

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6285090号
(P6285090)

(45) 発行日 平成30年2月28日(2018.2.28)

(24) 登録日 平成30年2月9日(2018.2.9)

(51) Int. Cl.	F I
CO7D 231/12 (2006.01)	CO7D 231/12 B
AO1N 43/56 (2006.01)	AO1N 43/56 C
AO1P 3/00 (2006.01)	AO1P 3/00
CO7D 231/38 (2006.01)	CO7D 231/38 CSPZ

請求項の数 9 (全 173 頁)

(21) 出願番号	特願2011-553063 (P2011-553063)	(73) 特許権者	390023674 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・ アンド・カンパニー E. I. DU PONT DE NEMO URS AND COMPANY アメリカ合衆国デラウェア州19805. ウィルミントン、センターロード974. ピー・オー・ボックス2915、チェスナ ット・ラン・プラザ
(86) (22) 出願日	平成22年3月3日(2010.3.3)	(74) 代理人	100127926 弁理士 結田 純次
(65) 公表番号	特表2012-519693 (P2012-519693A)	(74) 代理人	100140132 弁理士 竹林 則幸
(43) 公表日	平成24年8月30日(2012.8.30)		
(86) 国際出願番号	PCT/US2010/026003		
(87) 国際公開番号	W02010/101973		
(87) 国際公開日	平成22年9月10日(2010.9.10)		
審査請求日	平成25年2月21日(2013.2.21)		
審判番号	不服2015-9304 (P2015-9304/J1)		
審判請求日	平成27年5月20日(2015.5.20)		
(31) 優先権主張番号	61/157,046		
(32) 優先日	平成21年3月3日(2009.3.3)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		
(31) 優先権主張番号	61/304,053		
(32) 優先日	平成22年2月12日(2010.2.12)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

最終頁に続く

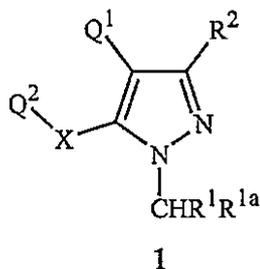
(54) 【発明の名称】 殺菌・殺カビ性ピラゾール

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1から選択される化合物、そのN-オキシドまたは塩

【化1】



〔式中、

Q¹は、各々がR³から独立して選択される1~4個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルであるが；ただし、R³置換基がメタ位に位置する場合は、該R³置換基は、F、Cl、Brおよびシアノから選択され；

Q²は、各々がR³から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルであるが、ただし、R³置換基がメタ位に位置する場合は、該R³置換基は、F、Cl、Brおよびシアノから選択され；

Xは、NR⁴またはCR¹⁵R¹⁶であり；

R^1 は、Hであり；
 R^{1a} は、Hであり；
 R^2 は、 CH_3 であり；
 各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシから選択され；
 R^4 は、Hであり；
 R^{15} は、H、であり；
 R^{16} は、OR¹⁸であり；
 R^{18} は、Hである]。

【請求項2】

10

Q^1 が、各々が R^3 から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Q^1 および Q^2 の少なくとも一方が、 R^3 から独立して選択される2個または3個の置換基で置換されているフェニルである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

Q^1 が、2位、4位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または2位および4位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または2位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

20

Q^2 が、2位、4位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または2位および4位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または2位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；そして

各 R^3 が、独立して、F、Cl、Br、シアノ、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシから選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

各 R^3 が、独立して、F、Cl、Br、シアノ、メチル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシおよびフルオロメトキシから選択される、請求項4に記載の化合物。

30

【請求項6】

各 R^3 が、独立して、F、Cl、Br、シアノおよびメトキシから選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

Q^1 が、2位および4位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

Q^2 が、2位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

Xが、NR⁴であり；

各 R^3 が、独立して、F、Cl、Brおよびシアノから選択され；そして

40

R^4 がHである、

請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

群：

4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、

N - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、

4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - N - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、

50

4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール、
 N, 4 - ビス(2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]アミノ] - 3, 5 - ジフルオロベンゾニトリル、
 N - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 3 - クロロ - 4 - [[5 - [(4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル)アミノ] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル]ベンゾニトリル、
 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 4 - ジクロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (4 - プロモ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、
 N - (4 - プロモ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、

10

20

30

40

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミンである、請求項 1 に記

50

載の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、一定のピラゾール、そのN - オキシド、塩および組成物、ならびに、殺菌・殺カビ剤としてのそれらの使用方法に関する。

【背景技術】

【0002】

真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害の防除は、高い作物効率を達成するためにきわめて重要である。観葉植物、野菜、圃場、穀類、および、果実作物に対する植物病害による損害は、生産性を著しく低下させ、これにより、消費者に対するコストの増加をもたらされる可能性がある。これらの目的のために多くの製品が市販されているが、より効果的であり、より安価であり、毒性が低く、環境的に安全であり、または、異なる作用部位を有する新規の化合物に対する要求が継続してある。特許文献1は、殺虫剤、除草剤および殺菌・殺カビ剤としてN - フェニルピラゾリルアミンおよびN - ピリジルピラゾリルアミン誘導体を開示するが；しかしながら、本発明の殺菌・殺カビ剤はこの公報においては開示されていない。

10

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】特開平8 - 208320号公報

20

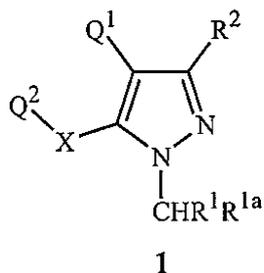
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0004】

本発明は、式1の化合物（すべての幾何異性体および立体異性体を含む）、そのN - オキシドおよび塩、これらを含む農学的組成物、ならびに、殺菌・殺カビ剤としてのこれらの使用に関する。

【化1】



30

【0005】

式中、

Q¹ は、フェニル環またはナフタレニル環系であって、各環または環系は、任意により、R³ から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているか；または、5員~6員完全不飽和複素環または8員~10員芳香族複素環系二環系であって、各環または環系は、炭素原子、ならびに、2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される4個以下のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素環員はC(=O)およびC(=S)から独立して選択され、ならびに、硫黄原子環員はS(=O)_u(=NR¹⁴)_vから独立して選択され、各環または環系は、任意により、炭素原子環員上のR³ から独立して選択される5個以下の置換基で置換され、ならびに、窒素原子環員上のシアノ、C₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₆シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₂~C₆アルコキシアルキル、C₂~C₆アルキルカルボニル、C₂~C₆アルコキシカルボニル、C

40

50

$C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキルおよび $C_3 \sim C_6$ ジアルキルアミノアルキルから選択され；

Q^2 は、フェニル環またはナフタレニル環系であって、各環または環系は、任意により、 R^3 から独立して選択される5個以下の置換基で置換されているか；または、5員～6員飽和、部分飽和あるいは完全不飽和複素環、または、8員～10員芳香族複素環式二環系であって、各環または環系は、炭素原子、ならびに、2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される4個以下のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、ならびに、硫黄原子環員は $S(=O)_u(NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環または環系は、任意により、炭素原子環員上の R^3 から独立して選択される5個以下の置換基で置換され、ならびに、窒素原子環員上のシアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキルおよび $C_3 \sim C_6$ ジアルキルアミノアルキルから選択されるか；または、 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル、 $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキルあるいは $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルケニルから選択され、各々は、任意により、 R^3 から独立して選択される5個以下の置換基で置換されており；

X は、 O 、 $S(O)_m$ 、 NR^4 、 $CR^{15}R^{16}$ 、 $C(=O)$ または $C(=S)$ であり；

R^1 は、 H 、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 CO_2R^5 、 $C(O)NR^6R^7$ 、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシあるいは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルであるか；または

R^1 は、3個以下の R^8 で任意により置換されているフェニルであるか；または、炭素原子環員上の R^9^a および窒素原子環員上の R^9^b から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている5員または6員窒素含有芳香族複素環であり；

R^{1a} は H であり；または

R^{1a} および R^1 は、これらが結合している炭素原子と一緒にあって、ハロゲンおよびメチルから独立して選択される2個以下の置換基で任意により置換されているシクロプロピル環を形成し；

R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、ハロゲン、シアノ、シアノメチル、ハロメチル、ヒドロキシメチル、メトキシあるいはメチルチオであるか；または、ハロゲンおよびメチルから独立して選択される2個以下の置換基で任意により置換されているシクロプロピルであり；

各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、ホルミルアミノ、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルコキシ、 $C_4 \sim C_6$ アルキルシクロアルキル、 $C_4 \sim C_6$ シクロアルキルアルキル、 $C_3 \sim C_7$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキルカルボニルオキシ、 $-SF_5$ 、 $-SCN$ 、 $C(=S)NR^{19}R^{20}$ または $-U-V-T$ から選択され；

R^4 は、 H 、ホルミル、 $C_2 \sim C_5$ アルケニル、 $C_3 \sim C_5$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-SO_3^-M^+$ 、 $-S(=O)_tR^{10}$ 、 $-(C=W)R^{11}$ 、 NH_2 あるいは OR^{21} であるか；または、各々が2個以下の R^{12} で任意により置換されている、 $C_1 \sim C_6$ アルキルもしくは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

10

20

30

40

50

R^5 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

R^6 および R^7 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルアルキルおよび $C_4 \sim C_8$ アルキルシクロアルキルから独立して選択されるか；または

R^6 および R^7 は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、炭素原子と、任意によりO、 $S(O)_n$ および NR^{13} から選択される1個以下の環員とから選択される環員を、前記結合している環窒素原子に追加して含有している4員～7員非芳香族複素環を形成し；

各 R^8 、 R^{9a} および R^{9b} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、SCH₃、 $S(O)CH_3$ および $S(O)_2CH_3$ から選択され；

10

R^{10} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

各 R^{11} は、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_7$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルキルアミノアルキル、 $C_3 \sim C_8$ ジアルキルアミノアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオまたは $C_2 \sim C_7$ アルキルチオアルキルであり；

各 R^{12} は、独立して、 $C_3 \sim C_7$ 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またはシアノであり；

R^{13} は、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

各 R^{14} は、独立して、H、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

20

R^{15} は、H、 $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは OR^{18} であり；

R^{16} は、 $C_1 \sim C_4$ アルキルもしくは OR^{18} であるか；または

R^{15} および R^{16} は、一緒になって $-OCH_2CH_2O-$ とされ；

各 R^{18} は、独立して、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-SO_3^-M^+$ あるいは $-(C=W)R^{11}$ であるか；または、各々が2個以下の R^{12} で任意により置換されている、 $C_1 \sim C_6$ アルキルあるいは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

各 R^{19} および R^{20} は、独立して、Hまたは CH_3 であり；

R^{21} は、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $-SO_3^-M^+$ あるいは $-(C=W)R^{11}$ であるか；または、各々が2個以下の R^{12} で任意により置換されている、 $C_1 \sim C_6$ アルキルあるいは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

30

各Uは、独立して、O、 $S(=O)_w$ 、 NR^{22} または直接結合であり；

各Vは、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキレン、 $C_2 \sim C_6$ アルケニレン、 $C_3 \sim C_6$ アルキニレン、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキレンまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルケニレンであり、ここで、3個以下の炭素原子は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシから独立して選択される5個以下の置換基で各々が任意により置換されている、 $C(=O)$ から独立して選択され；

各Tは、独立して、シアノ、 NR^{23a} R^{23b} 、 OR^{24} または $S(=O)_yR^{25}$ であり、

40

各 R^{22} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ (アルキルチオ)カルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシ(チオカルボニル)、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_8$ (シクロアルキルチオ)カルボニルまたは $C_4 \sim C_8$ シクロアルコキシ(チオカルボニル)であり；

各 R^{23a} および R^{23b} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ (アルキルチオ)カルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシ(チオカルボニル)、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルコキシカルボニル

50

、 $C_4 \sim C_8$ (シクロアルキルチオ)カルボニルあるいは $C_4 \sim C_8$ シクロアルコキシ(チオカルボニル)であるか；または

同一の窒素原子に結合している一対の R^{23a} および R^{23b} は、窒素原子と一緒になって3員～6員複素環を形成しており、環は、 R^{26} から独立して選択される5個以下の置換基で任意により置換されており；

各 R^{24} および R^{25} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_3 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ (アルキルチオ)カルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシ(チオカルボニル)、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルキルカルボニル、 $C_4 \sim C_8$ シクロアルコキシカルボニル、 $C_4 \sim C_8$ (シクロアルキルチオ)カルボニルまたは $C_4 \sim C_8$ シクロアルコキシ(チオカルボニル)であり；

各 R^{26} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_1 \sim C_6$ アルコキシであり；

各Wは、独立して、OまたはSであり；

各 M^+ は、独立して、カチオンであり；

Mは0、1または2であり；

Nは0、1または2であり；

Tは0、1または2であり；

各uおよびvは、独立して、 $S(=O)_u(NR^{14})_v$ の各事例において0、1または2であるが、ただし、uおよびvの和は0、1または2であり；

各wは、独立して、0、1または2であり；ならびに

各yは、独立して、0、1または2であり；

ただし：

Q^2 が、少なくとも1つのオルト位において、-U-V-T(式中、Uは直接結合であり、Vは $C(=O)$ であり、および、Tは NR^{23a} 、 R^{23b} または OR^{24} である)から選択される置換基で置換されたフェニル環である場合、Xは NR^4 以外である。

【0006】

より具体的には、本発明は、式1の化合物(すべての幾何異性体および立体異性体を含む)、そのN-オキシドまたは塩に関する。

【0007】

本発明はまた、式1の化合物、そのN-オキシドまたは塩と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とを含む殺菌・殺カビ組成物に関する。

【0008】

本発明はまた：(a)式1の化合物、そのN-オキシドまたは塩と、(b)少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ剤(例えば、異なる作用部位を有する少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ剤)とを含む殺菌・殺カビ組成物に関する。

【0009】

本発明はさらに、植物もしくはその一部分または植物種子に、殺菌・殺カビ的に有効な量の本発明の化合物を(例えば、本明細書に記載の組成物として)適用する工程を含む真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法に関する。

【0010】

本発明はまた、式1の化合物、そのN-オキシドまたは塩と、少なくとも1種の有害無脊椎生物防除化合物または薬剤とを含む組成物に関する。

【0011】

本発明はまた、式2の化合物(すべての幾何異性体および立体異性体を含む)およびその塩に関し、

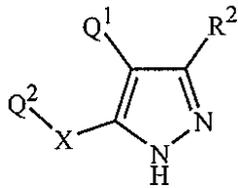
10

20

30

40

【化2】



2

[式中、

XはNHであり；ならびに

Q¹、Q²およびR²は、上記式1に関して定義されているとおりであるが；

ただし：

(a) Q²が、少なくとも1つのオルト位において、- U - V - T (式中、Uは直接結合であり、および、TはNR^{2 3 a}R^{2 3 b}またはOR^{2 4}である) から選択される置換基で置換されたフェニル環である場合、VはC(= O) であり；ならびに

(b) Q¹がフェニルであり、および、Q²が4 - (トリフルオロメチル) フェニルである場合、R²はメチル以外である]

