネトラム[1 8 7 1 6 6 - 4 0 - 1 + 1 8 7 1 6 6 - 1 5 - 0] + TX、スピロテトラマト[2 0 3 3 1 3 - 2 5 - 1] + TX、スルホキサフロール[9 4 6 5 7 8 - 0 0 - 3] + TX、フルフィプロール[7 0 4 8 8 6 - 1 8 - 0] + TX、メペルフルトリン[9 1 5 2 8 8 - 1 3 - 0] + TX、テトラメチルフルトリン[8 4 9 3 7 - 8 8 - 2] + TX、トリフルメゾピリム(国際公開第2 0 1 2 / 0 9 2 1 1 5号に開示される) + TX、フルキサメタミド(国際公開第2 0 0 7 / 0 2 6 9 6 5号) + TX、- メトフルトリン[2 4 0 4 9 4 - 7 1 - 7] + TX、- モンフルオロトリン[1 0 6 5 1 2 4 - 6 5 - 3] + TX、フルアザインドリジン[1 2 5 4 3 0 4 - 2 2 - 7] + TX、クロロプラレトリン[3 9 9 5 7 2 - 8 7 - 3] + TX、フルキサメタミド[9 2 8 7 8 3 - 2 9 - 3] + TX、シハロジアミド(cyhalodiamide)[1 2 6 2 6 0 5 - 5 3 - 7] + TX、チオキサザフェン[3 3 0 4 5 9 - 3 1 - 9] + TX、プロフラニリド[1 2 0 7 7 2 7 - 0 4 - 5] + TX、フルフィプロール[7 0 4 8 8 6 - 1 8 - 0] + TX、シクラニリプロール[1 0 3 1 7 5 6 - 9 8 - 5] + TX、テトラニリプロール[1 2 2 9 6 5 4 - 6 6 - 3] + TX、グアジピル(guadipyr)(国際公開第2 0 1 0 / 0 6 0 2 3 1号に記載される) + TX、シクロキサブリド(国際公開第2 0 0 5 / 0 7 7 9 3 4号に記載される) + TXからなる物質の群から選択される殺虫剤、

ビス(トリプチルスズ)オキシド(IUPAC名)(9 1 3) + TX、プロモアセトアミド[CCN] + TX、ヒ酸カルシウム[CCN] + TX、クロエトカルブ(9 9 9) + TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN] + TX、硫酸銅(1 7 2) + TX、フェンチン(3 4 7) + TX、リン酸第二鉄(IUPAC名)(3 5 2) + TX、メタアルデヒド(5 1 8) + TX、メチオカルブ(5 3 0) + TX、ニクロサミド(5 7 6) + TX、ニクロサミド - オールアミン(5 7 6) + TX、ペンタクロロフェノール(6 2 3) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(6 2 3) + TX、タジムカルブ(1 4 1 2) + TX、チオ

ジカルブ(799) + TX、酸化トリプチルスズ(913) + TX、トリフェンモルフ(1454) + TX、トリメタカルブ(840) + TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)および水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347) + TX、ピリプロール[394730 - 71 - 3] + TXからなる物質の群から選択される殺軟体動物剤。

A K D - 3 0 8 8 (化合物コード) + TX 、 1 , 2 - ジプロモ - 3 - クロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 0 4 5) + TX 、 1 , 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 0 6 2) + TX 、 1 , 2 - ジクロロプロペン (IUPAC 名) (1 0 6 3) + TX 、 1 , 3 - ジクロロプロベン (2 3 3) + TX 、 3 , 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン 1 , 1 - ジオキシド (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 0 6 5) + TX 、 3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルローダニン (IUPAC 名) (9 8 0) + TX 、 5 - メチル - 6 - チオキソ - 1 , 3 , 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸 (IUPAC 名) (1 2 8 6) + TX 、 6 - イソペンテニルアミノブリン (2 1 0) + TX 、 アバメクチン (1) + TX 、 アセトプロール [C C N] + TX 、 アラニカルブ (1 5) + TX 、 アルジカルブ (1 6) + TX 、 アルドキシカルブ (8 6 3) + TX 、 AZ 6 0 5 4 1 (化合物コード) + TX 、 ベンクロチアズ [C C N] + TX 、 ベノミル (6 2) + TX 、 プチルピリダベン + TX 、 カズサホス (1 0 9) + TX 、 カルボフラン (1 1 8) + TX 、 二硫化炭素 (9 4 5) + TX 、 カルボスルファン (1 1 9) + TX 、 クロロピクリン (1 4 1) + TX 、 クロルピリホス (1 4 5) + TX 、 クロエトカルブ (9 9 9) + TX 、 サイトカイニン (2 1 0) + TX 、 ダゾメット (2 1 6) + TX 、 D B C P (1 0 4 5) + TX 、 D C I P (2 1 8) + TX 、 ジアミダホス (1 0 4 4) + TX 、 ジクロフェンチオン (1 0 5 1) + TX 、 ジクリホス + TX 、 ジメトエート (2 6 2) + TX 、 ドラメクチン [C C N] + TX 、 エマメクチン (2 9 1) + TX 、 エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + TX 、 エプリノメクチン [C C N] + TX 、 エトプロホス (3 1 2) + TX 、 二臭化工チレン (3 1 6) + TX 、 フェナミホス (3 2 6) + TX 、 フエンピラド + TX 、 フエンスルホチオン (1 1 5 8) + TX 、 ホスチアゼート (4 0 8) + TX 、 ホスチエタン (1 1 9 6) + TX 、 フルフラール [C C N] + TX 、 G Y - 8 1 (開発コード) (4 2 3) + TX 、 ヘテロホス [C C N] + TX 、 ヨードメタン (IUPAC 名) (5 4 2) + TX 、 イサミドホス (1 2 3 0) + TX 、 イサゾホス (1 2 3 1) + TX 、 イベルメクチン [C C N] + TX 、 キネチン (2 1 0) + TX 、 メカルフォン (1 2 5 8) + TX 、 メタム (5 1 9) + TX 、 メタム - カリウム (5 1 9) + TX 、 メタム - ナトリウム (5 1 9) + TX 、 臭化メチル (5 3 7) + TX 、 メチルイソチオシアネート (5 4 3) + TX 、 ミルベマイシンオキシム [C C N] + TX 、 モキシデクチン [C C N] + TX 、 クワ暗斑病菌 (Myrothecium verrucaria) 組成物 (5 6 5) + TX 、 NC - 1 8 4 (化合物コード) + TX 、 オキサミル (6 0 2) + TX 、 ホレート (6 3 6) + TX 、 ホスニアミドン (6 3 9) + TX 、 ホスホカルブ [C C N] + TX 、 セブホス + TX 、 セラメクチン [C C N] + TX 、 スピノサド (7 3 7) + TX 、 テルバム + TX 、 テルブホス (7 7 3) + TX 、 テトラクロロチオフェン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 4 2 2) + TX 、 チアフェノックス + TX 、 チオナジン (1 4 3 4) + TX 、 トリアゾホス (8 2 0) + TX 、 トリアズロン + TX 、 キシレノール [C C N] + TX 、 Y I - 5 3 0 2 (化合物コード) およびゼアチン (2 1 0) + TX 、 フルエンスルホン [3 1 8 2 9 0 - 9 8 - 1] + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤。

エチルキサントゲン酸カリウム [C C N] およびニトラピリン (5 8 0) + TX からなる物質の群から選択される硝化阻害剤。

アシベンゾラル (6) + TX 、 アシベンゾラル - S - メチル (6) + TX 、 プロベナゾール (6 5 8) およびオオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) 抽出物 (7 2 0) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、 2 - イソバレリルインダン - 1 , 3 - ジオン (IUPAC 名) (1 2 4 6) + TX 、 4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (7 4 8)