および、式1の化合物を調製するための中間体としての前記化合物の使用に関する。より具体的には、本発明は、式2の化合物またはその塩に関する。

【発明を実施するための形態】

【0012】

本明細書において用いられるところ、用語「含む (comprises)」、「含んでいる (comprising)」、「含む (includes)」、「含んでいる (including)」、「有する (has)」、「有している (having)」、「含有する (contains)」、「含有している (containing)」、「により特徴付けられる」、または、これらのいずれかの他の変形は、明示的に示されている任意の限定を条件として、非排他的な包含をカバーすることが意図されている。例えば、要素の一覧を含む組成物、混合物、プロセスまたは方法は、必ずしもこれらの要素にのみ限定されることはなく、明示的に列挙されていないか、または、このような組成物、混合物、プロセスまたは方法に固有である他の要素が包含されていてもよい。

【0013】

「からなる (consisting of)」という移行句は、特定されていない任意の要素、ステップまたは成分を除外する。特許請求の範囲中にある場合、このような句は、特許請求の範囲を、通常これに関連する不純物類を除き、言及されたもの以外の材料の包含を限定するであろう。「からなる (consisting of)」という句が、プリアンブルの直後ではなく特許請求の範囲の本文の一文節中にある場合、これは、その文節中に規定されている要素のみを限定し；他の要素は、特許請求の範囲からは、全体としては除外されない。

【0014】

「基本的にかからなる (consisting essentially of)」という移行句は、文字通り開示されているものに追加して、材料、ステップ、機構、成分、または、要素を包含する組成物または方法を定義するために用いられているが、ただし、これらの追加の材料、ステップ、機構、成分、または、要素は、特許請求された発明の基本的なおよび新規な特徴に著しく影響しない。「基本的にかからなる (consisting essentially of)」という用語は、「を含んでいる (comprising)」と、「からなる (consisting of)」との間の中間点を構成する。

【0015】

出願人らが、「を含んでいる (comprising)」などのオープンエンド形式の用語で発明またはその一部分を定義している場合、その記載は (他に明記されていない限

10

20

30

40

50

りにおいて)、「基本的にからなる (consisting essentially of)」または「からなる (consisting of)」という用語を用いてこのような発明を記載しているとも解釈されるべきであると、直ちに理解されるべきである。

【0016】

さらに、反対の記載が明白にされない限り、「あるいは、または、もしくは」は包含的論理和を指し、そして排他的論理和を指さない。例えば、条件AまたはBは、以下のいずれか1つによって満たされる：Aが真であり（または存在する）、そしてBが偽である（または存在しない）；Aが偽であり（または存在しない）、そしてBが真である（または存在する）；ならびに、AおよびBの両方が真である（または存在する）。

【0017】

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「an」は、要素または成分の事例（すなわち、存在）の数に関して比制的であることが意図される。従って、「a」または「an」は、1つまたは少なくとも1つ、を含むと読解されるべきであり、要素または成分の単数形の語形は、その数が明らかに単数を意味しない限りにおいては複数をも包含する。

【0018】

本開示および特許請求の範囲において言及されるとおり、「植物」とは、幼植物（例えば、苗木に発生する発芽種子）および成熟した生殖成長期（例えば、花および種子をもたらす植物）を含むすべてのライフステージで、植物界の構成要素、特に種子植物（種子植物目 (Spermatopsida)）を含む。植物の一部は、典型的には成長培地（例えば、土壌）の表面下で成長する、根、塊茎、鱗茎および球茎などの屈地性の構成要素、ならびに、成長培地上で成長する、群葉（茎および葉を含む）、花、果実および種子などの構成要素をも含む。

【0019】

本明細書において言及されるどころ、単独でまたは複合語で用いられる「苗木」という用語は、種子の胚芽から発生する幼植物を意味する。

【0020】

本明細書において用いられるところ、「アルキル化剤」という用語は、炭素含有ラジカルが、ハロゲン化物またはスルホネートなどの脱離基を介して炭素原子に結合している化学化合物を指し、この脱離基は、前記炭素原子への求核剤の結合により置き換えられることが可能である。他に示されていない限りにおいて、「アルキル化」という用語は、炭素含有ラジカルをアルキルに限定せず；アルキル化剤中の炭素含有ラジカルは、 R^1 に関して特定されている多様な炭素結合置換基ラジカルを含む。

【0021】

一般に、分子フラグメント（すなわちラジカル）が一連の原子符号（例えば、C、H、N、O、S）により示されている場合、潜在的な結合点は、当業者によって容易に認識されるであろう。いくつかの事例においては、本明細書において、特に代わりの結合点が可能である場合、結合点は、ハイフン（「-」）によって明確に示され得る。例えば、「-SCN」は、結合点が硫黄原子であること（すなわち、イソチオシアナトではなくチオシアナト）を示す。

【0022】

上記の記載において、単独で、または、「アルキルチオ」または「ハロアルキル」などの複合語で用いられる、「アルキル」という用語は、メチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、または、異なるブチル、ペンチルあるいはヘキシル異性体などの直鎖または分岐アルキルを含む。「アルケニル」は、エテニル、1-プロベニル、2-プロベニル、および、異なるブテニル異性体などの直鎖または分岐アルケンを含む。「アルケニル」はまた、1,2-プロパジエニルなどのポリエンを含む。「アルキニル」は、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニルおよび異なるブチニル異性体などの直鎖または分岐アルキンを含む。「アルケニレン」は、1つのオレフィン結合を含有する直鎖または分岐アルケンジイルを示す。「アルケニレン」の例としては、 $CH=CH$ 、 $CH_2CH=CH$ 、 CH

10

20

30

40

50

= C (C H ₃) が挙げられる。「アルキニレン」は、1つの三重結合を含有する直鎖または分岐アルキンジイルを示す。「アルキニレン」の例としては、C H ₂ C ≡ C、C ≡ C C H ₂、ならびに、異なるブチニレン、ペンチニレンおよびヘキシニレン異性体が挙げられる。

【 0 0 2 3 】

「アルコキシ」としては、例えば、メトキシ、エトキシ、n - プロピルオキシ、イソプロピルオキシおよび異なるブトキシ、ペントキシおよびヘキシルオキシ異性体が挙げられる。「アルコキシアルキル」は、アルキルでのアルコキシ置換を示す。「アルコキシアルキル」の例としては、C H ₃ O C H ₂、C H ₃ O C H ₂ C H ₂、C H ₃ C H ₂ O C H ₂、C H ₃ C H ₂ C H ₂ C H ₂ O C H ₂ および C H ₃ C H ₂ O C H ₂ C H ₂ が挙げられる。「アルキルチオ」は、メチルチオ、エチルチオ、ならびに、異なるプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシルチオ異性体などの分岐または直鎖アルキルチオ部分を含む。「アルキルスルフィニル」は、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーを含む。「アルキルスルフィニル」の例としては、C H ₃ S (O) -、C H ₃ C H ₂ S (O) -、C H ₃ C H ₂ C H ₂ S (O) -、(C H ₃) ₂ C H S (O) - および異なるブチルスルフィニル異性体が挙げられる。「アルキルスルホニル」の例としては、C H ₃ S (O) ₂ -、C H ₃ C H ₂ S (O) ₂ -、C H ₃ C H ₂ C H ₂ S (O) ₂ -、(C H ₃) ₂ C H S (O) ₂ -、および異なるブチルスルホニル異性体が挙げられる。「アルキルチオアルキル」は、アルキルでのアルキルチオ置換を示す。「アルキルチオアルキル」の例としては、C H ₃ S C H ₂、C H ₃ S C H ₂ C H ₂、C H ₃ C H ₂ S C H ₂、C H ₃ C H ₂ C H ₂ S C H ₂ および C H ₃ C H ₂ S C H ₂ C H ₂ が挙げられる。「(アルキルチオ)カルボニル」は、C (= O) 部分に結合した直鎖または分岐アルキルチオ基を示す。「(アルキルチオ)カルボニル」の例としては、C H ₃ S C (= O)、C H ₃ C H ₂ C H ₂ S C (= O) および (C H ₃) ₂ C H S C (= O) が挙げられる。「アルコキシ(チオカルボニル)」は、C (= S) 部分に結合した直鎖または分岐アルコキシ基を示す。「アルコキシ(チオカルボニル)」の例としては、C H ₃ O C (= S)、C H ₃ C H ₂ C H ₂ O C (= S) および (C H ₃) ₂ C H O C (= S) が挙げられる。「アルキルアミノアルキル」は、アミノ(直鎖または分岐)アルキル部分の窒素原子に結合した直鎖または分岐アルキル部分を示す。「アルキルアミノアルキル」の例としては、C H ₃ N H C H ₂ -、(C H ₃) ₂ C H N H C H ₂ - および C H ₃ N H C H (C H ₃) - が挙げられる。「ジアルキルアミノアルキル」は、アミノ(直鎖または分岐)アルキル部分の窒素原子に結合した2つの独立した直鎖または分岐アルキル部分を示す。「ジアルキルアミノアルキル」の例としては、(C H ₃) ₂ N C H ₂ -、(C H ₃) ₂ C H (C H ₃) N C H ₂ - および (C H ₃) ₂ N C H (C H ₃) - が挙げられる。「アルキルカルボニルアミノ」という用語は、C (= O) N H 部分に結合したアルキルを示す。「アルキルカルボニルアミノ」の例としては、C H ₃ C H ₂ C (= O) N H および C H ₃ C H ₂ C H ₂ C (= O) N H が挙げられる。

【 0 0 2 4 】

「シクロアルキル」としては、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が挙げられる。「アルキルシクロアルキル」という用語は、シクロアルキル部分でのアルキル置換を示し、例えば、エチルシクロプロピル、i - プロピルシクロブチル、3 - メチルシクロペンチルおよび4 - メチルシクロヘキシルが挙げられる。「シクロアルキルアルキル」という用語は、アルキル部分でのシクロアルキル置換を示す。「シクロアルキルアルキル」の例としては、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および、直鎖または分岐アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が挙げられる。「シクロアルコキシ」という用語は、シクロペンチルオキシおよびシクロヘキシルオキシなどの酸素原子を介して結合されたシクロアルキルを示す。「シクロアルケニル」は、シクロペンテニルおよびシクロヘキセニルなどの二重結合を1つだけ含む炭素環、ならびに、1, 3 - および1, 4 - シクロヘキサジエニルなどの2つ以上の二重結合を有する炭素環を含むが、芳香族ではない。「シクロアルキルカルボニル」は、例えば、シクロ

10

20

30

40

50

プロピルカルボニルおよびシクロペンチルカルボニルを含むC(=O)基に結合したシクロアルキルを示す。「シクロアルコキシカルボニル」という用語は、例えば、シクロプロピルオキシカルボニルおよびシクロペンチルオキシカルボニルといったC(=O)基に結合したシクロアルコキシを意味する。「シクロアルキレン」という用語はシクロアルカンジイル環を示す。「シクロアルキレン」の例としては、シクロプロピレン、シクロブチレン、シクロペンチレンおよび、シクロヘキシレンが挙げられる。「シクロアルケニレン」という用語は、1つのオレフィン結合を含有するシクロアルケンジイル環を示す。「シクロアルケニレン」の例としては、シクロプロペンジイルおよびシクロペンテンジイルが挙げられる。

【0025】

「ハロゲン」という用語は、単独でもしくは「ハロアルキル」などの複合語で、または、「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で用いられる場合、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で用いられる場合、または、「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載において用いられる場合、前記アルキルは、同一であっても異なってもよいハロゲン原子で部分的にまたは完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されたアルキル」の例としては、 F_3C- 、 $ClCH_2-$ 、 CF_3CH_2- および CF_3CCl_2- が挙げられる。「ハロシクロアルキル」、「ハロアルコキシ」、「ハロアルキルチオ」などという用語は、用語「ハロアルキル」と同様に定義される。「ハロアルコキシ」の例としては、 CH_2FO- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、 CCl_3CH_2O- 、 $HCF_2CH_2CH_2O-$ 、および CF_3CH_2O- が挙げられる。「フルオロアルコキシ」の例としては、 CH_2FO- 、 CHF_2O- 、 $CF_3O-HCF_2CH_2CH_2O-$ および、 CF_3CH_2O- が挙げられる。「フルオロメトキシ」の例としては、 CH_2FO- 、 CHF_2O- 、および、 CF_3O- が挙げられる。「ハロアルキルチオ」の例としては、 CCl_3S- 、 CF_3S- 、 CCl_3CH_2S- 、および、 $ClCH_2CH_2CH_2S-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルフィニル」の例としては、 $CF_3S(O)-$ 、 $CCl_3S(O)-$ 、 $CF_3CH_2S(O)-$ および $CF_3CF_2S(O)-$ が挙げられる。「ハロアルキルスルホニル」の例としては、 $CF_3S(O)_2-$ 、 $CCl_3S(O)_2-$ 、 $CF_3CH_2S(O)_2-$ および $CF_3CF_2S(O)_2-$ が挙げられる。

【0026】

置換基中の炭素原子の総数は接頭辞「 $C_i \sim C_j$ 」によって示され、ここで、 i および j は1~12の数字である。例えば、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルはメチルスルホニル~ブチルスルホニルを示し； C_2 アルコキシアルキルは CH_3OCH_2- を示し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $CH_3CH(OCH_3)-$ 、 $CH_3OCH_2CH_2-$ または $CH_3CH_2OCH_2-$ を示し；ならびに、 C_4 アルコキシアルキルは、合計で4個の炭素原子を含有するアルコキシ基で置換されたアルキル基の種々の異性体を示し、その例としては、 $CH_3CH_2CH_2OCH_2-$ 、および、 $CH_3CH_2OCH_2CH_2-$ が挙げられる。

【0027】

本明細書において用いられるところ、他に示されていない限りにおいては以下の定義が適用される。「任意により置換されている」という用語は、句「置換または非置換の」、または、用語「(未)置換の」と同義的に用いられる。他に示されていない限りにおいて、任意により置換されている基は、その基の置換可能な位置の各々に置換基を有し得、各置換は相互に独立している。

【0028】

「未置換である」という用語は、環または環系などの基に関連して、式1の残りに対する1つまたは複数の結合以外の置換基を全く有さない基を意味する。「任意により置換されている」という用語は、置換基の数がゼロであることが可能であることを意味する。他に示されていない限りにおいて、任意により置換されている基は、利用可能な炭素原子または窒素原子のいずれかにおける水素原子の非水素置換基での置換により、保持可能な限

10

20

30

40

50

り多くの任意の置換基で置換されていてもよい。任意の置換基の数は、表記された限定により制限され得る。例えば、「炭素環員上の r^a から選択される 3 個以下の置換基で任意により置換されている」という句は、0、1、2 または 3 個の置換基が存在していることが可能であることを意味する（潜在的な結合点の数が許容すれば）。同様に、「炭素環員上の R^3 から選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されている」という句は、利用可能な結合点の数が許容すれば、0、1、2、3、4 または 5 個の置換基が存在していることが可能であることを意味する。置換基の数について規定された範囲（例えば、明細表 A 中の 5 員および 6 員窒素含有複素環について、 r は 0 ~ 4 または 0 ~ 3 の整数である）が環において置換基が利用可能な位置の数を超過している場合（例えば、明細表 A 中の U - 27 の $(R^a)_r$ については 2 つの位置が利用可能である）、範囲の実際の上限は利用可能な位置の数であると認識される。

10

【0029】

前記置換基の数が 1 を超えることが可能であることを示す下付文字を有する置換基で化合物が置換される場合、前記置換基は（これらが 1 を超える場合）、例えば、表 1 中の $(R^3)_p$ （式中、 p は 0、1、2、3、4 または 5 である）といった定義された置換基の群から独立して選択される。例えば R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 または R^{13} といった、水素を含むことが可能である置換基を基が含有する場合には、この置換基が水素とされる場合、これは、前記基が未置換であることと等しいと認識される。例えば明細表 1 の H - 23 における $(R^a)_r$ （式中、 r は 0 であり得る）のように、様々な基が、任意により 1 つの位置に結合していると示されている場合、様々な基の定義において言及されていなくても、水素がその位置にあり得る。基の 1 つまたは複数の位置が「非置換である」または「未置換である」といわれる場合、有効原子価のすべてを埋めるために水素原子が結合している。

20

【0030】

発明の概要および特許明細書の対応する部分中の可変要素「m」、「n」、「t」、「u」、「v」、「w」および「y」は、括弧内の原子または他の分子フラグメントの右側に表記される下付文字に関連し、括弧中の原子または他の分子フラグメントが存在する事例の整数を示す。「m」は「 $S(O)_m$ 」に関し、「n」は「 $S(O)_n$ 」に関し、「t」は「 $-S(=O)_t r^{10}$ 」に関し、「u」および「v」は「 $S(=O)_u (=NR^14)_v$ 」に関し、「w」は「 $S(=O)_w$ 」に関し、ならびに、「y」は「 $S(=O)_y r^{25}$ 」に関する。例えば、「m」が 0、1 または 2 であることは、「 $S(O)_m$ 」は、「S」、「 $S(O)$ 」または「 $S(O)_2$ 」であることが可能であることを意味する。

30

【0031】

他に示されていない限りにおいて、式 1 の成分としての「環」は、炭素環または複素環である。「環系」という用語は、式 1 の成分として、2 つの縮合環を示す（例えば、フェニル環がピリジニル環に縮合してキノリニルを形成する）。「環員」という用語は、環または環系の主鎖を形成する原子または他の部分（例えば、O、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ または $S(=O)_u (=NR^14)_v$ ）を指す。

【0032】

「炭素環」という用語は、環主鎖を形成している原子が炭素のみから選択されている環を示す。他に示されていない限りにおいて、炭素環は、飽和、部分飽和、または完全不飽和環であることが可能である。「飽和炭素環式」は、互いに単結合により結合された炭素原子からなる主鎖を有する環を指し；他に規定されていない限りにおいて、残りの炭素原子価は水素原子によって埋められている。

40

【0033】

「複素環 (heterocyclic ring)」または「複素環 (heterocycle)」という用語は、環主鎖を形成している少なくとも 1 個の原子が炭素ではなく、例えば、窒素、酸素または硫黄である環または環系を示す。典型的には、複素環は、4 個以下の窒素、2 個以下の酸素および 2 個以下の硫黄を含有する。他に示されていない限りにおいて、複素環は、飽和、部分飽和、または、完全不飽和環であることが可能である

50

。「飽和複素環」という用語は、環員間に単結合のみを含有する複素環を指す。飽和度に関して、「部分飽和複素環」は、飽和複素環と、完全不飽和複素環との中間体である（芳香族であってもよい）。従って、本開示および特許請求の範囲において参照されているところ、「部分飽和複素環」という用語は、二重結合を介して隣接する環員に結合している少なくとも1つの環を含む複素環を示し、これは、概念的には、潜在的に、存在する二重結合の数を超える（すなわち、その部分飽和形態で）多数の非集積二重結合を隣接する環員の間を含んでいる（すなわち、その完全不飽和相対部の形態で）。完全不飽和複素環がHueckelの法則を満たす場合、前記環は、「芳香族複素環」または「芳香族複素環」とも呼ばれる。「芳香族複素環系」および「芳香族複素環式二環系」という用語は、環主鎖を形成する少なくとも1個の原子が炭素ではなく、例えば、窒素、酸素または硫黄であり、および、少なくとも1個の環が芳香族である環系を示す。他に示されていない限りにおいて、複素環および環系は、任意の利用可能な炭素または窒素を介して、前記炭素または窒素上の水素の置き換えにより結合されていることが可能である。

10

【0034】

「芳香族」は、環原子の各々が基本的に同一の平面にあると共に、環の平面に直角なp-軌道を有することを示し、Hueckelの法則を満たすために、 $(4n+2)$ 個の電子（ここで、 n は正の整数である）が環に付随していることを示す。「芳香族複素環系」という用語は、環系の少なくとも1つの環が芳香族である複素環系を示す。「非芳香族環系」という用語は、完全飽和、ならびに、部分飽和または完全不飽和であり得る炭素環系または複素環系を示すが、ただし、環系中の環のいずれも芳香族ではない。「4員~7員非芳香族複素環」という用語は、4~7個の環員を含有すると共に、Hueckelの法則を満たさない環を指す。この用語（ R^6 および R^7 が一緒にされる場合に用いられるとおり）は炭素原子のみに限定されず、O、 $S(O)_n$ および NR^{13} から選択される環員を含んでいることが可能である。

20

【0035】

本発明の文脈において、 Q^1 、 Q^2 または R^1 がフェニルまたは6員完全不飽和複素環を含む事例の場合、各環のオルト位、メタ位およびパラ位は、環の式1の残りへの結合を基準としている。

【0036】

上記に記載されているとおり、 Q^1 、 Q^2 および R^1 は、（とりわけ）発明の概要に定義されている置換基の群から選択される1つまたは複数の置換基で任意により置換されているフェニルであることが可能である。1~5個の置換基で任意により置換されているフェニルの例は明細表AにおいてU-57として図示されている環であり、式中、 R^8 は、 R^8 について発明の概要に定義されているとおりであり、および、 q は0~5の整数である。

30

【0037】

上記に記載されているとおり、 Q^1 は、とりわけ、5員~6員完全不飽和複素環または8員~10員芳香族複素環式二環系であって、各環または環系は、炭素原子、ならびに、2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される4個以下のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素原子環員は $C(=O)$ および $C(=S)$ から独立して選択され、硫黄原子環員は $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ から独立して選択され、各環または環系は、任意により、 Q^1 について発明の概要において定義されている任意の置換基から独立して選択される5個以下の置換基で置換されている（例えば、 Q^1 環または環系は、炭素環員上の R^3 、ならびに、窒素原子環員上のシアノ、 $C_1~C_6$ アルキル、 $C_2~C_6$ アルケニル、 $C_2~C_6$ アルキニル、 $C_3~C_6$ シクロアルキル、 $C_1~C_6$ アルコキシ、 $C_2~C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2~C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2~C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2~C_6$ アルキルアミノアルキルおよび $C_3~C_6$ ジアルキルアミノアルキルで任意により置換されている）。同様に、 Q^2 は、とりわけ、5員~6員飽和、部分飽和あるいは完全不飽和複素環、または、8員~10員芳香族複素環式二環系であって、各環または環系は、炭素原子、ならびに

40

50

、2個以下のO原子、2個以下のS原子および4個以下のN原子から独立して選択される4個以下のヘテロ原子から選択される環員を含有し、ここで、3個以下の炭素原子環員はC(=O)およびC(=S)から独立して選択され、硫黄原子環員はS(=O)_u(=NR^{1 4})_vから独立して選択され、各環または環系は、任意により、Q²について発明の概要において定義されている任意の置換基から独立して選択される5個以下の置換基で置換されている。Q¹またはQ²の環または環系上の置換基は任意であるため、0~5個の置換基が存在し得、利用可能な結合点の数によってのみ限定される。複素環および芳香族複素環系のこれらの定義において、2個以下のO、2個以下のSおよび4個以下のN原子から選択される環員は任意であるが、たゞし、少なくとも1個の環員は炭素ではない(例えば、N、OまたはS)。S(=O)_u(=NR^{1 4})_vの定義は、2個以下の硫黄環員が、酸化硫黄部分(例えば、S(=O)またはS(=O)₂)、または、未酸化の硫黄原子(すなわち、uおよびvの両方がゼロである場合)であることを許容する。式1に関連する化合物はN-オキッド誘導体をも含むため、窒素原子環員はN-オキッドとして酸化されていてもよい。C(=O)およびC(=S)から選択される3個以下の炭素原子環員は、2個以下のO、2個以下のSおよび4個以下のN原子から選択される4個以下のヘテロ原子に対する追加である。

10

【0038】

上記にも記載されているとおり、R¹は、(とりわけ)5員または6員窒素含有芳香族複素環であることが可能であり、これは、発明の概要に定義されている置換基の群から選択される1つまたは複数の置換基で任意により置換されていてもよい。

20

【0039】

R¹がフェニルまたは5員または6員窒素含有芳香族複素環である場合、これは、他に記載がない限り、任意の利用可能な炭素または窒素環原子を介して式1の残りに結合していてもよい。同様に、Q¹またはQ²の環または環系は、他に記載がない限り、任意の利用可能な炭素または窒素環原子を介して式1の残りに結合していてもよい。

【0040】

5員~6員完全不飽和複素環の例としては、明細表1に例示されている環H-1~H-39が挙げられ、および、8員~10員芳香族複素環式二環系の例としては、明細表2に例示されている環系B-1~B-39が挙げられる。明細表1および2において、可変項R^aは、Q¹、Q²またはR¹について発明の概要に定義されている任意の置換基であり(例えば、Q¹環または環系は、炭素環員上のR³、ならびに、窒素原子環員上のシアノ、C₁~C₆アルキル、C₂~C₆アルケニル、C₂~C₆アルキニル、C₃~C₆シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、C₂~C₆アルコキシアルキル、C₂~C₆アルキルカルボニル、C₂~C₆アルコキシカルボニル、C₂~C₆アルキルアミノアルキルおよびC₃~C₆ジアルキルアミノアルキルで任意により置換されている)、ならびに、rは、Q¹およびQ²については0~5の整数、または、R¹については0~3の整数であり、示された環または環系の各々において利用可能な位置の数によって限定される。