10

20

30

40

50

) + TX、 - クロロヒドリン [CCN] + TX、 リン化アルミニウム (640) + TX
 、 アンチュ (antu) (880) + TX、 三酸化ニヒ素 (882) + TX、 炭酸バリウム (891) + TX、 ビスチオセミ (912) + TX、 ブロディファコウム (89) + TX
 、 ブロマジオロン (91) + TX、 ブロメタリン (92) + TX、 シアン化カルシウム (444) + TX、 クロラロース (127) + TX、 クロロファシン (140) + TX
 、 コレカルシフェロール (850) + TX、 クマクロール (1004) + TX、 クマフリル (1005) + TX、 クマテトラリル (175) + TX、 クリミジン (1009) + TX
 、 ジフェナコウム (246) + TX、 ジフェチアロン (249) + TX、 ジファシン (273) + TX、 エルゴカルシフェロール (301) + TX、 フロクマフェン (357)
) + TX、 フルオロアセトアミド (379) + TX、 フルプロパダイン (1183) + TX
 X、 フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、 - HCH (430) + TX、 HCH (430) + TX、 シアン化水素 (444) + TX、 ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、 リンダン (430) + TX、 リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、 臭化メチル (537) + TX、 ノルボルミド (1318) + TX、 ホサセチム (1336) + TX、 ホスフィン (IUPAC名) (640) + TX、 リン [CCN] + TX、 ピンドン (1341) + TX、 亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、 ピリヌロン (1371) + TX、 シリロシド (1390) + TX、 亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX
 、 シアン化ナトリウム (444) + TX、 フルオロ酢酸ナトリウム (735) + TX、 ストリキニーネ (745) + TX、 硫酸タリウム [CCN] + TX、 ワルファリン (851)
) およびリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、
 2 - (2 - プトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC名) (934) + TX
 、 5 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシリシクロヘキサ - 2 - エノン (IUPAC名) (903) + TX、 ファルネソールおよびネロリドール (324) + TX、 MB - 599 (開発コード) (498) + TX、 MGK 264 (開発コード) (296) + TX、 ピペロニルブトキシド (649) + TX、 ピプロタール (1343) + TX、 プロピル異性体 (1358) + TX、 S421 (開発コード) (724) + TX
 、 セサメクス (1393) + TX、 セサモリン (1394) およびスルホキシド (1406) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、
 アントラキノン (32) + TX、 クロラロース (127) + TX、 ナフテン酸銅 [CCN] + TX、 酸塩化銅 (171) + TX、 ジアジノン (227) + TX、 ジシクロペンタジエン (化学名) (1069) + TX、 グアザチン (422) + TX、 酢酸グアザチン (422) + TX、 メチオカルブ (530) + TX、 ピリジン - 4 - アミン (IUPAC名) (23) + TX、 チラム (804) + TX、 トリメタカルブ (840) + TX、 ナフテン酸亜鉛 [CCN] およびジラム (856) + TX からなる物質の群から選択される動物忌避剤、
 イマニン [CCN] およびリバビリン [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、
 酸化第二水銀 (512) + TX、 オクチリノン (590) およびチオファネート - メチル (802) + TX からなる物質の群から選択される傷保護剤、
 ならびにアザコナゾール (60207 - 31 - 0) + TX、 ビテルタノール [70585 - 36 - 3] + TX、 ブロムコナゾール [116255 - 48 - 2] + TX、 シプロコナゾール [94361 - 06 - 5] + TX、 ジフェノコナゾール [119446 - 68 - 3] + TX、 ジニコナゾール [83657 - 24 - 3] + TX、 エポキシコナゾール [106325 - 08 - 0] + TX、 フェンブコナゾール [114369 - 43 - 6] + TX
 、 フルキンコナゾール [136426 - 54 - 5] + TX、 フルシラゾール [85509 - 19 - 9] + TX、 フルトリアホール [76674 - 21 - 0] + TX、 ヘキサコナゾール [79983 - 71 - 4] + TX、 イマザリル [35554 - 44 - 0] + TX、 イミベンコナゾール [86598 - 92 - 7] + TX、 イブコナゾール [125225 - 28 - 7] + TX、 メトコナゾール [125116 - 23 - 6] + TX、 ミクロブタニル [88671 - 89 - 0] + TX、 ペフラゾエート [101903 - 30 - 4] + TX、 ペ

10

20

30

40

50

ンコナゾール [6 6 2 4 6 - 8 8 - 6] + TX、プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8 - 7
 0 - 6] + TX、ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + TX、プロクロラズ [6
 7 7 4 7 - 0 9 - 5] + TX、プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + TX、シメ
 コナゾール [1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + TX、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 -
 3] + TX、テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + TX、トリアジメホン [4
 3 1 2 1 - 4 3 - 3] + TX、トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + TX、トリ
 フルミゾール [9 9 3 8 7 - 8 9 - 0] + TX、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2
 - 7] + TX、アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + TX、フェナリモル [6 0 1
 6 8 - 8 8 - 9] + TX、ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + TX、ブピリメート [
 4 1 4 8 3 - 4 3 - 6] + TX、ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + TX、エチリ
 モル [2 3 9 4 7 - 6 0 - 6] + TX、ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + TX、フェ
 ンプロピジン [6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + TX、フェンプロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1
 - 4] + TX、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + TX、トリデモルフ [8 1
 4 1 2 - 4 3 - 3] + TX、シプロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + TX、メパニビ
 リム [1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7] + TX、ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + TX
 、フェンピクロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + TX、フルジオキソニル [1 3 1 3 4 1
 - 8 6 - 1] + TX、ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + TX、フララキシル [5
 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + TX、メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + TX、R - メタ
 ラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + TX、オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + TX
 、オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3] + TX、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2]
 + TX、カルベンダジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + TX、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9
 1 - 6] + TX、フベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + TX、チアベンダゾール [1
 4 8 - 7 9 - 8] + TX、クロゾリネット [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + TX、ジクロゾリ
 ン [2 4 2 0 1 - 5 8 - 9] + TX、イプロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + TX、マ
 イクロゾリン [5 4 8 6 4 - 6 1 - 8] + TX、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8]
 + TX、ピンクロゾリン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + TX、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 -
 8 5 - 6] + TX、カルボキシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + TX、フェンフラム [2 4 6
 9 1 - 8 0 - 3] + TX、フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + TX、メプロニル [
 5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + TX、オキシカルボキシン [5 2 5 9 - 8 8 - 1] + TX、ペ
 ンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + TX、チフルザミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 -
 7] + TX、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + TX、ドジン [2 4 3 9 - 1 0 -
 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3
] + TX、アゾキシストロビン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8] + TX、ジモキシストロビン
 [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + TX、エヌステロブリン { Proc. B C P C , I nt.
 Congr. , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + TX、フルオキサストロビン [
 3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + TX、クレソキシム - メチル [1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0] +
 TX、メトミノストロビン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] + TX、トリフロキシストロビン
 [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + TX、オリザストロビン [2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + T
 X、ピコキシストロビン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + TX、ピラクロストロビン [1 7
 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + TX、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + TX、マンコゼブ
 [8 0 1 8 - 0 1 - 7] + TX、マネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + TX、メチラム [9
 0 0 6 - 4 2 - 2] + TX、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + TX、チラム [1 3
 7 - 2 6 - 8] + TX、ジネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + TX、ジラム [1 3 7 - 3 0
 - 4] + TX、カブタホール [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + TX、カプタン [1 3 3 - 0 6 -
 2] + TX、ジクロフルアニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + TX、フルオロイミド [4 1 2
 0 5 - 2 1 - 4] + TX、ホルペット [1 3 3 - 0 7 - 3] + TX、トリルフルアニド [
 7 3 1 - 2 7 - 1] + TX、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + TX、水酸化銅 [2 0
 4 2 7 - 5 9 - 2] + TX、オキシ塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + TX、硫酸銅 [7 7
 5 8 - 9 8 - 7] + TX、酸化銅 [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + TX、マンコッパー (man
 copper) [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + TX、オキシン銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] 50

+ TX、ジノカップ [131 - 72 - 6] + TX、ニトロタール - イソプロピル [105
 52 - 74 - 6] + TX、エジフェンホス [17109 - 49 - 8] + TX、イプロベン
 ホス [26087 - 47 - 8] + TX、イソプロチオラン [50512 - 35 - 1] + T
 X、ホスジフェン [36519 - 00 - 3] + TX、ピラゾホス [13457 - 18 - 6
] + TX、トルクロホス - メチル [57018 - 04 - 9] + TX、アシベンゾラル - S
 - メチル [135158 - 54 - 2] + TX、アニラジン [101 - 05 - 3] + TX、
 ベンチアバリカルブ [413615 - 35 - 7] + TX、プラストサイジン - S [207
 9 - 00 - 7] + TX、キノメチオナト [2439 - 01 - 2] + TX、クロロネブ [2
 675 - 77 - 6] + TX、クロロタロニル [1897 - 45 - 6] + TX、シフルフェ
 ナミド [180409 - 60 - 3] + TX、シモキサニル [57966 - 95 - 7] + T 10
 X、ジクロン [117 - 80 - 6] + TX、ジクロシメット [139920 - 32 - 4]
 + TX、ジクロメジン [62865 - 36 - 5] + TX、ジクロラン [99 - 30 - 9]
 + TX、ジエトフェンカルブ [87130 - 20 - 9] + TX、ジメトモルフ [1104
 88 - 70 - 5] + TX、SYP - L I 90 (フルモルフ) [211867 - 47 - 9]
 + TX、ジチアノン [3347 - 22 - 6] + TX、エタボキサム [162650 - 77
 - 3] + TX、エトリジアゾール [2593 - 15 - 9] + TX、ファモキサドン [13
 1807 - 57 - 3] + TX、フェナミドン [161326 - 34 - 7] + TX、フェノ
 キサニル [115852 - 48 - 7] + TX、フェンチン [668 - 34 - 8] + TX、
 フェリムゾン [89269 - 64 - 7] + TX、フルアジナム [79622 - 59 - 6]
 + TX、フルオピコリド [239110 - 15 - 7] + TX、フルスルファミド [106
 917 - 52 - 6] + TX、フェンヘキサミド [126833 - 17 - 8] + TX、ホセ
 チル - アルミニウム [39148 - 24 - 8] + TX、ヒメキサゾール [10004 - 4
 4 - 1] + TX、イプロバリカルブ [140923 - 17 - 7] + TX、IKF - 916
 (シアゾファミド) [120116 - 88 - 3] + TX、カスガマイシン [6980 - 1
 8 - 3] + TX、メタルホカルブ [66952 - 49 - 6] + TX、メトラフェノン [30
 220899 - 03 - 6] + TX、ペンシクロン [66063 - 05 - 6] + TX、フタ
 リド [27355 - 22 - 2] + TX、ポリオキシン [11113 - 80 - 7] + TX、
 プロベナゾール [27605 - 76 - 1] + TX、プロパモカルブ [25606 - 41 -
 1] + TX、プロキンアジド [189278 - 12 - 4] + TX、ピロキロン [5736
 9 - 32 - 1] + TX、キノキシフェン [124495 - 18 - 7] + TX、キントゼン
 [82 - 68 - 8] + TX、硫黄 [7704 - 34 - 9] + TX、チアジニル [2235
 80 - 51 - 6] + TX、トリアゾキシド [72459 - 58 - 6] + TX、トリシクラ
 ゾール [41814 - 78 - 2] + TX、トリホリン [26644 - 46 - 2] + TX、
 バリダマイシン [37248 - 47 - 8] + TX、ゾキサミド (RH7281) [156
 052 - 68 - 5] + TX、マンジプロパミド [374726 - 62 - 2] + TX、イソ
 ピラザム [881685 - 58 - 1] + TX、セダキサン [874967 - 67 - 6] +
 TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジ
 クロロメチレン - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イ
 ル) - アミド (国際公開第2007 / 048556号に開示される) + TX、3 - ジフル
 オロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3' , 4' , 5' - ト里 40
 フルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第2006 / 087343号に開
 示される) + TX、[(3S , 4R , 4aR , 6S , 6aS , 12R , 12aS , 12b
 S) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 1 , 3 , 4 , 4a , 5 , 6 , 6a
 , 12 , 12a , 12b - デカヒドロ - 6 , 12 - ジヒドロキシ - 4 , 6a , 12b - ト
 リメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H , 11H ナフト [2 , 1 - b]
 ピラノ [3 , 4 - e] ピラン - 4 - イル] メチル - シクロプロパンカルボキシレート [9
 15972 - 17 - 7] + TX および 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 -
 オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2 , 2 , 2 - トリフルオ
 ロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル] - 1H - ピラゾール
 - 4 - カルボキサミド [926914 - 55 - 8] + TX からなる物質の群から選択され 50