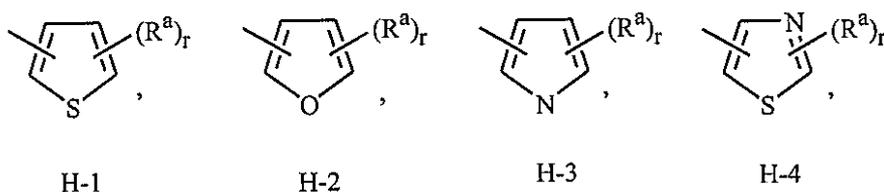
30

【0041】

【化3】

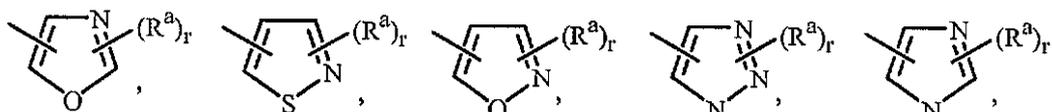
提示1

40



【0042】

【化4】



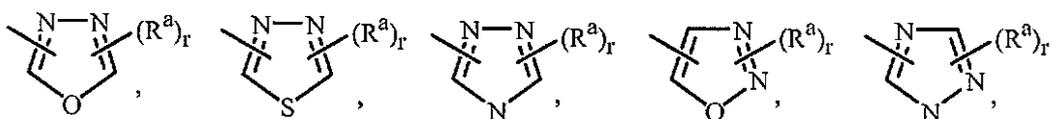
H-5

H-6

H-7

H-8

H-9



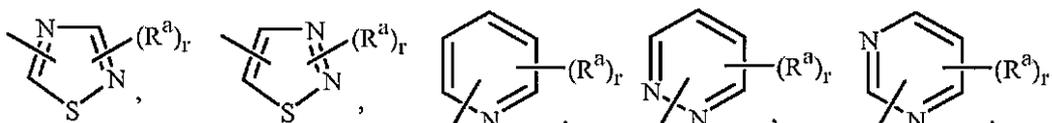
H-10

H-11

H-12

H-13

H-14



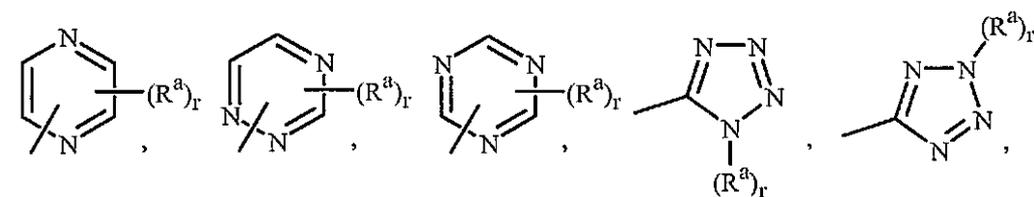
H-15

H-16

H-17

H-18

H-19



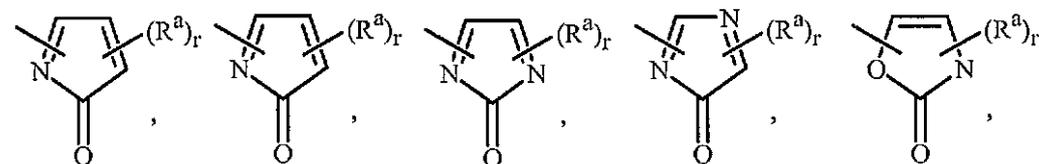
H-20

H-21

H-22

H-23

H-24



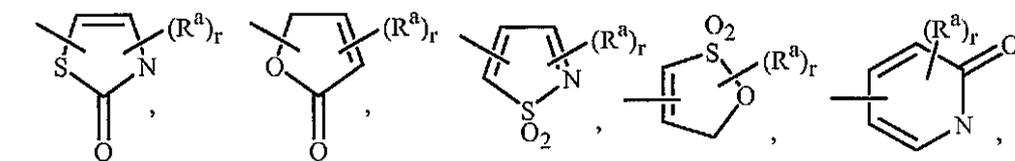
H-25

H-26

H-27

H-28

H-29



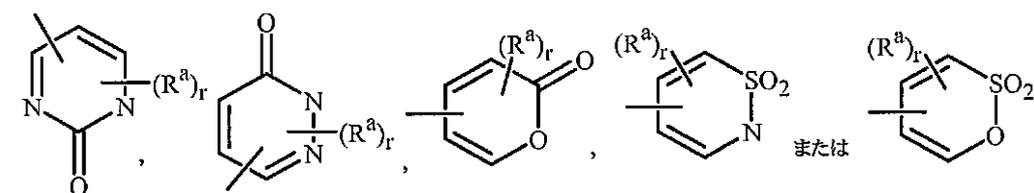
H-30

H-31

H-32

H-33

H-34



H-35

H-36

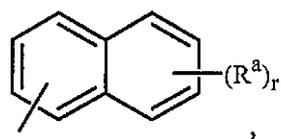
H-37

H-38

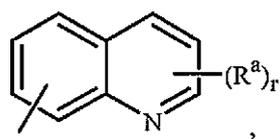
H-39

【化5】

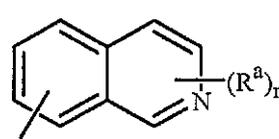
提示 2



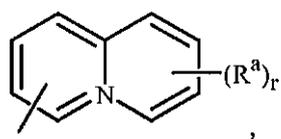
B-1



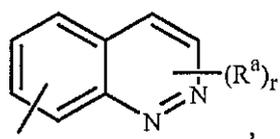
B-2



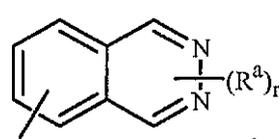
B-3



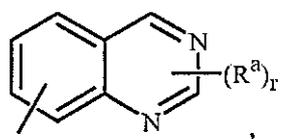
B-4



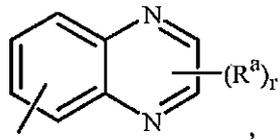
B-5



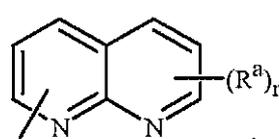
B-6



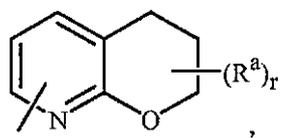
B-7



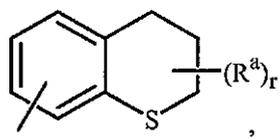
B-8



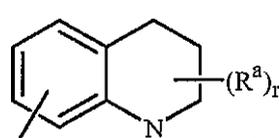
B-9



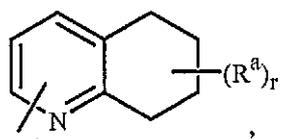
B-10



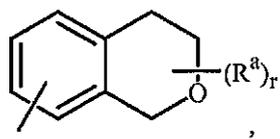
B-11



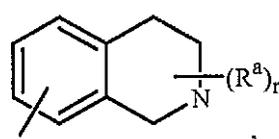
B-12



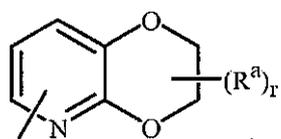
B-13



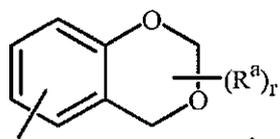
B-14



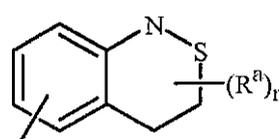
B-15



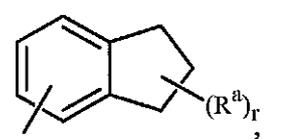
B-16



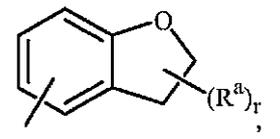
B-17



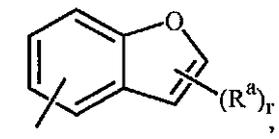
B-18



B-19



B-20



B-21

【 0 0 4 4 】

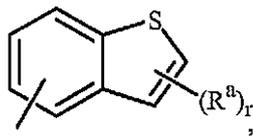
10

20

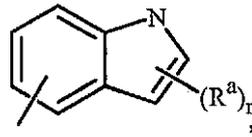
30

40

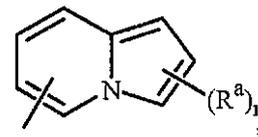
【化6】



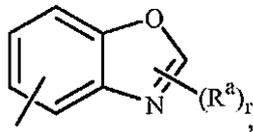
B-22



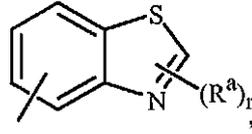
B-23



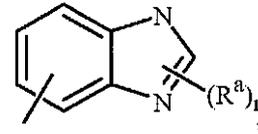
B-24



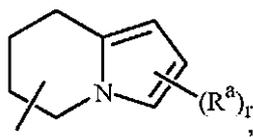
B-25



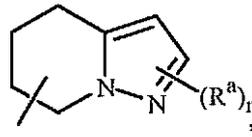
B-26



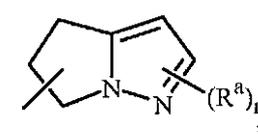
B-27



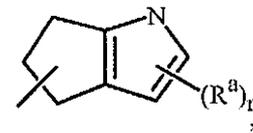
B-28



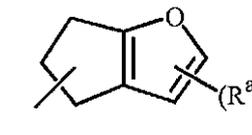
B-29



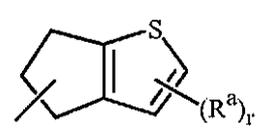
B-30



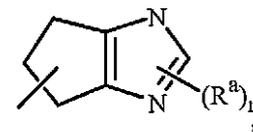
B-31



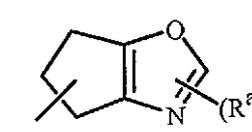
B-32



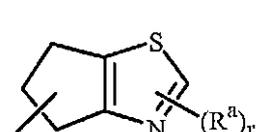
B-33



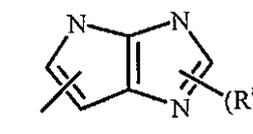
B-34



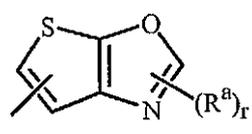
B-35



B-36

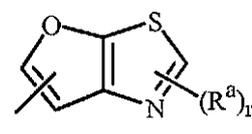


B-37



B-38

または



B-39

【0045】

飽和または部分飽和5員～6員複素環の例としては、明細表3に例示されている環P-1～P-40が挙げられる。明細表3において可変項 R^a は、 Q^2 について発明の概要に定義されている任意の置換基であり（例えば、 Q^2 環は、炭素環員上の R^3 、ならびに、窒素原子環員上のシアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルアミノアルキルおよび $C_3 \sim C_6$ ジアルキルアミノアルキルで任意により置換され

10

20

30

40

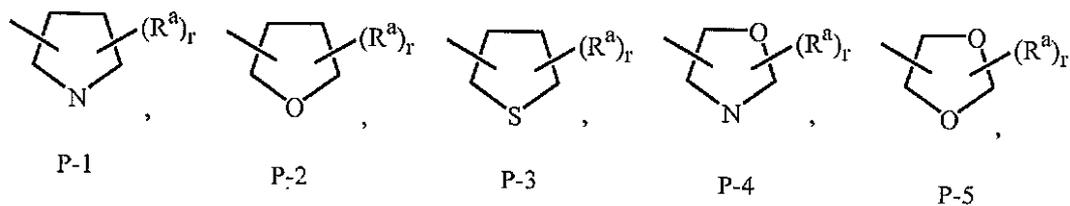
50

ている)、ならびに、 r は0~5の整数であり、示されている環または環系の各々における利用可能な位置の数によって限定される。

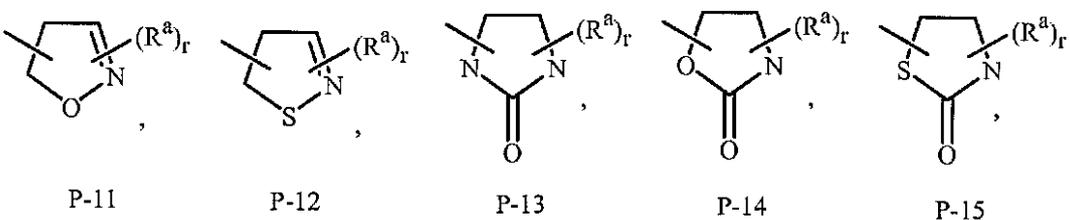
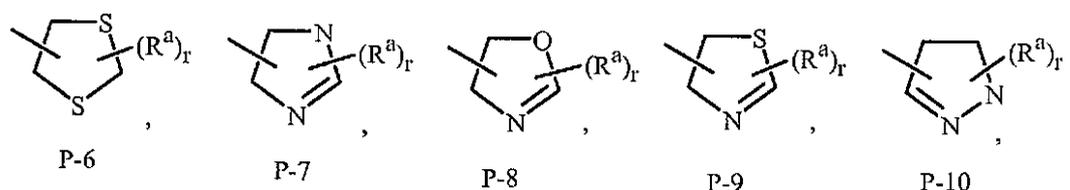
【0046】

【化7】

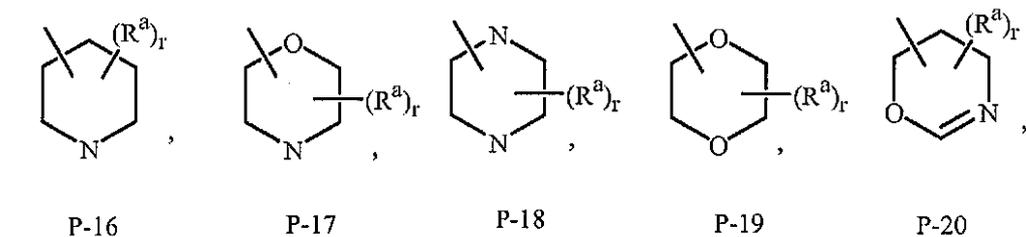
提示3



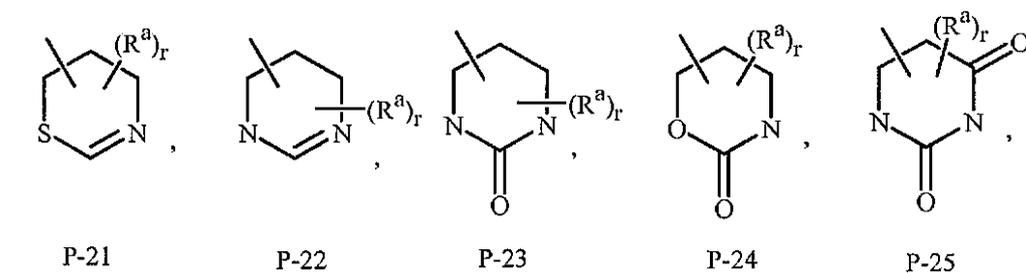
10



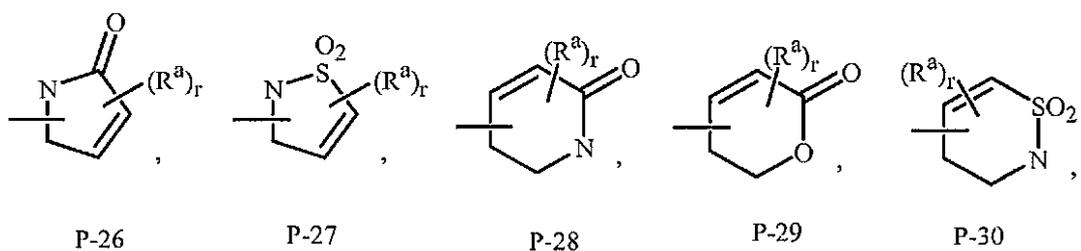
20



30

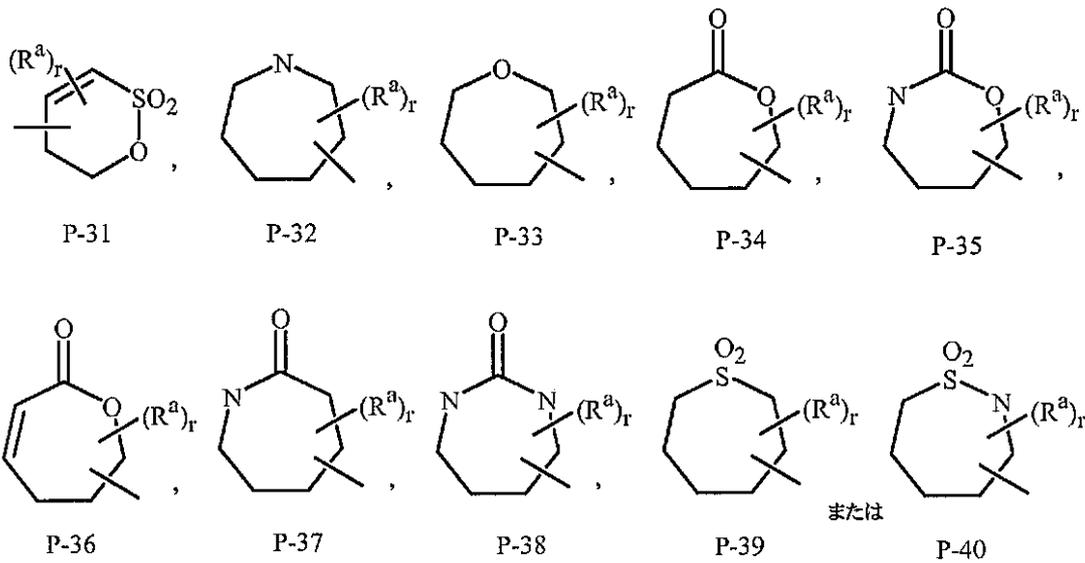


40



【0047】

【化8】



10

【0048】

Q¹、Q² および R¹ について特に注目すべき1つまたは複数の置換基で任意により置換されている5員または6員窒素含有複素環の例としては、明細表Aに例示されている環 U-1 ~ U-56 が挙げられ、ここで、R^a は、それぞれ、Q¹、Q² および R¹ について発明の概要に定義されている任意の置換基であり（すなわち、Q¹ および Q² について：炭素原子環員上の R³、および、言及されている窒素原子環員上の可能な置換基の列挙；ならびに、R¹ については、炭素環員上の r^{9a}、および、窒素環員上の r^{9b}）、ならびに、r は、Q¹ および Q² については0 ~ 4の範囲の整数、および、R¹ については0 ~ 3の範囲の整数であり、各U基における利用可能な位置の数によって限定される。いくつかのU基は、4個未満の R^a 基でしか置換可能ではないことに注意すべきである（例えば、U-4 ~ U-43 および U-47 ~ U-56）。U-24、U-25、U-31、U-32、U-33、U-34、U-35、U-36、U-37 および U-38 は利用可能な位置が1つしかないため、これらのU基については、r は整数0または1に限定され、および、r が0であることは、U基が未置換であって、(R^a)_r によって示される位置に水素が存在していることを意味する。