る生物学的に活性な化合物；および

以下のものを含む微生物(microbials)：アシネットバクター・ルオフィイ(*Acinetobacter lwoffii*)+TX、アクレモニウム・アルタナツム(*Acremonium alternatum*)+TX+TX、アクレモニウム・セフアロスポリウム(*Acremonium cephalosporium*)+TX+TX、アクレモニウム・ディオスピリ(*Acremonium diospyri*)+TX、アクレモニウム・オブクラバツム(*Acremonium obclavatum*)+TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス(*Adoxophyes orana granulovirus*)(*AdoxGV*)(*CapeX*(登録商標))+TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター(*Agrobacterium radiobacter*)
菌株K84(*Galltrol-A*(登録商標))+TX、アルテルナリア・アルテルナータ(*Alternaria alternate*)+TX、アルテルナリア・カシアエ(*Alternaria cassia*)+TX、アルテルナリア・デストルエンス(*Alternaria destruens*)(*Smolder*(登録商標))+TX、アンペロマイセス・キスカリス(*Ampelomyces quisqualis*)(AQ10(登録商標))+TX、アスペルギルス・フラブス(*Aspergillus flavus*)AF36(AF36(登録商標))+TX、アスペルギルス・フラブス(*Aspergillus flavus*)NRRL 21882(*Aflaguard*(登録商標))+TX、アスペルギルス属(*Aspergillus spp.*)+TX、アウレオバシジウム・プルランス(*Aureobasidium pullulans*)+TX、アゾスピリルム属(*Azospirillum*)+TX、(MicroAZ(登録商標))+TX、TAZO B(登録商標))+TX、アゾトバクター属(*Azotobacter*)+TX、アゾトバクター・クロオコッカム(*Azotobacter chroococcum*)(*Azotomeal*(登録商標))+TX、アゾトバクター(*Azotobacter*)シスト(cyst)(*Bionatural Blooming Blossoms*(登録商標))+TX、バチルス・アミロリケファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)+TX、セレウス菌(*Bacillus cereus*)+TX、バチルス・キチノスボルス(*Bacillus chitinosporus*)菌株CM-1+TX、バチルス・キチノスボルス(*Bacillus chitiniosporus*)菌株AQ746+TX、バチルス・リケニフォルミス(*Bacillus licheniformis*)菌株HB-2(*Biostart*(商標)*Rhizoboost*(登録商標))+TX、バチルス・リケニフォルミス(*Bacillus licheniformis*)菌株3086(*EcoGuard*(登録商標))+TX、Green Releaf(登録商標))+TX、バチルス・サーキュランス(*Bacillus circulans*)+TX、バチルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)(*BioSafe*(登録商標))+TX、*BioNem-WP*(登録商標)+TX、VOTIVO(登録商標))+TX、バチルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)菌株I-1582+TX、バチルス・マセランス(*Bacillus macerans*)+TX、バチルス・マリスモルトウイ(*Bacillus mariismortui*)+TX、バチルス・メガテリウム(*Bacillus megaterium*)+TX、バチルス・ミコイデス(*Bacillus mycooides*)菌株AQ726+TX、バチルス・ポピリエ(*Bacillus papillae*)(*Milky Spore Powder*(登録商標))+TX、バチルス・ブミルス種(*Bacillus pumilus spp.*)+TX、バチルス・ブミルス(*Bacillus pumilus*)菌株GB34(*Yield Shield*(登録商標))+TX、バチルス・ブミルス(*Bacillus pumilus*)菌株QST 2808(*Sonata*(登録商標))+TX、*Ballad Plus*(登録商標))+TX、バチルス・スフェリカス(*Bacillus spahericus*)(*VectoLex*(登録商標))+TX、バチルス属(*Bacillus spp.*)+TX、バチルス属(*B*
10
20
30
40
50

a c i l l u s s p p .) 菌株 A Q 1 7 5 + T X 、 バチルス属 (B a c i l l u s s p p .) 菌株 A Q 1 7 7 + T X 、 バチルス属 (B a c i l l u s s p p .) 菌株 A Q 1 7 8 + T X 、 枯草菌 (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 Q S T 7 1 3 (C E A S E (登録商標) + T X 、 Serenade (登録商標) + T X 、 R h a p s o d y (登録商標)) + T X 、 枯草菌 (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 Q S T 7 1 4 (J A Z Z (登録商標)) + T X 、 枯草菌 (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 A Q 1 5 3 + T X 、 枯草菌 (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 A Q 7 4 3 + T X 、 枯草菌 (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 Q S T 3 0 0 2 + T X 、 枯草菌 (B a c i l l u s s u b t i l i s) 菌株 Q S T 3 0 0 4 + T X 、 枯草菌变种アミロリケファシエンス (B a c i l l u s s u b t i l i s v a r . a m y l o l i q u e f a c i e n s) 菌株 F Z B 2 4 (T a e g r o (登録商標) + T X 、 R h i z o p r o (登録商標)) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) C r y 2 A e + T X 、 バチルス・チューリゲンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) C r y 1 A b + T X 、 バチルス・チューリゲンシス・アイザワイ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s a i z a w a i) G C 9 1 (A g r e e (登録商標)) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス・イスラエレンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s i s r a e l e n s i s) (B M P 1 2 3 (登録商標) + T X 、 A q u a b a c (登録商標) + T X 、 V e c t o B a c (登録商標)) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス・クルスターーキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i) (J a v e l i n (登録商標) + T X 、 D e l i v e r (登録商標) + T X 、 C r y M a x (登録商標) + T X 、 B o n i d e (登録商標) + T X 、 S c u t e l l a W P (登録商標) + T X 、 T u r i l a v W P (登録商標) + T X 、 A s t u t o (登録商標) + T X 、 D i p e l W P (登録商標) + T X 、 B i o b i t (登録商標) + T X 、 F o r a y (登録商標)) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス・クルスターーキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i) B M P 1 2 3 (B a r i t o n e (登録商標)) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス・クルスターーキ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i) H D - 1 (B i o p r o t e c - C A F / 3 P (登録商標)) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) 菌株 B D # 3 2 + T X 、 バチルス・チューリゲンシス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) 菌株 A Q 5 2 + T X 、 バチルス・チューリゲンシス变种アイザワイ (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s v a r . a i z a w a i) (X e n T a r i (登録商標) + T X 、 D i P e l (登録商標)) + T X 、 細菌種 (b a c t e r i a s p p .) (G R O W M E N D (登録商標) + T X 、 G R O W S W E E T (登録商標) + T X 、 S h o o t u p (登録商標)) + T X 、 クラビバクター・ミシガネンシス (C l a v i p a c t e r m i c h i g a n e n s i s) のバクテリオフアージ (A g r i P h a g e (登録商標)) + T X 、 B a k f l o r (登録商標) + T X 、 ビューベリア・バシアナ (B e a u v e r i a b a s s i a n a) (B e a u g e n i c (登録商標) + T X 、 B r o c a r i l W P (登録商標)) + T X 、 ビューベリア・バシアナ (B e a u v e r i a b a s s i a n a) G H A (M y c o t r o l E S (登録商標) + T X 、 M y c o t r o l O (登録商標) + T X 、 B o t a n i G u a r d (登録商標)) + T X 、 ビューベリア・ブロングニアルティ (B e a u v e r i a b r o n g n i a r t i i) (E n g e r l i n g s p i l z (登録商標) + T X 、 S c h w e i z e r B e a u v e r i a (登録商標) + T X 、 M e l o c o n t (登録商標)) + T X 、 ビューベリア属 (B e a u v e r i a s p p .) + T X 、 灰色かび病菌 (B o t r y t i s c i n e r i a) + T X 、 ブラディリゾビウム・ジャポニクム (B r a d y r h i z o b i u m j a p o n i c u m) (T e r r a M a x (登録商標)) + T X 、 ブレビバチルス・ブレビス (B r e v i b a c i l l u s b r e v i s) + T X 、 バチルス・チューリゲンシス・テネブリオニス (B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s t e n e b r i o n i s) (N o v o d o r (登録商標)) + T X 、 B t B 10
 20
 30
 40
 50

ooster + TX、バークホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (Deny (登録商標) + TX、Intercept (登録商標) + TX、Blue Circle (登録商標)) + TX、バークホルデリア・グラディ (*Burkholderia gladii*) + TX、バークホルデリア・グラディオリ (*Burkholderia gladioli*) + TX、バークホルデリア属 (*Burkholderia spp.*) + TX、セイヨウトゲアザミの菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標)) + TX、カンジダ・ブチリ (*Candida butyri*) + TX、カンジダ・フアマータ (*Candida famata*) + TX、カンジダ・フルクタス (*Candida fructus*) + TX、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabra*) + TX、カンジダ・ギリエルモンディ (*Candida guilliermondii*) + TX、カンジダ・メリビオシカ (*Candida melibiosica*) + TX、カンジダ・オレオフィラ (*Candida oleophila*) 菌株O + TX、カンジダ・パラブシリシス (*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダ・ペリキュローザ (*Candida pelliculosa*) + TX、カンジダ・プルケリマ (*Candida pulcherrima*) + TX、カンジダ・レウカウフィ (*Candida reukauffii*) + TX、カンジダ・サイトアナ (*Candida saitoana*) (Bio-Coat (登録商標) + TX、Biocure (登録商標)) + TX、カンジダ・サケ (*Candida sake*) + TX、カンジダ属 (*Candida spp.*) + TX、カンジダ・テヌイス (*Candida tensus*) + TX、セデセア・ダビセ (*Cedecea dravisa*) + TX、セルロモナス・フラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) + TX、カエトミウム・コクリオイデス (*Chaetomium cochlioides*) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide (登録商標)) + TX、クロモバクテリウム・スブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株PRAA4-1T (Grandeko (登録商標)) + TX、クラドスボリウム・クラドスボリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) + TX、クラドスボリウム・オキシスポルム (*Cladosporium oxyicum*) + TX、クラド
 30
 スボリウム・クロロセファルム (*Cladosporium chlorocephalum*) + TX、クラドスボリウム属 (*Cladosporium spp.*) + TX、クラドスボリウム・テヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) + TX、クロノスタキス・ロゼア (*Clonostachys rosea*) (Endo Fine (登録商標)) + TX、コレトトリクム・アクタータム (*Colletotrichum acutatum*) + TX、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標)) + TX、コニオチリウム属 (*Coniothyrium spp.*) + TX、クリプトコッカス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカス・フミコラ (*Cryptococcus humicola*) + TX、クリプトコッカス・インフィルモ-ミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatus*) + TX、クリプトコッカス・ローレンティ (*Cryptococcus laurentii*) + TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (Cryptex (登録商標)) + TX、カプリアビダス・カンピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) + TX、コドリンガ顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標)) + TX、コドリンガ顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (Madex (登録商標) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標)) + TX、エビコ
 40
 50

ウヤクタケ (*Cylindrobasidium laeve*) (*Stumpout* (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (*Cylindrocladium*) + TX、デバリオマイセス・ハンセンイ (*Debaryomyces hansenii*) + TX、ドレクスレラ・ハワイエンシス (*Drechslera hawaiinensis*) + TX、エンテロバクター・クロアカ (*Enterobacter cloacae*) + TX、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*) + TX、エントモフトラ・ビルレンタ (*Entomophthora virulenta*) (*Vektor* (登録商標)) + TX、エピコッカム・ニグラム (*Epicoccum nigrum*) + TX、エピコッカム・パー・パラセンス (*Epicoccum purpurascens*) + TX、エピコッカム属 (*Epicoccum spp.*) + TX、フィロバシディウム・フロリフォルム (*Filobasidium floriforme*) + TX、フザリウム・アクミナツム (*Fusarium acuminatum*) + TX、フザリウム・クラミドスボルム (*Fusarium chlamydosporum*) + TX、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) (*Fusaclean* (登録商標) / *Biofox C* (登録商標)) + TX、フザリウム・プロリフェラツム (*Fusarium proliferatum*) + TX、フザリウム属 (*Fusarium spp.*) + TX、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (*Galactomyces geotrichum*) + TX、グリオクラジウム・カテヌラツム (*Gliocladium catenulatum*) (*Primastop* (登録商標) + TX、*Prestop* (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ロセウム (*Gliocladium roseum*) + TX、グリオクラジウム属 (*Gliocladium spp.*) (*Soilgard* (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) (*Soilgard* (登録商標)) + TX、顆粒病ウイルス (*Granulovirus*) (*Granupom* (登録商標)) + TX、ハロバチルス・ハロフィラス (*Halobacillus halophilus*) + TX、ハロバチルス・リトラリス (*Halobacillus litoralis*) + TX、ハロバチルス・トルウエペリ (*Halobacillus trueperi*) + TX、ハロモナス属 (*Halomonas spp.*) + TX、ハロモナス・スブグラシェスコーラ (*Halomonas subglaciescola*) + TX、ハロビブリオ・バリアビリス (*Halovibrio variabilis*) + TX、ハンセニアスピラ・ウバルム (*Hanseniaspora uvarum*) + TX、オオタバコガ核多角体病ウイルス (*Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus*) (*Helicovex* (登録商標)) + TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス (*Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus*) (*Gemstar* (登録商標)) + TX、イソフラボン・ホルモノネチン (*Myconate* (登録商標)) + TX、クロエケラ・アピキュラータ (*Kloeckera apiculata*) + TX、クロエケラ属 (*Kloeckera spp.*) + TX、ラゲニジウム・ギガンテウム (*Lagenidium giganteum*) (*Laginex* (登録商標)) + TX、レカニシリウム・ロンギスボルム (*Lecanicillium longisporum*) (*Vertiblast* (登録商標)) + TX、レカニシリウム・ムスカリウム (*Lecanicillium muscarium*) (*Vertikil* (登録商標)) + TX、マイマイガ核多角体病ウイルス (*Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus*) (*Dispavirus* (登録商標)) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス (*Marinococcus halophilus*) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ (*Meira geulakonigii*) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Met 52* (登録商標)) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Destruxin WP* (登録商標)) + TX、メチニコビア・フルクチコラ (*Metschnikowia fruticola*) (*Shemer* (登録商標)) + TX、メチニコビア・ブルケリマ (10
20
30
40
50)

Metschnikowia pulcherrima) + TX、ミクロドチウム・ジメルム (Microdochium dimerum) (Antibot (登録商標)) + TX、ミクロモノスpora・ケルレア (Micromonospora coerulea) + TX、ミクロスファエロプシス・オクラセ (Microsphaeropsis ochracea) + TX、ムスコドル・アルブス (Muscodor albus) 620 (Muscudor (登録商標)) + TX、ムスコドル・ロセウス (Muscodor roseus) 菌株 A3 - 5 + TX、ミコリザエ属 (Mycoorrhizae spp.) (AMykor (登録商標)) + TX、Root Maximizer (登録商標)) + TX、クワ暗斑病菌 (Myrothecium verrucaria) 菌株 AAC-0255 (DiTera (登録商標)) + TX、BROS PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマ・ピリフェルム (Ophiostoma piliferum) 菌株 D97 (Sylvanex (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・ファリノスス (Paecilomyces farinosus) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus) (PFR-97 (登録商標)) + TX、PreFerAl (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces linacinus) (Biostat WP (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (Paecilomyces lillacinus) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標)) + TX、パエニバチルス・ポリミキサ (Paenibacillus polymyxia) + TX、パントエア・アグロメランス (Pantoea agglomerans) (BlightBan C9 - 1 (登録商標)) + TX、パントエア属 (Pantoea spp.) + TX、パスツーリア属 (Pasteuria spp.) (Econem (登録商標)) + TX、パスツーリア・ニシザワエ (Pasteuria nishizawae) + TX、ペニシリウム・オーランティオグリセウム (Penicillium aurantiogriseum) + TX、ペニシリウム・ビライ (Penicillium billiae) (Jumpstart (登録商標)) + TX、TagTeam (登録商標)) + TX、ペニシリウム・ブレビコンパクトム (Penicillium brevicompactum) + TX、ペニシリウム・フレクエンタス (Penicillium frequentans) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (Penicillium griseofulvum) + TX、ペニシリウム・ブルプロゲナム (Penicillium purpurogenum) + TX、ペニシリウム属 (Penicillium spp.) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (Penicillium viridicatum) + TX、フレビオプシス・ギガンテア (Phlebiopsis gigantean) (Rotstop (登録商標)) + TX、リン酸塩溶解細菌 (Phosphomeal (登録商標)) + TX、フィトファトラ・クリプトゲア (Phytophthora cryptogaea) + TX、フィトファトラ・パルミボラ (Phytophthora palmivora) (Devine (登録商標)) + TX、ピヒア・アノマラ (Pichia anomala) + TX、ピヒア・ギリエルモンディ (Pichia guilem ondi) + TX、ピヒア・メンブラネファシエンス (Pichia membranaefaciens) + TX、ピヒア・オニキス (Pichia onychis) + TX、ピヒア・スチピチス (Pichia stipites) + TX、緑膿菌 (Pseudomonas aeruginosa) + TX、シュードモナス・オーレオファシエンス (Pseudomonas aureofaciens) (Spot-Less Bifungicide (登録商標)) + TX、シュードモナス・セパシア (Pseudomonas cepacia) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (Pseudomonas chlorraphis) (Ateze (登録商標)) + TX、シュードモナス・コルガータ (Pseudomonas corrugate) + TX、蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標)) + TX、シュードモナス・プチダ (Pseudomonas putida) + TX、シュードモナス・リアクタンス (Pseudomonas r 50