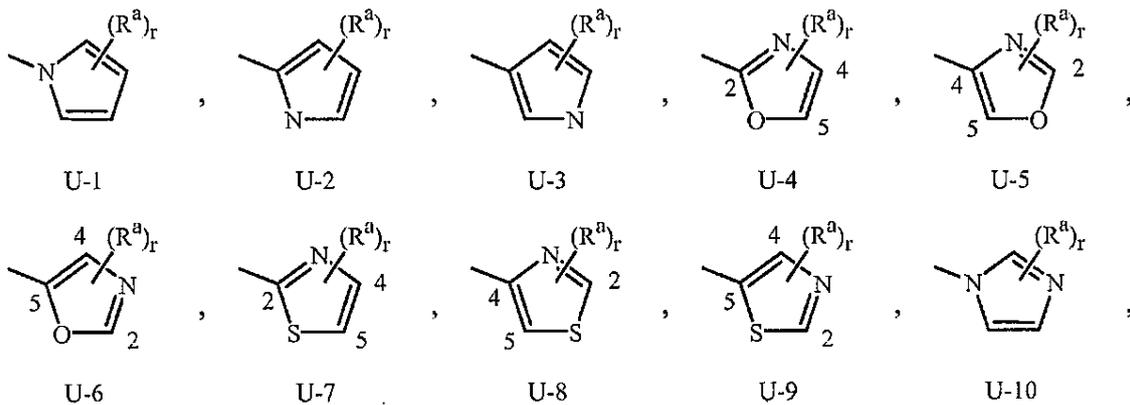
20

30

【0049】

【化9】

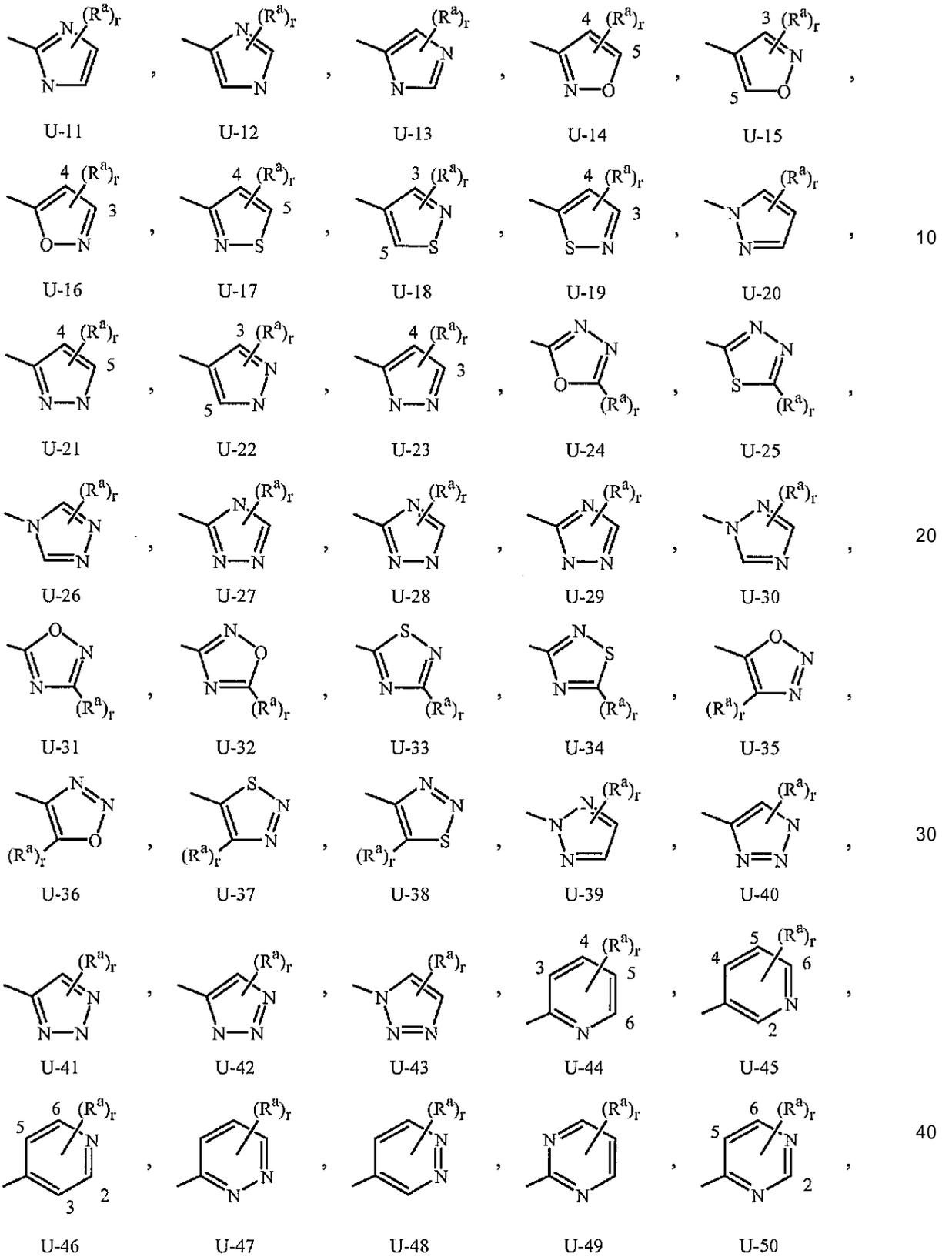
提示A



40

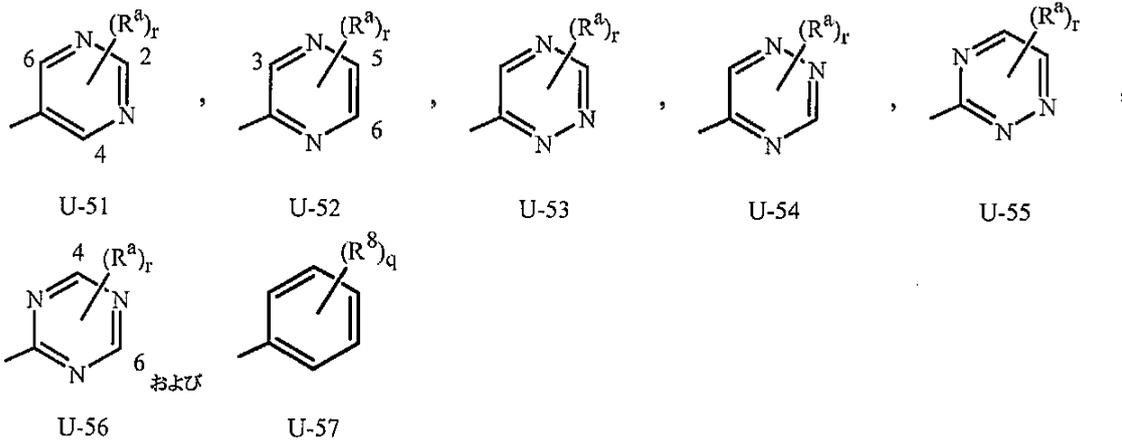
【0050】

【化10】



【0051】

【化 1 1】



10

【 0 0 5 2 】

R^a 基は、明細表 1 ~ 3 および明細表 A 中の構造 H - 1 ~ H - 39、B - 1 ~ B - 39、P - 1 ~ P - 40 および U - 1 ~ U - 57 に示されているが、これらは任意の置換基であるため、存在していることは必須ではないことに注目されたい。原子価を埋めるために置換を必要とする窒素原子は、H または R^a で置換されている。 $(R^a)_r$ と、明細表 1 ~ 3 および明細表 A 中の H、B、P または U 基との間の結合点が浮いて示されている場合、 $(R^a)_r$ は、H、B、P または U 基の任意の利用可能な炭素原子または窒素原子に結合していることが可能であることに注意すべきである。明細表 1 ~ 3 中の H、B または P 基上の結合点が浮いて示されている場合、H、B または P 基は、H、B または P 基の任意の利用可能な炭素または窒素を介して、水素原子を置き換えることにより式 1 の残りに結合していることが可能であることに注意すべきである。注目すべきは、明細表 1 ~ 3 および明細表 A に示されている、「 R^a 」可変項置換基は「 R^v 」により置き換えられている化学構造の代替的な図示であり、ここで、「 R^v 」中の上付文字「v」は発明の概要中に定義されている下付文字可変項「v」に関連していないが、代わりに「 R^v 」を、「R」から始まる他の置換基可変要素とは異ならせている。

20

【 0 0 5 3 】

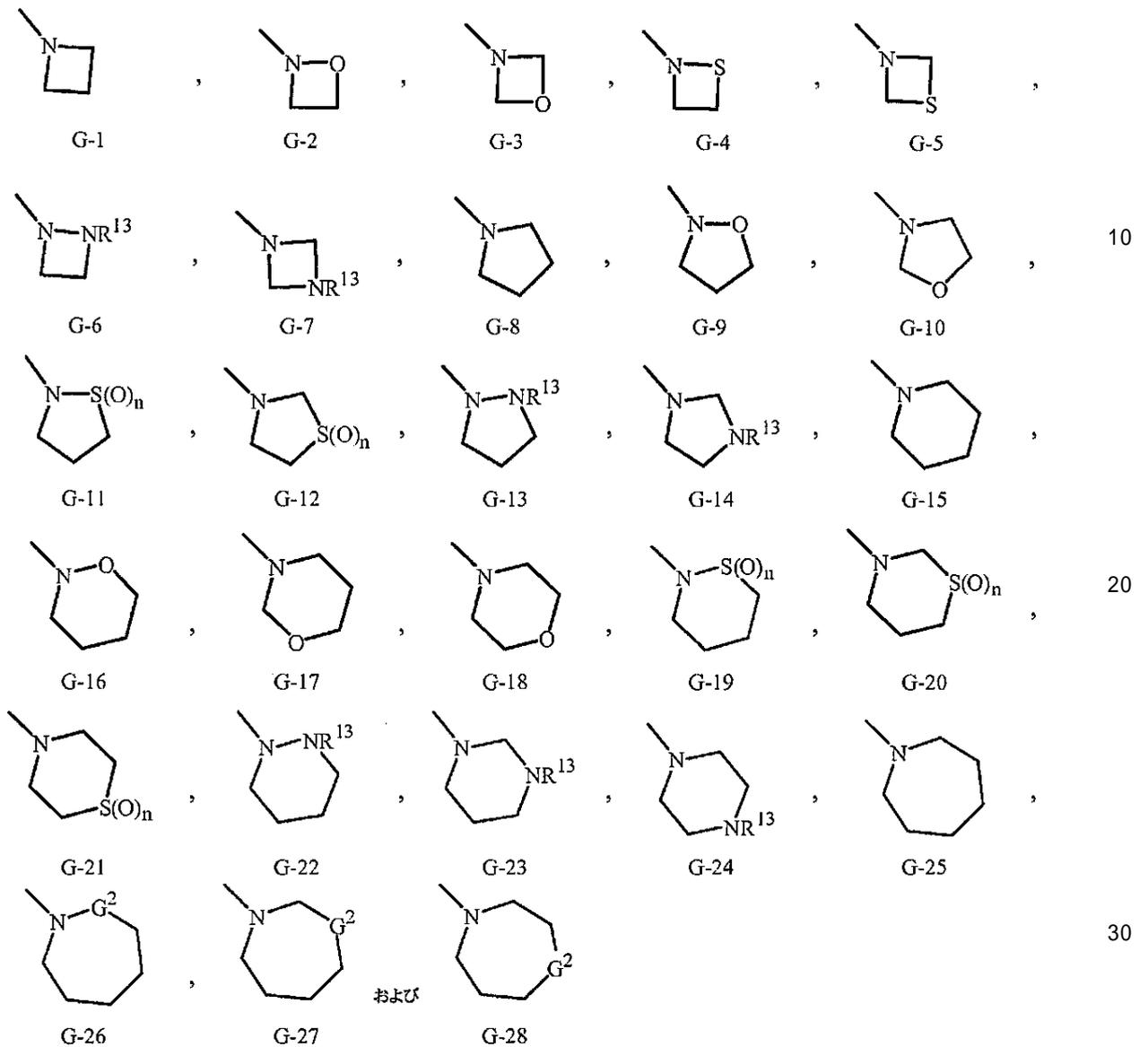
R^6 および R^7 が一緒になって 4 員 ~ 7 員非芳香族複素環を形成している例としては、明細表 4 に例示されている環 G - 1 ~ G - 28 が挙げられる。 R^6 および R^7 が一緒になって G - 25 ~ G - 28 のから選択される環を含む環を形成している場合、 G^2 は、O、S(O)_n または NR^{1 3} から選択されることに注意すべきである。 G^2 が N である場合、窒素原子は、H、または、発明の概要に定義されている $R^{1 3}$ に相当する置換基による置換でその原子価が満たされていることが可能であることに注意すべきである。

30

【 0 0 5 4 】

【化 1 2】

提示 4



【0055】

芳香族および非芳香族複素環および環系の調製を可能にするために広く多様な合成方法が技術分野において公知であり；広範な概説については、全8巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky および C. W. Rees 編集長, Pergamon Press, Oxford, 1984年、および、全12巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees, および、E. F. V. Scriven 編集長, Pergamon Press, Oxford, 1996年を参照のこと。

【0056】

本発明の化合物は、1種以上の立体異性体として存在していることが可能である。種々の立体異性体としては、エナンチオマー、ジアステレオマー、アストロブ異性体および幾何異性体が挙げられる。当業者は、1種の立体異性体が、他の立体異性体と相対的に富化された場合、または、他の立体異性体から分離された場合に、より効果的であり得るか、および/または、有益な効果を示し得ることを認めるであろう。さらに、当業者は、前記立体異性体をどのように分離し、富化させ、および/または、選択的に調製するかを知っ

ている。本発明の化合物は、立体異性体の混合物、個別の立体異性体、または、光学的に活性な形態として存在し得る。

【0057】

当業者は、窒素は酸化物への酸化のために利用可能な孤立電子対を必要とするため、すべての窒素含有複素環がN-オキシドを形成することができるわけではないことを認めるであろう；当業者は、N-オキシドを形成することが可能である窒素含有複素環を認識するであろう。当業者はまた、第三級アミンがN-オキシドを形成することが可能であることを認識するであろう。複素環および第三級アミンのN-オキシドの調製のための合成方法は当業者にとってかなり周知であり、過酢酸およびm-クロロ過安息香酸(MCPBA)などのペルオキシ酸、過酸化水素、t-ブチルヒドロ過酸化物などのアルキルヒドロ過酸化物、過ホウ酸ナトリウム、ならびに、ジメチルジオキシランなどのジオキシランでの複素環および第三級アミンの酸化が挙げられる。N-オキシドの調製のためのこれらの方法は広範に記載されてきており、および、文献に概説されており、例えば：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, 第7巻, 第748~750ページ, S. V. Ley編, Pergamon Press; M. TislerおよびB. Stanovnik, *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, 第3巻, 第18~20ページ, A. J. BoultonおよびA. Mckillop編, Pergamon Press; M. R. GrimmettおよびB. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第43巻, 第149~161ページ, A. R. Katritzky編, Academic Press; M. TislerおよびB. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第9巻, 第285~291ページ, A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編, Academic Press; ならびに、G. W. H. CheesemanおよびE. S. G. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第22巻, 第390~392ページ, A. R. KatritzkyおよびA. J. Boulton編, Academic Pressを参照のこと。

10

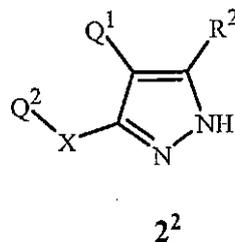
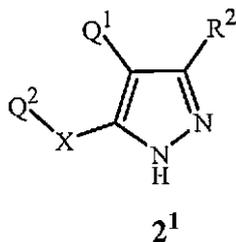
20

【0058】

当業者は、本明細書に開示されている化合物のいくつかは、それぞれの互変異性カウターパートの1種以上と平衡で存在していることが可能であることを認識する。他に示されていない限りにおいて、1種の互変異性体の記載による化合物への参照は、すべての互変異性体を含むものとみなされる。例えば、式2¹によって示される互変異性形態に対する参照はまた、式2²により示される互変異性形態をも含む。

30

【化13】



40

【0059】

当業者は、環境中および生理学的条件下において、化学化合物の塩はそれらの対応する非塩形態と平衡にあるため、塩は、非塩形態の生物学的実用性を共有することを認識する。それ故、式1の化合物の広く多様な塩が、真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害の防除に有用である(すなわち、農学的に好適である)。式1の化合物の塩としては、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオン酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸また