eactans) + TX、シュードモナス属 (Pseudomonas spp.) + TX、シュードモナス・シリンガエ (Pseudomonas syringae) (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナス・ビリジフラバ (Pseudomonas viridiiflava) + TX、蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマ・フロクロサ (Pseudozyma flocculosa) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニア・カナリクラタ (Puccinia canaliculata) + TX、プッシニア・テラスペオス (Puccinia thlaspeos) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウム・パレカンドルム (Pythium paroecandrum) + TX、ピシウム・オリガンドルム (Pythium oligandrum) (Polygandron (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウム病菌 (Pythium periplocum) + TX、ラーネラ・アクアティリス (Rhanelia aquatilis) + TX、ラーネラ属 (Rhanelia spp.) + TX、リゾビウム属 (Rhizobia) (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標)) + TX、リゾクトニア属 (Rhizoctonia) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (Rhodococcus globerulus) 菌株 AQ719 + TX、ロドスボリジウム・ディオボバタム (Rhodosporidium diobovatum) + TX、ロドスボリジウム・トルロイデス (Rhodosporidium toruloides) + TX、ロドトルラ属 (Rhodotorula spp.) + TX、ロドトルラ・グルチニス (Rhodotorula glutinis) + TX、ロドトルラ・グラミニス (Rhodotorula graminis) + TX、ロドトルラ・ムチラギノーザ (Rhodotorula mucilaginosa) + TX、ロドトルラ・ルブラ (Rhodotorula rubra) + TX、サッカロマイセス・セレビシエ (Saccharomyces cerevisiae) + TX、サリニコッカス・ロセウス (Salinococcus roseus) + TX、スクレロチニア・ミノル (Sclerotinia minor) + TX、スクレロチニア・ミノル (Sclerotinia minor) (SARRITOR (登録商標)) + TX、スキタリジウム属 (Scytalidium spp.) + TX、スキタリジウム・ウレジニコラ (Scytalidium uredinicolae) + TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus) (Spod-X (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + TX、セラチア・マルセッセンス (Serratia marcescens) + TX、セラチア・プリムシカ (Serratia plymuthica) + TX、セラチア属 (Serratia spp.) + TX、ソルダリア・フィミコーラ (Sordaria fimicola) + TX、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus) (Littovir (登録商標)) + TX、スプロボロマイセス・ロセウス (Sporobolomyces roseus) + TX、ステノトロホモナス・マルトフィリア (Stenotrophomonas maltophilia) + TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス (Streptomyces ahygroscopicus) + TX、ストレプトマイセス・アルバドゥンカス (Streptomyces albaduncus) + TX、ストレプトマイセス・エクスフォリエーテス (Streptomyces exfoliates) + TX、ストレプトマイセス・ガルバス (Streptomyces galbus) + TX、ストレプトマイセス・グリセオプラヌス (Streptomyces griseoplanus) + TX、ストレプトマイセス・グリセオビリディス (Streptomyces griseoviridis) (Mycostop (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (Streptomyces lydicus) (Actinovate (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (St

10

20

30

40

50

reptomyces lydicus) WYEC-108 (Actinogrow (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・ビオラセウス (Streptomyces violaceus) + TX、チレチオプシス・ミノル (Tilletiopsis minor) + TX、チレチオブシス属 (Tilletiopsis spp.) + TX、トリコデルマ・アスペレルム (Trichoderma asperellum) (T34 Biocontrol (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (Trichoderma gamsii) (Tenet (登録商標)) + TX、トリコデルマ・アトリビリデ (Trichoderma atroviride) (Plantmate (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハマツム (Trichoderma hamatum) TH 382 + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (Trichoderma harzianum rifai) (Mycostar (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-22 (Trianum-P (登録商標)) + TX、PlantShield HC (登録商標) + TX、RootShield (登録商標) + TX、Trianum-G (登録商標) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-39 (Trichodex (登録商標)) + TX、トリコデルマ・インハマタム (Trichoderma inhamatum) + TX、トリコデルマ・コニンギ (Trichoderma koningii) + TX、トリコデルマ属 (Trichoderma spp.) LC 52 (Sentinel (登録商標)) + TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichoderma lignorum) + TX、トリコデルマ・ロンギプラキアタム (Trichoderma longibrachiatum) + TX、トリコデルマ・ポリスボラム (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標)) + TX、トリコデルマ・タキシ (Trichoderma taxi) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (旧グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) GL-21) (SoilGuard (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) 菌株 IC C 080 (Remedier (登録商標)) + TX、トリコスボロン・ブルランス (Trichosporon pullulans) + TX、トリコスボロン属 (Trichosporon spp.) + TX、トリコセシウム属 (Trichothecium spp.) + TX、トリコセシウム・ロセウム (Trichothecium roseum) + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94671 + TX、ウロクラジウム・アトラム (Ulocladium atrum) + TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansi) (Botry-Zen (登録商標)) + TX、トウモロコシ黒穂病菌 (Ustilago maydis) + TX、様々な細菌および補助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標)) + TX、バーチシリウム・クラミドスボリウム (Verticillium chlamydosporium) + TX、バーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標)) + TX、Vertalec (登録商標)) + TX、Vip3Aa20 (VIPter (登録商標)) + TX、ビルジバチルス・マリスモルツイ (Virgibacillus marismortui) + TX、キサントモナス・カムベストリス病原型ポアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標)) + TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (Xenorhabdus bovienii) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (Xenorhabdus nematophilus) ; および
 以下のものを含む植物抽出物：松油 (Retenol (登録商標)) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標)) + TX、Azaguard (登録商標) + TX

商標) + TX、MeemAzal(登録商標) + TX、Molt-X(登録商標) + TX
 、植物性の昆虫成長制御剤(Botanical IGR)(Neemazad(登録商標) + TX、Neemix(登録商標)) + TX、ナタネ油(Lilly Miller Vegol(登録商標)) + TX、アメリカアリタソウ(Chenopodium ambrosioides near ambrosioides)(Requiem(登録商標)) + TX、キク属(Chrysanthemum)抽出物(Crisant(登録商標)) + TX、ニーム油の抽出物(Triology(登録商標)) + TX、シソ科植物(Labiatae)の精油(Botania(登録商標)) + TX、クローブローズマリーペパーミントおよびタイム油の抽出物(Garden insect killer(登録商標)) + TX、グリシンベタイン(Greenstim(登録商標)) + TX
 10
 、ニンニク+TX、レモングラス油(GreenMatch(登録商標)) + TX、ニーム油+TX、イヌハッカ(Nepeta cataria)(キャットニップ油)+TX、イヌハッカ(Nepeta catarina)+TX、ニコチン+TX、オレガノ油(MossBuster(登録商標)) + TX、ゴマ科植物(Pedaliaceae)油(Nematon(登録商標)) + TX、除虫菊+TX、シャボンノキ(Quillaja saponaria)(NemaQ(登録商標)) + TX、オオイタドリ(Reynoutria sachalinensis)(Regalia(登録商標)) + TX、
 Sakalia(登録商標)) + TX、口テノン(Eco Roten(登録商標)) + TX、ミカン科植物(Rutaceae)抽出物(Soleo(登録商標)) + TX、大豆油(Ortho ecosense(登録商標)) + TX、ティーツリー油(Timor rex Gold(登録商標)) + TX、タイム油+TX、AGNIQUE(登録商標)
 20
 MMF+TX、BugOil(登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパーミントタイムおよびシナモン抽出物の混合物(EF 300(登録商標)) + TX、クローブローズマリーおよびペパーミント抽出物の混合物(EF 400(登録商標)) + TX、クローブペパーミントニンニク油およびミントの混合物(Soil Shot(登録商標)) + TX、カオリン(Screen(登録商標)) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン(Laminarin(登録商標)) ; および

以下のものを含むフェロモン：クロネハイイロヒメハマキ(blackheaded fireworm)フェロモン(3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone(登録商標)) + TX、コドリンガ(Codling Moth)フェロモン(Paramount dispenser-(CM)/Isomate C-Plus(登録商標)) + TX、グレープベリーモス(Grape Berry Moth)フェロモン(3M MEC-GBM Sprayable Pheromone(登録商標)) + TX、ハマキガ科のガ(Leafroller)フェロモン(3M MEC-LR Sprayable Pheromone(登録商標)) + TX、ムスカモン(Snipp Fly Bait(登録商標)) + TX、Starbar Premium Fly Bait(登録商標)) + TX、ナシヒメシンクイ(Oriental Fruit Moth)フェロモン(3M oriental fruit moth sprayable pheromone(登録商標)) + TX、スカシバガ科のガ(Peachtree Borer)フェロモン(Isomate-P(登録商標)) + TX、トマトピンワーム(Tomato Pinworm)フェロモン(3M Sprayable pheromone(登録商標)) + TX、Entostat粉末(ヤシの木からの抽出物)(Exosex CM(登録商標)) + TX、(E+TX, Z+TX, Z) - 3 + TX, 8 + TX, 11 + TX, 11 + TX, 13 - ヘキサデカトリエナール+TX、(Z+TX, Z+TX, E) - 7 + TX, 11 + TX, 13 - ヘキサデカトリエナール+TX、(E+TX, Z) - 7 + TX, 9 - ドデカジエンジエン-1-イルアセテート+TX、2-メチル-1-ブタノール+TX、酢酸カルシウム+TX、Scenturion(登録商標) + TX、Bioulure(登録商標) + TX、Check-Mate(登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオアート(Lavandulyl senecioate) ; および

30
 40
 50

以下のものを含む生物 (Macrobia ls) : アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus - System (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus papaya) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia - System (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標)) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Agenia spis citricola) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標)) + TX、Andersoni - System (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標)) + TX、Spical (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thripex (登録商標)) + TX、Bugline cucumeris (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (Amblyseius fallacis) (Fallacis (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・スヴィルスキイ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標)) + TX、Swirskii - Mite (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ウォマースレイ (Amblyseius womersleyi) (WomerMite (登録商標)) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) + TX、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) + TX、アナギルス・フシベントリス (Anagyrus fusciventris) + TX、アナギルス・カマリ (Anagyrus kamali) + TX、アナギルス・ロエッキ (Anagyrus loeckei) + TX、アナギルス・シュードコッカス (Anagyrus pseudococcii) (Citripar (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus beneficess) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris - System (登録商標)) + TX、アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標)) + TX、Aphiline (登録商標)) + TX、アフェリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Aphipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuensis) + TX、アフィジウス・マトリカラ (Aphidius matricariae) (Aphipar - M (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標)) + TX、アフィチス・リングナネンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、アフィチス・メリヌス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツス・ヘゲノワイイ (Prostocetus hagenowi) + TX、アセタ・コリアリア (Atheta coriaria) (Staphylinae (登録商標)) + TX、マルハナバチ属 (Bombus spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標)) + TX、Tripol (登録商標)) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、チノコルス・ニグリツス (Chilocorus nigeritus) + T 10
20
30
40
50

X、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysoline* (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysopa* (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフィラブリス (*Chrysoperla rufilabris*) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (*Cirrospilus ingenuus*) + TX、シロスピルス・クアドリストリアツス (*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、シトロスチクス・フィロクニストイデス (*Citrostichus phylloconistoides*) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (*Cladosterocerus chamaeleon*) + TX、クロステロセルス属 (*Cladosterocerus spp.*) + TX、コシドキセノイデス・ペルミヌツス (*Coccidoxenoides permintus*) (*Planopar* (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (*Coccophagus cowperi*) + TX、コッコファグス・リシムニア (*Coccophagus lycomnia*) + TX、キアシサムライコマユバチ (*Cotesia flavigipes*) + TX、コナガサムライコマユバチ (*Cotesia plutellae*) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (*Cryptobug* (登録商標)) + TX、*Cryptolin*e (登録商標) + TX、キムネタマキスイ (*Cybocephalus nipponicus*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*Minusa* (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Diminex* (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus pusillus*) + TX、ディアカスミモルファ・クラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) + TX、ディアカスミモルファ・ロンギカウダタ (*Diachasmimorpha longicaudata*) + TX、ディアパルシス・ジュクンダ (*Diaparsis jucunda*) + TX、ディアホレンシルツス・アリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標)) + TX、*Digline* (登録商標) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標)) + TX、*Minex* (登録商標) + TX、ディベルシネルブス属 (*Diversinervus spp.*) + TX、エンカルシア・シトリナ (*Encarsia citrina*) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標)) + TX、*Encarline* (登録商標) + TX、*En-Strip* (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウバエ (*Encarsia guadeloupae*) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (*Encarsia haitiensis*) + TX、ホソヒラタアブ (*Episyphus balteatus*) (*Syrphidend* (登録商標)) + TX、エレトモセリス・シフォニニ (*Eretmoceris siphonini*) + TX、エレトモセルス・カリフォルニクス (*Eretmocerus californicus*) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Ercal* (登録商標)) + TX、*Eretline e* (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Bemimix* (登録商標)) + TX、エレトモセルス・ハヤチ (*Eretmocerus hayati*) + TX、エレトモセルス・ムンヅス (*Eretmocerus mundus*) (*Bemipar* (登録商標)) + TX、*Eretline m* (登録商標) + TX、エレトモセルス・シフォニニ (*Eretmocerus siphonini*) + TX、エキソコムス・クアドリップスツラツス (*Exochomus quadrripustulatus*) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (*Feltiell* 50

a acarisuga) (Spidend (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Feltiiline (登録商標)) + TX、フォピウス・アリサヌス (Fopius arisanus) + TX、フォピウス・セラチチボルス (Fopius ceratitivorus) + TX、ホルモノネチン (Wireless Beehome (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (Franklinothrips vespiformis) (Vespop (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (Galendromus occidentalis) + TX、ゴニオズス・レグネリ (Goniozus legneri) + TX、シマメイガコマユバチ (Habrobracon hebetor) + TX、ナミテントウ (Harmonia axyridis) (HarmoBeetle (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (Heterorhabditis spp.) (Lawn Patrol (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (Heterorhabditis bacteriophora) (Nemashield HB (登録商標)) + TX、Nemaseek (登録商標) + TX、Terranem-Nam (登録商標) + TX、Terranem (登録商標) + TX、Larvanem (登録商標) + TX、B-Green (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nematop (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・メジディス (Heterorhabditis megidis) (Nemasys H (登録商標)) + TX、BioNem H (登録商標) + TX、Exhibitline hm (登録商標) + TX、Larvanem-M (登録商標)) + TX、サカハチントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer-System (登録商標)) + TX、Entomite-A (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標)) + TX、Entomite-M (登録商標)) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Labalia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (Leucanoides floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンヅス (Lemophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Lep 30
tomastidea abnormis) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エポナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophantiae) + TX、リポレクシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標)) + TX、リシフレブス・テスタケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノスス (Macrolophus caliginosus) (Miriical-N (登録商標)) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Miriical (登録商標)) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulus longipes) + TX、メタフィクス・フラブス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンスブリイ (Metaphycus louensis) + TX、ミクロムス・アングラツス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標)) + TX、ミクロテリス・フラブス (Microterys flavus) + TX、ムスシディフラクス・ラポトレルス (Muscidi furax raptorellus) およびスパランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登録商標)) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・ククメリス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX 40
50

、ネシディオコリス・テヌイス (*Nesideocoris tenuis*) (*Nesi dio Bug* (登録商標) + TX、*Nesibug* (登録商標)) + TX、オフィラ・アエセンス (*Ophyra aenescens*) (*Biofly* (登録商標)) + TX
 、シノビハナカメムシ (*Orius insidiosus*) (*Thripo - I* (登録商標) + TX、*Orioline i* (登録商標)) + TX、エルヒメハナカメムシ (*Orius laevigatus*) (*Thripo - L* (登録商標) + TX、*Orioline l* (登録商標)) + TX、オリウス・マジュスクルス (*Orius majus culus*) (*Orioline m* (登録商標)) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (*Orius strigicollis*) (*Thripo - S* (登録商標)) + TX、
 パウエシア・ジュニペロルム (*Pauesia juniperorum*) + TX、ペデ 10
 イオビウス・ホベオレツス (*Pediobius foveolatus*) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (*Phasmarrhabditis hermaphrodita*) ((*Nemaslug* (登録商標)) + TX、フィマスティクス・コフェア (*Phymastichus coffea*) + TX、フイトセイウルス・マクロピルス (*Phytoseiulus macropilus*) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (*Spidex* (登録商標) + TX、*Phytoline p* (登録商標)) + TX、ポディスス・マクリベントリス (*Podisus maculiventris*) (*Podisus* (登録商標)) + TX、
 シューダクテオン・クルバツス (*Pseudacteon curvatus*) + TX、
 シューダクテオン・オブツスス (*Pseudacteon obtusus*) + TX、シ 20
 ューダクテオン・トリクスピス (*Pseudacteon tricuspis*) + TX
 、シユーダフィクス・マクリベンニス (*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、シユードレプトマスティクス・メキシカーナ (*Pseudoleptomastix mexicana*) + TX、サイラエファグス・ピロスス (*Psyllae phagus pilosus*) + TX、サイタリア・コンコロル (*Psyttalia concolor*) (複合体) + TX、クアドラスティクス属 (*Quadrastichus spp.*) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (*Rhyzobius lophanthae*) + TX、ベダリアテントウ (*Rodolia cardinalis*) + TX、オオクビキレガイ (*Rumina decollata*) + TX、セミエラケア・ペティオラツス (*Semielacher petiolatus*) + TX、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (*Ervibank* (登録商標)) + TX、スタイナー・カルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (*Nematac C* (登録商標) + TX、*Millenium* (登録商標) + TX、*BioNem C* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemastar* (登録商標) + TX、*Capsanem* (登録商標)) + TX、スタイナー・ネマ・フェルティニアエ (*Steinernema feltiae*) (*NemaShield* (登録商標) + TX、*Nemasy F* (登録商標) + TX、*BioNem F* (登録商標) + TX、*Steinernema - System* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemaplus* (登録商標) + TX、*Exhibitline sf* (登録商標) + TX、*Scia - rid* (登録商標) + TX、*Entonem* (登録商標)) + TX、スタイナー・ネマ・クラッセイ (*Steinernema kraussei*) (*Nemasy L* (登録商標) + TX、*BioNem L* (登録商標) + TX、*Exhibitline sr b* (登録商標)) + TX、スタイナー・ネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (*BioVector* (登録商標) + TX、*BioVektor* (登録商標)) + TX、スタイナー・ネマ・スカブテリシ (*Steinernema scapterisci*) (*Nematac S* (登録商標)) + TX、スタイナー・ネマ属 (*Steinernema spp.*) + TX、スタイナー・ネマチド属 (*Steinernematid spp.*) (*Guardian Nemato des* (登録商標)) + TX、ステトルス・プンクチルム (*Stethorus punctillum*) (*Stethorus* (登録商標)) + TX、タマリキシア 40
 50