50

は吉草酸などの無機もしくは有機酸との酸付加塩が挙げられる。

【0060】

式1から選択される化合物、その幾何異性体および立体異性体、互変異性体、N-オキシド、および、塩は、典型的には2つ以上の形態で存在し、および、式1は、それ故、式1が表す化合物のすべての結晶性および非結晶形態を含む。非結晶形態は、ワックスおよびガムなどの固形分である実施形態、ならびに、溶液および熔融物などの液体である実施形態を含む。結晶形態は、基本的に単結晶タイプを表す実施形態、および、異形体の混合物を表す実施形態（すなわち、異なる結晶性タイプ）を含む。「異形体」という用語は、異なる結晶形態で結晶化することが可能である化学化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子中に分子の異なる配置および/または配座を有する。異形体は同一の化学的組成を有していることが可能であるが、これらはまた、格子中に弱くまたは強固に結合していることが可能である共結晶化水または他の分子の存在または不在により組成が異なっていることが可能である。異形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸垂性、溶解速度および生物学的利用可能性と同様にこのような化学的、物理的および生物学的特性が異なっていることが可能である。当業者は、式1によって表される化合物の異形体は、式1によって表される同一の化合物の他の異形体または異形体の混合物と比して、有益な効果（例えば、有用な配合物の調製に対する適合性、向上した生物学的性能）を示す可能性があることを認めるであろう。式1によって表される化合物の特定の異形体の調製および単離は、例えば、選択された溶剤および温度を用いる結晶化を含む当業者に公知の方法により達成されることが可能である。

10

20

【0061】

発明の概要に記載の本発明の実施形態は以下を含む（ここで、以下の実施形態において用いられる式1は、そのN-オキシドおよび塩、幾何異性体、立体異性体およびアストロプ異性体を含む）：

実施形態1．式1の化合物であって、式中、Xは、O、 $S(O)_m$ 、 NR^4 、 $CR^{15}R^{16}$ または $C(=O)$ である。

【0062】

実施形態2．式1の化合物であって、式中、Xは、O、 $S(O)_m$ 、 NR^4 または $CR^{15}R^{16}$ である。

【0063】

実施形態3．式1の化合物であって、式中、Xは、O、 NR^4 、 $CR^{15}R^{16}$ または $C(=O)$ である。

30

【0064】

実施形態4．式1の化合物であって、式中、Xは、O、 NR^4 または $CR^{15}R^{16}$ である。

【0065】

実施形態5．式1の化合物であって、式中、Xは、O、 $S(O)_m$ または NR^4 である。

【0066】

実施形態6．式1の化合物であって、式中、Xは、Oまたは $S(O)_m$ である。

40

【0067】

実施形態7．式1の化合物であって、式中、Xは、Oである。

【0068】

実施形態8．式1の化合物であって、式中、Xは、 NR^4 である。

【0069】

実施形態9．式1の化合物であって、式中、Xは、Oまたは NR^4 である。

【0070】

実施形態10．式1の化合物であって、式中、Xは、 $CR^{15}R^{16}$ 、 $C(=O)$ または $C(=S)$ である。

【0071】

50

実施形態 11 . 式 1 または実施形態 1 ~ 10 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 Q^1 が 6 員環（例えば、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニル）であり、および、 R^3 置換基がメタ位（式 1 の残りに対する Q^1 環の結合に対して）に位置されている場合、前記 R^3 置換基は F、Cl、Br およびシアノ（-CN）から選択される。

【0072】

実施形態 11 a . 式 1 または実施形態 1 ~ 11 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 Q^1 が 6 員環であり、および、 R^3 置換基がメタ位（式 1 の残りに対する Q^1 環の結合に対して）に位置されている場合、前記 R^3 置換基は F である。

【0073】

実施形態 12 . 式 1 または実施形態 1 ~ 11 a のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 Q^1 が、1 つの R^3 置換基でのみ置換されている 6 員環（例えば、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニル）である場合、前記 R^3 置換基は、オルト位（式 1 の残りに対する Q^1 環の結合に対して）で結合している。

【0074】

実施形態 13 . 式 1 または実施形態 1 ~ 12 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 Q^1 は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ナフタレニル、キノリニル、イソキノリニルまたはキノキサリニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されている。

【0075】

実施形態 14 . 実施形態 13 の化合物であって、式中、 Q^1 は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニルまたはピリミジニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されている。

【0076】

実施形態 15 . 実施形態 14 の化合物であって、式中、 Q^1 は、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されている。

【0077】

実施形態 16 . 実施形態 15 の化合物であって、式中、 Q^1 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルである。

【0078】

実施形態 17 . 実施形態 16 の化合物であって、式中、置換基は、 Q^1 のフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルのオルトおよび/またはパラ位（式 1 の残りに対する Q^1 環の結合に対して）に位置されている。

【0079】

実施形態 18 . 実施形態 16 または 17 の化合物であって、式中、 Q^1 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されているフェニルまたはピリジニルである。

【0080】

実施形態 19 . 実施形態 18 の化合物であって、式中、 Q^1 は、各々が R^3 から独立して選択される 2 個または 3 個の置換基で置換されているフェニルまたはピリジニルである。

【0081】

実施形態 20 . 実施形態 19 の化合物であって、式中、 Q^1 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または 2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または 2 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0082】

実施形態 21 . 実施形態 20 の化合物であって、式中、 Q^1 は、2 位、4 位および 6 位

10

20

30

40

50

で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル；または2位および4位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0083】

実施形態22．実施形態21の化合物であって、式中、 Q^1 は、2位、4位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0084】

実施形態23．実施形態21の化合物であって、式中、 Q^1 は、2位および4位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0085】

実施形態24．実施形態21の化合物であって、式中、 Q^1 は、2位および6位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。 10

【0086】

実施形態25．実施形態18の化合物であって、式中、 Q^1 は、 R^3 から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されているピリジニルである。

【0087】

実施形態26．実施形態25の化合物であって、式中、 Q^1 は、 R^3 から独立して選択される1個または2個の置換基で置換されているピリジニルである。

【0088】

実施形態27．実施形態26の化合物であって、式中、 Q^1 は、 R^3 から独立して選択される1個の置換基で置換されているピリジニルである。 20

【0089】

実施形態28．式1または実施形態1～27のいずれか1つの化合物であって、式中、 Q^2 が6員環（例えば、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニル）であり、および、 R^3 置換基がメタ位（式1の残りに対する Q^2 環の結合に対して）に位置されている場合、前記 R^3 置換基は、F、Cl、Brおよびシアノ（-CN）から選択される。

【0090】

実施形態29．式1または実施形態1～28のいずれか1つの化合物であって、式中、 Q^2 が6員環であり、および、 R^3 置換基がメタ位（式1の残りに対する Q^2 環の結合に対して）に位置されている場合、前記 R^3 置換基はFである。 30

【0091】

実施形態30．式1または実施形態1～29のいずれか1つの化合物であって、式中、 Q^2 が、1つの R^3 置換基でのみ置換されている6員環（例えば、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニル）である場合、前記 R^3 置換基はオルト位（式1の残りに対する Q^2 環の結合に対して）に結合している。

【0092】

実施形態31．式1または実施形態1～30のいずれか1つの化合物であって、式中、 Q^2 は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ナフタレニル、キノリニル、イソキノリニルまたはキノキサリニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される5個以下の置換基で任意により置換されている。 40

【0093】

実施形態32．実施形態31の化合物であって、式中、 Q^2 は、フェニル、チエニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニルまたはピリミジニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される5個以下の置換基で任意により置換されている。

【0094】

実施形態33．実施形態32の化合物であって、式中、 Q^2 は、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される1～4個の置換基で置換されている。

【0095】

実施形態34．実施形態31～33のいずれか1つの化合物であって、式中、 Q^2 は、 50

各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルである。

【0096】

実施形態 35 . 実施形態 34 の化合物であって、式中、置換基は、 Q^2 のフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルのオルト位および/またはパラ位 (式 1 の残りに対する Q^2 環の結合に対して) に位置している。

【0097】

実施形態 36 . 実施形態 34 または 35 の化合物であって、式中、 Q^2 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されているフェニルまたはピリジニルである。

【0098】

実施形態 37 . 実施形態 36 の化合物であって、式中、 Q^2 は、 R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されているフェニルである。

【0099】

実施形態 38 . 実施形態 37 の化合物であって、式中、 Q^2 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル ; または 2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニル ; または 2 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0100】

実施形態 39 . 実施形態 38 の化合物であって、式中、 Q^2 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0101】

実施形態 40 . 実施形態 38 の化合物であって、式中、 Q^2 は、2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0102】

実施形態 41 . 実施形態 38 の化合物であって、式中、 Q^2 は、2 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルである。

【0103】

実施形態 42 . 実施形態 36 の化合物であって、式中、 Q^2 は、 R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されているピリジニルである。

【0104】

実施形態 43 . 実施形態 42 の化合物であって、式中、 Q^2 は、 R^3 から独立して選択される 1 個または 2 個の置換基で置換されているピリジニルである。

【0105】

実施形態 44 . 実施形態 43 の化合物であって、式中、 Q^2 は、 R^3 から選択される 1 個の置換基で置換されているピリジニルである。

【0106】

実施形態 45 . 式 1 または実施形態 1 ~ 44 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 Q^1 および Q^2 の少なくとも一方は、 R^3 で任意により置換されている (例えば、 R^3 から独立して選択される 5 個以下の置換基で任意により置換されている) フェニルである。

【0107】

実施形態 46 . 実施形態 45 の化合物であって、式中、 Q^1 および Q^2 の少なくとも一方は、 R^3 から独立して選択される 2、3 または 4 個の置換基で置換されているフェニルである。

【0108】

実施形態 47 . 実施形態 46 の化合物であって、式中、 Q^1 および Q^2 の少なくとも一方は、 R^3 から独立して選択される 2 個または 3 個の置換基で置換されているフェニルである。

【0109】

実施形態 48 . 実施形態 47 の化合物であって、式中、 Q^1 および Q^2 の各々は、 R^3

10

20

30

40

50

から独立して選択される2個または3個の置換基で置換されているフェニルである。

【0110】

実施形態49．式1または実施形態1～48のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 CO_2R^5 、 $C(O)NR^6R^7$ 、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシあるいは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルであり；または、 R^1 は、炭素原子環員上の r^{9a} および窒素原子環員上の r^{9b} から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている5員あるいは6員窒素含有芳香族複素環である。

【0111】

実施形態50．実施形態49の化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシあるいは $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；または、 R^1 は、ピリジニル、ピリミジニル、ピラゾリルあるいはオキサゾリルであり、各々は、炭素原子環員上の r^{9a} および窒素原子環員上の r^{9b} から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている。

10

【0112】

実施形態51．実施形態50の化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 CO_2R^5 、 $C(O)NR^6R^7$ 、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルである。

【0113】

実施形態52．実施形態51の化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C(O)NR^6R^7$ 、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルである。

20

【0114】

実施形態53．実施形態52の化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルである。

【0115】

実施形態54．実施形態53の化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

30

【0116】

実施形態55．実施形態54の化合物であって、式中、 R^1 は、Hまたは CH_3 である。

【0117】

実施形態56．実施形態55の化合物であって、式中、 R^1 はHである。

【0118】

実施形態57．式1または実施形態1～56のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^1 は、任意により置換されているフェニルまたは任意により置換されている5員もしくは6員窒素含有芳香族複素環以外である。

【0119】

実施形態58．式1または実施形態1～50のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ アルキニル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 CO_2R^5 、 $C(O)NR^6R^7$ 、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキル以外である。

40

【0120】

実施形態59．式1または実施形態1～58のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{1a} はHである。

【0121】

実施形態60．式1または実施形態1～59のいずれか1つの化合物であって、式中、

50

R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、ハロゲン、シアノ、シアノメチル、モノハロメチル、ヒドロキシメチル、メトキシあるいはメチルチオであり；または、ハロゲンおよびメチルから独立して選択される2個以下の置換基で任意により置換されているシクロプロピルである。

【0122】

実施形態61．実施形態60の化合物であって、式中、 R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、Cl、BrまたはIである。

【0123】

実施形態62．実施形態61の化合物であって、式中、 R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、ClまたはBrである。

10

【0124】

実施形態63．実施形態62の化合物であって、式中、 R^2 は、 CH_3 、ClまたはBrである。

【0125】

実施形態64．実施形態63の化合物であって、式中、 R^2 は、 CH_3 またはClである。

【0126】

実施形態65．実施形態64の化合物であって、式中、 R^2 は、 CH_3 である。

【0127】

実施形態66．実施形態62の化合物であって、式中、 R^2 は、ClまたはBrである。

20

【0128】

実施形態67．実施形態66の化合物であって、式中、 R^2 は、Clである。

【0129】

実施形態68．式1または実施形態1～67のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^5 は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0130】

実施形態69．実施形態68の化合物であって、式中、 R^5 は、H、 CH_3 または CH_2CH_3 である。

【0131】

実施形態70．実施形態68の化合物であって、式中、 R^5 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

30

【0132】

実施形態71．実施形態69または70の化合物であって、式中、 R^5 は、 CH_3 または CH_2CH_3 である。

【0133】

実施形態72．式1または実施形態1～71のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^6 が別個（すなわち、 R^7 と一緒になって環を形成していない）である場合、 R^6 はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0134】

実施形態73．実施形態72の化合物であって、式中、 R^6 はHである。

40

【0135】

実施形態74．式1または実施形態1～73のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^7 が別個（すなわち、 R^6 と一緒になって環を形成していない）である場合、 R^7 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_4 \sim C_8$ アルキルシクロアルキルである。

【0136】

実施形態75．実施形態74の化合物であって、式中、 R^7 はHまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0137】

50

実施形態 76 . 実施形態 75 の化合物であって、式中、 R^7 は H である。

【0138】

実施形態 77 . 式 1 または実施形態 1 ~ 76 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、 R^6 および R^7 が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって非芳香族複素環を形成している場合、環は、結合している窒素原子に追加して、炭素原子から選択される環員、ならびに、O および NR^{1-3} から選択される 1 個以下の環員を含有する。

【0139】

実施形態 78 . 実施形態 77 の化合物であって、式中、 R^6 および R^7 が、これらが結合している窒素原子と一緒にあって非芳香族複素環を形成している場合、環は 6 員であると共に、結合している窒素原子に追加して、O および NR^{1-3} から選択される 1 個の環員、ならびに、炭素原子から選択される環員を含有する。

10

【0140】

実施形態 79 . 実施形態 77 の化合物であって、式中、 R^6 および R^7 は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、ピペリジン環を形成している。

【0141】

実施形態 80 . 実施形態 78 の化合物であって、式中、 R^6 および R^7 は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、ピペラジンまたはモルホリン環を形成している。

【0142】

実施形態 81 . 式 1 または実施形態 1 ~ 80 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^8 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、シアノおよびニトロから選択される。

20

【0143】

実施形態 82 . 実施形態 81 の化合物であって、式中、各 R^8 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、シアノおよびニトロから選択される。

【0144】

実施形態 83 . 実施形態 82 の化合物であって、式中、各 R^8 は、独立して、Cl または F である。

【0145】

実施形態 84 . 式 1 または実施形態 1 ~ 83 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 r^{9a} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、シアノおよびニトロから選択される。