・ラジアタ (*Tamarixia radiate*) + TX、テトラスティクス・セティファー (*Tetrastichus setifer*) + TX、トリポビウス・セミルテウス (*Thripobius semiluteus*) + TX、トリムス・シネンシス (*Torymus sinensis*) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricholime b* (登録商標)) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricho-Strip* (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (*Trichogramma evanescentis*) + TX、トリコグラムマ・ミヌツム (*Trichogramma minutum*) + TX、アワノメイガタマゴバチ (*Trichogramma ostriniae*) + TX、トリコグラムマ・プラトネリ (*Trichogramma platneri*) + TX、トリコグラムマ・プレチオスム (*Trichogramma pretiosum*) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla stemmator*) ; および 10

以下のものを含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 + TX、bioSea (登録商標) + TX、コンドロステレウム・ブルプレウム (*Chondrostereum purpureum*) (*Control Paste* (登録商標)) + TX、コレトトリクム・グレオスピリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioide*s) (*Collego* (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (*Cueva* (登録商標)) + TX、デルタトラップ (*Trapline d* (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハーピン) (*ProAct* (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標)) + TX、リン酸第二鉄 (*Ferric phosphate*) (*Ferramol* (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (*Trapline y* (登録商標)) + TX、Galleex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (*Homobrassonolide*) + TX、リン酸鉄 (*Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait* (登録商標)) + TX、MCP hailトラップ (*Trapline f* (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (*Microctonus hyperodae*) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (*Mycoleptodiscus terrestris*) (*Des-X* (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Aminomite (登録商標) + TX、ZenoX (登録商標) + TX、フェロモントラップ (*Tripline ams* (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (*MilStop* (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (*Sanova* (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (*Sil-Matrix* (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアソニ酸カリウム (*Enzicur* (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (*Nosema locustae*) (*Seaspore Organic Grasshopper Control* (登録商標)) + TX、粘着トラップ (*Trapline YF* (登録商標)) + TX、Rebel 1 Amariillo (登録商標)) + TX およびトラップ (*Taki trapline y + b* (登録商標)) + TX。 30 40

【0369】

活性成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば、[3878 - 19 - 1] は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。上記の混合の相手は公知である。活性成分が、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会 (The British Crop Protection Council)] に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号 (1) で記載されている。「[CCN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化 50

合物は、“Compendium of Pesticide Common Names”に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, (著作権) 1995 - 2004]; 例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス: <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>に記載されている。

【0370】

上記の活性成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」または別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され; その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクト名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」または「開発コード」が使用され、あるいはそれらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。

【0371】

表1～10から選択される式Iの化合物と、上記の活性成分との活性成分混合物は、表1～10から選択される化合物および上記の活性成分を、好ましくは、100:1～1:6000、特に、50:1～1:50の混合比で、より特に、20:1～1:20、さらにより特に、10:1～1:10、非常に特に、5:1および1:5の比率で(2:1～1:2の比率が特に好ましく、4:1～2:1の比率が同様に好ましい)、とりわけ、1:1、または5:1、または5:2、または5:3、または5:4、または4:1、または4:2、または4:3、または3:1、または3:2、または2:1、または1:5、または2:5、または3:5、または4:5、または1:4、または2:4、または3:4、または1:3、または2:3、または1:2、または1:600、または1:300、または1:150、または1:35、または2:35、または4:35、または1:75、または2:75、または4:75、または1:6000、または1:3000、または1:1500、または1:350、または2:350、または4:350、または1:750、または2:750、または4:750の比率で含む。これらの混合比は、重量基準である。

【0372】

上記の混合物は、有害生物を防除するための方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物またはその環境に施用する工程を含むが、手術または治療によるヒトまたは動物の身体の治療のための方法およびヒトまたは動物の身体において実施される診断方法を除く。

【0373】

表1～10から選択される式Iの化合物と、上記の1つまたは複数の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス(ready-mix)形態で、「タンクミックス」などの単一の活性成分の別個の製剤から構成される組み合わされたスプレー混合物として、および逐次、すなわち、数時間または数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の活性成分の併用で施用され得る。表1～10から選択される式Iの化合物および上記の活性成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

【0374】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば、非エポキシ化またはエポキシ化植物油(例えばエポキシ化ヤシ油、ナタネ油または大豆油)、消泡剤、例えば、シリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤および/または粘着付与剤、肥料または特定の効果を得るために他の活性成分、例えば、殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤または除草剤などのさらなる固体または液体助剤も含み得る。

【0375】

本発明に係る組成物は、例えば、固体活性成分を粉碎し、篩にかけ、および/または圧縮することにより助剤の非存在下で、および例えば活性成分を1つまたは複数の助剤と均

10

20

30

40

50

質混合し、および／または粉碎することにより、少なくとも1つの助剤の存在下でそれ自身公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれら的方法およびこれらの組成物の調製のための化合物Iの使用も本発明の主題である。

【0376】

この組成物のための施用方法、すなわち、噴霧、霧化(atomizing)、散布、はけ塗り(brushing on)、粉衣(dressing)、拡散(scattering)または注ぎかけ(pouring)（これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである）など、上記のタイプの有害生物を防除する方法および上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1～1000 ppm、好ましくは、0.1～500 ppmの活性成分である。ヘクタール当たりの施用量は、一般に、ヘクタール当たり1～2000 gの活性成分、特に、10～1000 g/h a、好ましくは、10～600 g/h aである。10

【0377】

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用（葉面施用）であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度および施用量を選択することができる。あるいは、活性成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することにより、または固体形態の活性成分を植物の生息地、例えば土壤中に、例えば粒剤の形態で導入すること（土壤施用）により、根系（全身作用）を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。20

【0378】

本発明の化合物およびその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば、果実、塊茎または穀粒などの種子、または苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。あるいは、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することにより、または固体組成物の層を塗布することにより、種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を、例えば、ドリルまき(drilling)の際に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法およびこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物および防除される有害生物／真菌に応じて決まり、一般に、100 kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは、100 kgの種子当たり5～150グラム（100 kgの種子当たり10～100グラムなど）である。30

【0379】

種子という用語は、真正種子(true seed)、種子片、吸枝、トウモロコシ粒(corn)、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽(cut shoot)などを含むがこれらに限定されないあらゆる種類の種子および植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

【0380】

本発明は、式Iの化合物で被覆または処理されるかあるいはそれを含有する種子も含む。「で被覆または処理されるかおよび／またはそれを含有する」という用語は、一般に、活性成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、活性成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式Iの化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、式Iの化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。40

【0381】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬および種子ペレッティング(peeling)など、当該技術分野において公知の全ての好適な種子処理技術を含む。式Iの化合物の種子処理適用は、種まきの前または種まき／種子の植え付けの際に噴霧または種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。50

【0382】

生物学的実施例：

実施例B1：タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*) (ワタコナジラミ) に対する活性：摂食 / 接触活性：

ワタ葉片を24ウェルマイクロタイプレート中の寒天上に置き、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片にコナジラミ成虫を外寄生させた。試料をインキュベーションの6日後の死亡率について調べた。

【0383】

以下の化合物：A8、A9、A27、A28、A29、A31、A32、A33、A4 10
5、A47、A49、A50、A58およびA59は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0384】

実施例B2：ディアプロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) (トウモロコシハムシ) に対する活性：

24ウェルマイクロタイプレート中の寒天層上に置かれたトウモロコシの芽を噴霧により10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫(ウェル当たり6~10匹)を外寄生させた。試料を外寄生の4日後の非処理の試料と比較した死亡率および成長阻害について評価した。

【0385】

以下の化合物：A1、A2、A3、A4、A5、A6、A8、A9、A11、A19、A20、A21、A22、A23、A24、A25、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A35、A36、A37、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A50、A51、A52、A58およびA59は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリー(死亡率または成長阻害)の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

【0386】

実施例B3：ユースキスツス・ヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルチャイロカメムシ (*Neotropical Brown Stink Bug*)) に対する活性：

24ウェルマイクロタイプレート中の寒天上のダイズの葉に10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉にN2若虫を外寄生させた。試料を外寄生の5日後の非処理の試料と比較した死亡率および成長阻害について評価した。

【0387】

以下の化合物：A1、A2、A3、A6、A8、A9、A11、A12、A14、A15、A17、A19、A21、A22、A23、A24、A25、A26、A27、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A34、A36、A37、A40、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A50、A51、A52、A58およびA59は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリー(死亡率または成長阻害)の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

【0388】

実施例B4：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ) に対する活性：摂食 / 接触活性：

ヒマワリ葉片を24ウェルマイクロタイプレート中の寒天上に置き、10'000 DMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な齢数のフランクリニエラ属 (*Frankliniella*) 個体群を外寄生させた。試料を外寄生の7日後の死亡率について評価した。

【0389】

以下の化合物：A9、A29、A31、A33、A37およびA51は、200 ppm 50

の施用量で少なくとも 80% の死亡率をもたらした。

【0390】

実施例 B5：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性：摂食 / 接触活性：

ヒマワリ葉片を 24 ウェルマイクロタイプレート中の寒天上に置き、10'000 ppm の DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。試料を外寄生の 6 日後の死亡率について評価した。

【0391】

以下の化合物：A3、A5、A6、A8、A9、A11、A12、A14、A15、A19、A21、A22、A23、A24、A27、A28、A29、A31、A32、A33、A35、A36、A37、A40、A42、A43、A45、A47、A49、A50、A51、A58 および A59 は、200 ppm の施用量で少なくとも 80% の死亡率をもたらした。10

【0392】

実施例 B6：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性。全身活性：

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウマメの苗の根を 10'000 DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液に直接入れた。試料を、苗を試験溶液に入れた 6 日後の死亡率について評価した。20

【0393】

以下の化合物：A8、A9、A11、A12、A15、A19、A20、A22、A27、A32、A33、A34、A35、A36、A37 および A59 は、24 ppm の試験量で少なくとも 80% の死亡率をもたらした。

【0394】

実施例 B7：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) に対する活性。固有活性：

10'000 ppm の DMSO ストック溶液から調製された試験化合物をピペットによって 24 ウェルマイクロタイプレートに入れ、スクロース溶液と混合した。プレートを伸張したパラフィルムで閉じた。24 個の穴を開けたプラスチックステンシルをプレート上に置き、外寄生させたエンドウマメの苗を直接パラフィルム上に置いた。外寄生させたプレートをゲル吸取紙および別のプラスチックステンシルで閉じ、次に上下を逆にした。試料を外寄生の 5 日後の死亡率について評価した。30

【0395】

以下の化合物：A3、A21、A22、A23、A24 および A58 は、12 ppm の試験量で少なくとも 80% の死亡率をもたらした。

【0396】

実施例 B8：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ) に対する活性：

人工飼料の入った 24 ウェルマイクロタイプレートをピペットにより 10'000 ppm の DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに L2 幼虫 (ウェル当たり 10 ~ 15 匹) を外寄生させた。試料を外寄生の 5 日後の非処理の試料と比較した死亡率および成長阻害について評価した。40

【0397】

以下の化合物：A3、A4、A5、A6、A8、A9、A12、A15、A16、A21、A22、A23、A24、A28、A29、A30、A31、A32、A33、A36、A37、A39、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A50、A51、A52、A58 および A59 は、200 ppm の施用量で 2 つのカテゴリー (死亡率または成長阻害) の少なくとも 1 つが少なくとも 80% の効果を示した。50

【0398】

実施例B9：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ）に対する活性：

ワタ葉片を24ウェルマイクロタイプレート中の寒天上に置き、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に5匹のL1幼虫を外寄生させた。試料を外寄生の3日後の非処理の試料と比較した死亡率、摂食阻害効果、および成長阻害について評価した。試験試料によるエジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）の防除は、死亡率、摂食阻害効果、および成長阻害のカテゴリーの少なくとも1つが非処理の試料より高い場合に示される。

【0399】

10

以下の化合物：A3、A5、A6、A7、A9、A19、A21、A22、A24、A28、A29、A31、A32、A33、A37、A40、A41、A42、A43、A44、A45、A46、A47、A48、A49、A50、A51、A52、A58およびA59は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした。

【0400】

実施例B10：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ）に対する活性：

10'000 ppmのDMSOストック溶液からの試験化合物をピペットによって24ウェルプレートに入れ、寒天と混合した。レタス種子を寒天上に置き、マルチウェルプレートを、同様に寒天を含む別のプレートによって閉じた。7日後、根が化合物を吸収しており、レタスは蓋プレート中へと成長していた。次に、レタス葉を切り取って蓋プレート中に入れた。スピドロテラ属（*Spodoptera*）の卵をプラスチックステンシルを介して湿ったゲル吸取紙上にピペットで取り、蓋プレートをこの吸取紙で閉じた。試料を外寄生の6日後の非処理の試料と比較した死亡率、摂食阻害効果および成長阻害について評価した。

20

【0401】

以下の化合物：A6、A9、A19、A22、A24、A29、A31、A32、A40、A42、A43、A45、A47、A49、A50およびA59は、12.5 ppmの試験量で3つのカテゴリー（死亡率、摂食阻害、または成長阻害）の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

30

【0402】

実施例B11：ハダニ（*Tetranychus urticae*）（ナミハダニ）に対する活性：摂食 / 接触活性：

24ウェルマイクロタイプレート中の寒天上のインゲンマメ葉片に10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な齢数のダニ個体群を外寄生させた。試料を外寄生の8日後の混合個体群（可動状態）における死亡率について評価した。

【0403】

以下の化合物：A4、A5、A6、A7、A24、A43およびA45は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

40

【0404】

実施例B12：ネギアザミウマ（*Thrips tabaci*）（ネギアザミウマ）に対する活性 摂食 / 接触活性：

ヒマワリ葉片を24ウェルマイクロタイプレート中の寒天上に置き、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な齢数のアザミウマ個体群を外寄生させた。試料を外寄生の6日後の死亡率について評価した。

【0405】

以下の化合物：A9、A29、A32、A51およびA59は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

50

【0406】

実施例B13：ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）（黄熱病蚊）に対する活性：

試験溶液をエタノール中200ppmの施用量で12ウェル組織培養プレートに入れた。堆積物を乾燥させてから、5匹の2～5日齢の雌成虫ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）を各ウェルに加え、脱脂綿の塊中の10%のスクロース溶液で育てた。ノックダウンの評価を導入の1時間後に行い、死亡率を導入の24時間後および48時間後に評価した。

【0407】

以下の化合物：A6、A8、A9、A22、A24、A28、A29、A31、A32、A39、A40、A41、A42、A45、A46、A47、A49、A51およびA52は、48時間後および／または24時間後のネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）の少なくとも80%の防除を示した。 10

【0408】

実施例B14：ハマダラカ（*Anopheles stephensi*）（インドマラリア蚊（*Indian malaria mosquito*））に対する活性：

試験溶液をエタノール中200ppmの施用量で12ウェル組織培養プレートに入れた。堆積物を乾燥させてから、5匹の2～5日齢の雌成虫ハマダラカ（*Anopheles stephensi*）を各ウェルに加え、脱脂綿の塊中の10%のスクロース溶液で育てた。ノックダウンの評価を導入の1時間後に行い、死亡率を導入の24時間後および48時間後に評価した。 20

【0409】

以下の化合物：A6、A9、A22、A24、A40、A45、A46、A47、A49、A51およびA52は、48時間後および／または24時間後のハマダラカ（*Anopheles stephensi*）の少なくとも80%の防除を示した。

フロントページの続き

| | | |
|-------------|-----------|-----------------|
| (51)Int.Cl. | F I | |
| A 01N 43/90 | (2006.01) | A 01P 7/02 |
| A 01N 47/02 | (2006.01) | A 01P 7/04 |
| A 01N 43/52 | (2006.01) | A 01N 43/90 104 |
| A 01M 1/20 | (2006.01) | A 01N 47/02 |
| | | A 01N 43/52 |
| | | A 01M 1/20 A |

(74)代理人 100119013
弁理士 山崎 一夫

(74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信

(74)代理人 100196405
弁理士 小松 邦光

(72)発明者 ユング ピエール ヨーゼフ マルセル
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ヒューター オットオマー フランツ
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

(72)発明者 エドマンズ アンドリュー
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ミューレバッハ ミシェル
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

(72)発明者 カッサイル ジェローム イヴ
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ホール ロジャー グレアム
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ジャンゲナ アンドレ
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジエンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アクチエンゲゼルシャフト内

審査官 伊藤 幸司

(56)参考文献 特開2013-136519(JP,A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 07D
A 01N
A 01P
A 01M
C A P L U S / R E G I S T R Y (S T N)