30

【0146】

実施形態 85 . 実施形態 84 の化合物であって、式中、各 r^{9a} は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、シアノおよびニトロから選択される。

【0147】

実施形態 86 . 実施形態 85 の化合物であって、式中、各 r^{9a} は、独立して、Cl、F、 CH_3 、 $-OCH_3$ およびシアノから選択される。

【0148】

実施形態 87 . 実施形態 86 の化合物であって、式中、各 r^{9a} は、独立して、Cl または F である。

40

【0149】

実施形態 88 . 式 1 または実施形態 1 ~ 87 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 r^{9b} は、独立して、 $C_1 \sim C_2$ アルキルである。

【0150】

実施形態 89 . 式 1 または実施形態 1 ~ 88 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、 $C(=S)NH$

50

2 および - U - V - T から選択される。

【0151】

実施形態90．実施形態89の化合物であって、式中、各R³は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシおよび - U - V - T から選択される。

【0152】

実施形態91．実施形態90の化合物であって、式中、各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノ、ニトロ、CH₃、CF₃、-OCH₃、-OCHF₂ および - U - V - T から選択される。

【0153】

実施形態92．式1または実施形態1～91のいずれか1つの化合物であって、式中、Q¹またはQ²の環または環系上の少なくとも1個のR³置換基は - U - V - T である。

【0154】

実施形態93．式1または実施形態1～91のいずれか1つの化合物であって、式中、各R³は - U - V - T 以外である。

【0155】

実施形態94．実施形態89の化合物であって、式中、各R³は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、C₁～C₃アルキルチオ、C₁～C₃ハロアルキルチオ、C₁～C₃アルキルスルフィニル、C₁～C₃ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₃アルキルスルホニル、C₁～C₃ハロアルキルスルホニルおよびC₃～C₄シクロアルキルから選択される。

【0156】

実施形態95．実施形態94の化合物であって、式中、各R³は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシおよびC₁～C₃ハロアルコキシから選択される。

【0157】

実施形態96．実施形態95の化合物であって、式中、各R³は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃アルコキシおよびC₁～C₃ハロアルコキシから独立して選択される。

【0158】

実施形態97．実施形態96の化合物であって、式中、各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノ、C₁～C₂アルキル、C₁～C₂ハロアルキル、C₁～C₂アルコキシおよびC₁～C₂ハロアルコキシから選択される。

【0159】

実施形態98．実施形態97の化合物であって、式中、各R³は、F、Cl、Br、シアノ、メチル、C₁～C₂アルコキシおよびフルオロメトキシから独立して選択される。

【0160】

実施形態99．実施形態98の化合物であって、式中、各R³は、F、Cl、シアノ、メチル、C₁～C₂アルコキシおよびフルオロメトキシから独立して選択される。

【0161】

実施形態100．実施形態95の化合物であって、式中、各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノ、ニトロ、CH₃、CF₃、-OCH₃ および - OCHF₂ から選択される。

【0162】

実施形態101．実施形態89～98または100のいずれか1つの化合物であって、式中、各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノおよびメトキシから選択される。

【0163】

実施形態102．実施形態101の化合物であって、式中、各R³は、独立して、F、Cl、Brおよびシアノから選択される。

10

20

30

40

50

【0164】

実施形態103．実施形態101の化合物であって、式中、各 R^3 は、独立して、F、Cl、シアノおよび $-OCH_3$ から選択される。

【0165】

実施形態104．式1または実施形態1～92のいずれか1つの化合物であって、式中、各Uは独立して、Oまたは $NR^{2,2}$ である。

【0166】

実施形態105．実施形態104の化合物であって、式中、各Uは、独立して、OまたはNHである。

【0167】

実施形態106．式1または実施形態1～92および104～105のいずれか1つの化合物であって、式中、各Vは $C_2 \sim C_4$ アルキレンである。

【0168】

実施形態107．式1または実施形態1～92および104～106のいずれか1つの化合物であって、式中、各Tは、独立して、 $NR^{2,3a}R^{2,3b}$ または $OR^{2,4}$ である。

【0169】

実施形態108．式1または実施形態1～92および104～107のいずれか1つの化合物であって、式中、各 $r^{2,3a}$ および $r^{2,3b}$ は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである。

【0170】

実施形態109．式1または実施形態1～92および104～108のいずれか1つの化合物であって、式中、各 $R^{2,4}$ は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである。

【0171】

実施形態110．式1または実施形態1～109のいずれか1つの化合物であって、式中、 Q^1 または Q^2 のフェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルに結合している R^3 置換基が、F、Cl、Br、シアノ、メチル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシおよびフルオロメトキシ以外である場合、前記 R^3 置換基は、パラ位(フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニル環の)に結合している。

【0172】

実施形態111．式1または実施形態1～110のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^4 は、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルあるいは $-SR^{1,0}$ であり；または、各々が2個以下の $R^{1,2}$ で任意により置換されている $C_1 \sim C_6$ アルキルあるいは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである。

【0173】

実施形態112．実施形態111の化合物であって、式中、 R^4 は、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルあるいは $-SR^{1,0}$ であり；または、1個の $R^{1,2}$ で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルである。

【0174】

実施形態113．実施形態112の化合物であって、式中、 R^4 は、H、ホルミル、 $-CH_2OCH_3$ 、シクロプロピル、 $-SCH_3$ 、 $-SCF_3$ または $-CH_2CN$ である。

【0175】

実施形態114．実施形態113の化合物であって、式中、 R^4 は、H、ホルミル、シクロプロピルまたは $-CH_2CN$ である。

【0176】

実施形態115．実施形態113の化合物であって、式中、 R^4 は、H、ホルミル、 $-CH_2OCH_3$ 、シクロプロピル、 $-SCH_3$ または $-SCF_3$ である。

【0177】

実施形態116．実施形態115の化合物であって、式中、 R^4 は、H、ホルミルまたはシクロプロピルである。

10

20

30

40

50

【0178】

実施形態117．実施形態114または116の化合物であって、式中、 R^4 はHである。

【0179】

実施形態118．式1または実施形態1～117のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{13} はHまたは CH_3 である。

【0180】

実施形態119．実施形態118の化合物であって、式中、 R^{13} は CH_3 である。

【0181】

実施形態120．式1または実施形態1～119のいずれか1つの化合物であって、式中、各 R^{12} は、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたはシアノである。

10

【0182】

実施形態121．実施形態120の化合物であって、式中、各 R^{12} は、独立して、シクロプロピル、 $-OCH_3$ またはシアノである。

【0183】

実施形態122．実施形態120の化合物であって、式中、各 R^{12} は、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシである。

【0184】

実施形態123．実施形態122の化合物であって、式中、各 R^{12} は、独立して、シクロプロピルまたは $-OCH_3$ である。

20

【0185】

実施形態124．式1または実施形態1～123のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{10} は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CF_3 または CF_2CF_3 である。

【0186】

実施形態125．実施形態124の化合物であって、式中、 R^{10} は CH_3 である。

【0187】

実施形態126．式1または実施形態1～125のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{11} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルチオである。

30

【0188】

実施形態127．実施形態126の化合物であって、式中、 R^{11} は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 、 $-SCH_3$ または $-SCH_2CH_3$ である。

【0189】

実施形態128．実施形態127の化合物であって、式中、 R^{11} は、 CH_3 、 $-OCH_3$ または $-SCH_3$ である。

【0190】

実施形態129．式1または実施形態1～128のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{15} は、Hまたは CH_3 である。

【0191】

実施形態130．実施形態129の化合物であって、式中、 R^{15} はHである。

40

【0192】

実施形態131．式1または実施形態1～130のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{16} は、 CH_3 または OR^{18} である。

【0193】

実施形態132．実施形態131の化合物であって、式中、 R^{16} は OR^{18} である。

【0194】

実施形態133．式1または実施形態1～132のいずれか1つの化合物であって、式中、 R^{18} はHである。

【0195】

50

実施形態 134 . 式 1 または実施形態 1 ~ 133 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、W は O である。

【0196】

実施形態 135 . 式 1 または実施形態 1 ~ 134 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、M⁺ は、ナトリウム、カリウムおよびリチウムイオンから選択されるカチオンである。

【0197】

実施形態 136 . 実施形態 135 の化合物であって、式中、M⁺ は、ナトリウムおよびカリウムイオンから選択されるカチオンである。

【0198】

実施形態 137 . 実施形態 136 の化合物であって、式中、M⁺ はナトリウムイオンである。

【0199】

実施形態 138 . 式 1 または実施形態 1 ~ 137 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、m は 0 である。

【0200】

実施形態 139 . 式 1 または実施形態 1 ~ 138 のいずれか 1 つの化合物であって、式中、n は 0 である。

【0201】

上記の実施形態 1 ~ 139、ならびに、本明細書に記載の任意の他の実施形態を含む本発明の実施形態は、任意の様式で組み合わせることが可能であり、および、実施形態における可変要素の記載は、式 1 の化合物だけではなく、式 1 の化合物の調製に有用である出発化合物および中間体化合物（例えば式 2 の化合物）にも関連する。加えて、上記の実施形態 1 ~ 139、ならびに、本明細書に記載の任意の他の実施形態を含む、本発明の実施形態および任意のこれらの組み合わせは、本発明の組成物および方法に関する。

【0202】

以下により、実施形態 1 ~ 139 の組み合わせが例示されている。

実施形態 A . 式 1 の化合物であって、式中、

Q¹ は、各々が R³ から独立して選択される 1 ~ 4 個の置換基で置換されている、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルであるが；ただし、R³ 置換基がメタ位に位置されている場合は、前記 R³ 置換基は、F、Cl、Br およびシアノから選択され；

Q² は、各々が R³ から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルであるが、ただし、R³ 置換基がメタ位に位置されている場合は、前記 R³ 置換基は、F、Cl、Br およびシアノから選択され；

X は、O、NR⁴、C(=O) または CR¹⁵R¹⁶ であり；

R¹ は、H、ハロゲン、C₁ ~ C₆ アルキル、C₁ ~ C₆ ハロアルキル、CO₂R⁵、C(O)NR⁶R⁷、シアノ、C₁ ~ C₆ アルコキシ、C₁ ~ C₆ ハロアルコキシまたは C₂ ~ C₅ アルコキシアルキルであり；

R^{1a} は H であり；

R² は、CH₃、CH₂CH₃、Cl または Br であり；

各 R³ は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、C₁ ~ C₃ アルコキシ、C₁ ~ C₃ ハロアルコキシ、C₁ ~ C₃ アルキルチオ、C₁ ~ C₃ ハロアルキルチオ、C₁ ~ C₃ アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₃ アルキルスルホニル、C₁ ~ C₃ ハロアルキルスルホニル、C₃ ~ C₄ シクロアルキル、C(=S)NH₂ および -U-V-T から選択され；

R⁴ は、H、ホルミル、C₃ ~ C₇ シクロアルキルあるいは -SR¹⁰ であるか；または、各々が 2 個以下の R¹² で任意により置換されている、C₁ ~ C₆ アルキルあるいは

10

20

30

40

50

$C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；
 R^5 は $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；
 R^6 は、H または $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；
 R^7 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルあるいは $C_4 \sim C_8$ アルキルシクロアルキルであり；または
 R^6 および R^7 は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、炭素原子と、O および NR^{13} から選択される 1 個以下の環員とから選択される環員を、結合している窒素原子に追加して含有している 4 員～7 員非芳香族複素環を形成し；
各 R^{12} は、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシまたはシアノであり；
 R^{13} は H または CH_3 であり；
 R^{15} は H または CH_3 であり；ならびに
 R^{16} は OR^{18} である。

10

【0203】

実施形態 B . 実施形態 A の化合物であって、式中

Q^1 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルであり；
 Q^2 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルであり；
 R^1 は、H、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；
 R^2 は、 CH_3 、Cl または Br であり；
各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシおよび - U - V - T から選択され；
 R^4 は、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルあるいは $-SR^{10}$ であるか；または、1 個の R^{12} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；
各 R^{12} は、独立して、シクロプロピル、 $-OCH_3$ またはシアノであり；
 R^{15} は H であり；
各 U は、独立して、O または NH であり；
各 V は $C_2 \sim C_4$ アルキレンであり；
各 T は、独立して、 $NR^{23a}R^{23b}$ または OR^{24} であり；
各 r^{23a} および r^{23b} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；ならびに
各 R^{24} は、独立して、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルである。

20

30

【0204】

実施形態 C . 実施形態 B の化合物であって、式中

Q^1 および Q^2 の少なくとも一方は、 R^3 から独立して選択される 2 個または 3 個の置換基で置換されているフェニルであり；
 R^1 は H または CH_3 であり；
 R^2 は CH_3 であり；
 R^4 は H であり；
各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシから選択され；ならびに
 R^{18} は H である。

40

【0205】

実施形態 D . 実施形態 C の化合物であって、式中

Q^1 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであるか；または、2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであるか；または、2 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択さ

50

れる置換基で置換されているフェニルであり；

Q²は、2位、4位および6位で、R³から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであるか；または、2位および4位で、R³から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであるか；または、2位および6位で、R³から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

Xは、O、NR⁴またはCR^{1 5}R^{1 6}であり；

R¹はHであり；

各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノ、C₁~C₂アルキル、C₁~C₂ハロアルキル、C₁~C₂アルコキシおよびC₁~C₂ハロアルコキシから選択され；ならびに

R⁴はHである。

【0206】

実施形態E．実施形態Dの化合物であって、式中

各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノ、メチル、C₁~C₂アルコキシおよびフルオロメトキシから選択される。

【0207】

実施形態F．実施形態Eの化合物であって、式中

Xは、OまたはNHであり；ならびに

各R³は、独立して、F、Cl、Br、シアノおよびメトキシから選択される。

【0208】

特定の実施形態は、以下からなる群から選択される式1の化合物を含む。

4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 18)、

N - (4 - クロロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 22)、

4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - N - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 23)、

4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 24)、

N - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 4 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 36)、

4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 41)、

4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ] - 3, 5 - ジフルオロベンゾニトリル (化合物 45)、

4 - [[4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ] - 3 - フルオロベンゾニトリル (化合物 361)、

4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 172)、

4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ] - 3 - フルオロベンゾニトリル (化合物 118)、

3 - クロロ - 4 - [[4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ]ベンゾニトリル (化合物 358)、

4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 351)、

N, 4 - ビス(2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 175)、

N - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 193)、

N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル)

10

20

30

40

50

- ル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 297)、
 N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 343)、
 N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 349)、
 N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 357)、
 3 - クロロ - 4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ]ベンゾニトリル (化合物 139)、
 4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]アミノ] - 3, 5 - ジフルオロ - ベンゾニトリル (化合物 91)、
 4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ] - 2, 5 - ジフルオロ - ベンゾニトリル (化合物 148)、
 N - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 87)、
 , 4 - ビス(2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 352)、
 N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 286)、
 N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 287)、
 N - (2, 6 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 368)、
 3 - クロロ - 4 - [5 - [(2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル)アミノ] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - ベンゾニトリル (化合物 332)、
 3 - クロロ - 4 - [5 - [(4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル)アミノ] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - ベンゾニトリル (化合物 336)、
 N - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 346)、
 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 4 - ジクロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 367)、
 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2, 6 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 369)、
 4 - [[4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ] - 3 - フルオロベンゾニトリル (化合物 284)、
 N - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 265)、
 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 266)、
 N - (4 - ブロモ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 364)、
 4 - [[4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル]オキシ] - 3, 5 - ジフルオロ - ベンゾニトリル (化合物 232)、
 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 292)、
 4 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - N - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 360)、
 N - (4 - ブロモ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 365)、
 3 - ブロモ - 4 - [[4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H

- ピラゾール - 5 - イル] オキシ] ベンゾニトリル (化合物 372)、
 3 - クロロ - 4 - [[4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H
 - ピラゾール - 5 - イル] オキシ] ベンゾニトリル (化合物 373)、
 N - (2, 4 - ジクロロ - 6 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 374)、
 N - (2, 6 - ジクロロ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 375)、
 N - (2 - ブロモ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 376)、
 N - (2 - ブロモ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 377)、
 N - (4 - ブロモ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 378)、
 N - (2 - ブロモ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 379)、
 N - (2 - ブロモ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物 380)、
 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 381)、
 4 - [5 - [(2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) アミノ] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 3 - フルオロベンゾニトリル (化合物 382)、
 4 - [5 - [(4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェニル) アミノ] - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル] - 3 - フルオロベンゾニトリル (化合物 383)、
 - (2 - クロロ - 4, 6 - ジフルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 384)、
 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 385)、および
 - (2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル) - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 386)。

【0209】

本発明は、式1の化合物(そのすべての幾何異性体および立体異性体、N - オキシド、ならびに、塩を含む)と、少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ剤とを含む殺菌・殺カビ組成物を提供する。このような組成物の実施形態として注目すべきは、上述の化合物実施形態のいずれかに対応する化合物を含む組成物である。

【0210】

本発明は、殺菌・殺カビ的に有効な量の式1の化合物(そのすべての幾何異性体および立体異性体、N - オキシド、ならびに、塩を含む)と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とを含む殺菌・殺カビ組成物を提供する。このような組成物の実施形態として注目すべきは、上述の化合物実施形態のいずれかに対応する化合物を含む組成物である。

【0211】

本発明は、植物もしくはその一部分または植物種子に、殺菌・殺カビ的に有効な量の式1の化合物(そのすべての幾何異性体および立体異性体、N - オキシド、ならびに、塩を含む)を適用する工程を含む真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法を提供する。このような方法の実施形態として注目すべきは、上述の化合物実施形態のいずれかに対応する化合物を殺菌・殺カビ的に有効な量で適用する工程を含む方法である。特に注目すべきは、化合物が本発明の組成物として適用される実施形態である。

【0212】

注目すべきは、式1P(すべての幾何異性体および立体異性体を含む)、そのN - オキシド、および塩の化合物である式1の化合物であり、また、これらを含む農学的組成

10

20

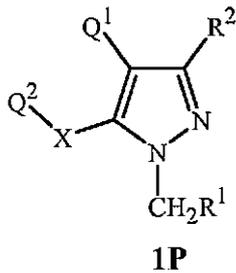
30

40

50

物および殺菌・殺カビ剤としてのこれらの使用である。

【化14】



10

式中、

Q¹ および Q² は、独立して、フェニル、チエニル、ピリジニル、ピリダジニル、ピラジニルまたはピリミジニルであり、各々は、R³ から独立して選択される5個以下の置換基で任意により置換されており；

X は、O、S(O)_m または NR⁴ であり；

R¹ は、H、ハロゲン、C₁~C₆ アルキル、C₁~C₆ ハロアルキル、C₂~C₄ アルケニル、C₂~C₄ アルキニル、C₃~C₇ シクロアルキル、CO₂R⁵、C(O)NR⁶R⁷、シアノ、C₁~C₆ アルコキシ、C₁~C₆ ハロアルコキシあるいはC₂~C₅ アルコシアルキルであるか；または

R¹ は、3個以下のR⁸ で任意により置換されているフェニルであるか；または、炭素原子環員上のR^{9a} および窒素原子環員上のR^{9b} から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている5員または6員窒素含有芳香族複素環であり；

20

R² は、CH₃、CH₂CH₃、シクロプロピルまたはハロゲンであり；

各R³ は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、C₁~C₄ アルキル、C₁~C₄ ハロアルキル、C₁~C₃ アルコキシ、C₁~C₃ ハロアルコキシ、C₁~C₃ アルキルチオ、C₁~C₃ ハロアルキルチオ、C₁~C₃ アルキルスルフィニル、C₁~C₃ ハロアルキルスルフィニル、C₁~C₃ アルキルスルホニル、C₁~C₃ ハロアルキルスルホニル、C₃~C₄ シクロアルキル、C₃~C₇ シクロアルコキシ、C₄~C₆ アルキルシクロアルキル、C₄~C₆ シクロアルキルアルキル、C₃~C₇ ハロシクロアルキル、C₂~C₄ アルケニルおよびC₂~C₄ アルキニルから選択され；

30

R⁴ は、H、ホルミル、C₃~C₇ シクロアルキル、-SO₃⁻M⁺、-SR¹⁰ あるいは-(C=W)R¹¹ であるか；または、各々が2個以下のR¹² で任意により置換されている、C₁~C₆ アルキルもしくはC₁~C₆ ハロアルキルであり；

R⁵ は、H、C₁~C₆ アルキルまたはC₁~C₆ ハロアルキルであり；

R⁶ およびR⁷ は、H、C₁~C₆ アルキル、C₁~C₆ ハロアルキル、C₃~C₇ シクロアルキル、C₄~C₈ シクロアルキルアルキルおよびC₄~C₈ アルキルシクロアルキルから独立して選択されるか；または

R⁶ およびR⁷ は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、炭素原子と、任意によりO、S(O)_n およびNR¹³ から選択される1個以下の環員とから選択される環員を、前記結合している環窒素原子に追加して含有している4員~7員非芳香族複素環を形成し；

40

各R⁸、R^{9a} およびR^{9b} は、独立して、ハロゲン、C₁~C₂ アルキル、C₁~C₂ ハロアルキル、C₁~C₂ アルコキシ、C₁~C₂ ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、SCH₃、S(O)CH₃ およびS(O)₂CH₃ から選択され；

R¹⁰ は、C₁~C₆ アルキルまたはC₁~C₆ ハロアルキルであり；

R¹¹ は、C₁~C₆ アルキル、C₁~C₆ アルコキシ、C₂~C₇ アルコシアルキル、C₂~C₇ アルキルアミノアルキル、C₃~C₈ ジアルキルアミノアルキル、C₁~C₆ アルキルチオまたはC₂~C₇ アルキルチオアルキルであり；

各R¹² は、独立して、C₃~C₇ シクロアルキル、C₁~C₄ アルコキシ、C₁~C

50

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または $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルであり；
 R^{13} は、H、 $C_1 \sim C_3$ アルキルまたは $C_2 \sim C_3$ ハロアルキルであり；
 WはOまたはSであり；
 M^+ はカチオンであり；
 Mは0、1または2であり；ならびに
 Nは0、1または2である。

【0213】

従って、注目すべきは、上記に定義されているとおり、式1Pから選択される化合物（すべての幾何異性体および立体異性体を含む）、そのN-オキド、および、塩である。また、注目すべきは、実施形態1～139および実施形態A～Fに対応する実施形態である対応実施形態であり、ここで、前記対応実施形態において、「式1」は、「式1P」によって置き換えられ、および、前記対応実施形態の範囲は、式1Pについて上記に定義されている範囲を超えない。式1Pに適用された実施形態1～139の組み合わせの例は、実施形態AP、BP、CP、DPおよびEPである。

【0214】

実施形態AP、式1Pの化合物であって、式中

Q^1 は、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルであり、各々は、 R^3 から独立して選択される1～4個の置換基で置換されている；

Q^2 は、各々が R^3 から独立して選択される1、2または3個の置換基で置換されている、フェニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニルまたはピリダジニルであり；

Xは、Oまたは NR^4 であり；

R^1 が、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 CO_2R^5 、 $C(O)NR^6R^7$ 、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシまたは $C_2 \sim C_5$ アルコキシアルキルであり；または

R^1 は、炭素原子環員上の R^9a および窒素原子環員上の R^9b から独立して選択される3個以下の置換基で任意により置換されている5員または6員窒素含有芳香族複素環であり；

R^2 は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、ClまたはBrであり；

各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルホニルおよび $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルから選択され；

R^4 は、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルあるいは $-SR^{10}$ であるか；または、各々が2個以下の R^{12} で任意により置換されている、 $C_1 \sim C_6$ アルキルまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルであり；

R^5 は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^6 は、Hまたは $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^7 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルまたは $C_4 \sim C_8$ アルキルシクロアルキルであり；または

R^6 および R^7 は、これらが結合している窒素原子と一緒にあって、炭素原子と、Oおよび NR^{13} から選択される1個以下の環員とから選択される環員を、結合している窒素原子に追加して含有している4員～7員非芳香族複素環を形成し；

各 R^8 は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、シアノおよびニトロから選択され；

各 R^9a は、独立して、ハロゲン、 $C_1 \sim C_2$ アルキル、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ ハロアルコキシ、シアノおよびニトロから選択され；

各 R^9b は、 $C_1 \sim C_2$ アルキルであり；

10

20

30

40

50

R^{10} は、 CH_3 、 CH_2CH_3 、 CF_3 または CF_2CF_3 であり；
 各 R^{12} は、独立して、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルまたは $C_1 \sim C_4$ アルコキシであり；
 ；ならびに
 R^{13} は、H または CH_3 である。

【0215】

実施形態 B P . 式 A P の化合物であって、式中

Q^1 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルであり；

Q^2 は、各々が R^3 から独立して選択される 1、2 または 3 個の置換基で置換されている、フェニルまたはピリジニルであり；

X は、 NR^4 であり；

R^1 は、H、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシまたは $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシであり；

R^2 は CH_3 であり；

各 R^3 は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシから選択され；

R^4 が、H、ホルミル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキルあるいは $-SR^{10}$ であるか；または、1 個の R^{12} で置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R^{10} は、 CH_3 であり；ならびに

各 R^{12} は、独立して、シクロプロピルまたは $-OCH_3$ である。

【0216】

実施形態 C P . 式 A P の化合物であって、式中

Q^1 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；または

Q^1 は、2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

Q^2 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

X は O であり；

R^2 は CH_3 であり；

各 R^3 は、独立して、F、Cl、Br、シアノ、ニトロ、 CH_3 、 CF_3 、 $-OCH_3$ 、および $-OCHF_2$ から選択され；ならびに

R^4 は、H、ホルミルまたはシクロプロピルである。

【0217】

実施形態 D P . 式 C P の化合物であって、式中

Q^1 は、2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

Q^2 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

各 R^3 は、独立して、F、Cl、シアノおよび $-OCH_3$ から選択され；ならびに

R^4 は H である。

【0218】

実施形態 E P . 式 B P の化合物であって、式中

Q^1 は、2 位および 4 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

Q^2 は、2 位、4 位および 6 位で、 R^3 から独立して選択される置換基で置換されているフェニルであり；

各 R^3 は、独立して、F、Cl、CN および $-OCH_3$ から選択され；ならびに

R^4 は H である。

【0219】

10

20

30

40

50

また、注目すべきは、殺菌・殺力比的に有効な量の式1 Pの化合物（そのすべての幾何異性体および立体異性体、N - オキシド、ならびに、塩を含む）または実施形態1 ~ 139および実施形態A ~ Fに対応する実施形態である対応実施形態のいずれか1つ（例えば、実施形態AP、BP、CP、DPまたはEP）、ならびに、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む殺菌・殺力比組成物である。また、注目すべきは、植物もしくはその一部分または植物種子に、殺菌・殺力比的に有効な量の式1 Pの化合物（そのすべての幾何異性体および立体異性体、N - オキシド、ならびに、塩を含む）または前記対応実施形態のいずれか1つを適用する工程を含む真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法である。特に注目すべきは、式1 Pの化合物が本発明の組成物として適用される実施形態である。

10

【0220】

スキーム1 ~ 24に記載されている以下の方法および変形の1つまたは複数を用いて式1（式1 Pを含む）の化合物を調製することが可能である。以下の式1 ~ 33の化合物中の Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 およびmの定義は、特に記載のない限り、上記発明の概要に定義されているとおりである。式1 a、1 b、1 c、1 d、1 e、1 f、1 gおよび1 hは式1の種々のサブセットであり；式4 a、4 bおよび4 cは式4の種々のサブセットであり；式6 aおよび6 bは式6の種々のサブセットであり；式11 aは式11のサブセットであり；式13 aは式13のサブセットまたは類似体であり；ならびに、式17 aは式17のサブセットである。各サブセット式に対する置換基は、特に記載のない限り、その親式について定義されているとおりである。

20

【0221】

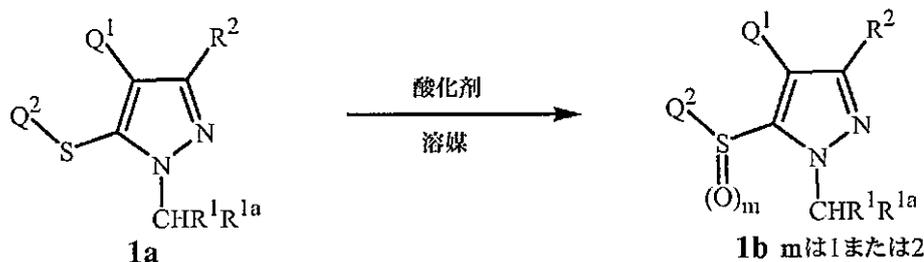
スキーム1に例示されているとおり、式1 bのスルホキシドおよびスルホン（すなわち、Xが $S(O)_m$ であり、および、mが1または2である式1）は、式1 aのスルフィドの結合硫黄原子の酸化を介して形成されることが可能である（すなわち、Xが $S(O)_m$ であり、および、mが0である式1）。この方法において、mが1（すなわち、スルホキシド）であるか、または、mが2（すなわち、スルホン）である式1 bの化合物は、式1 aの対応するスルフィドを好適な酸化剤で酸化させることにより調製される。典型的な手法においては、所望される生成物の酸化状態に応じて1 ~ 4当量の量の酸化剤が、溶剤中の式1 aの化合物の溶液に添加される。有用な酸化剤としては、Oxone（登録商標）（ペルオキシ - モノ - 硫酸カリウム）、過酸化水素、過ヨウ素酸ナトリウム、過酢酸、および、3 - クロロ過安息香酸が挙げられる。溶剤は、利用される酸化剤に関連して選択される。水性エタノールまたは水性アセトンがペルオキシモノ硫酸カリウムと共に好ましく用いられ、およびジクロロメタンが一般に3 - クロロ過安息香酸に好ましい。有用な反応温度は、典型的には、 $-78 \sim 90$ の範囲である。スルフィドをスルホキシドおよびスルホンに酸化させる有用な特定の手法は、Brandら、J. Agric. Food Chem., 1984年, 32, 221 ~ 226ページ、および、その中で引用されている文献に記載されている。

30

【0222】

【化15】

スキーム1



40

【0223】

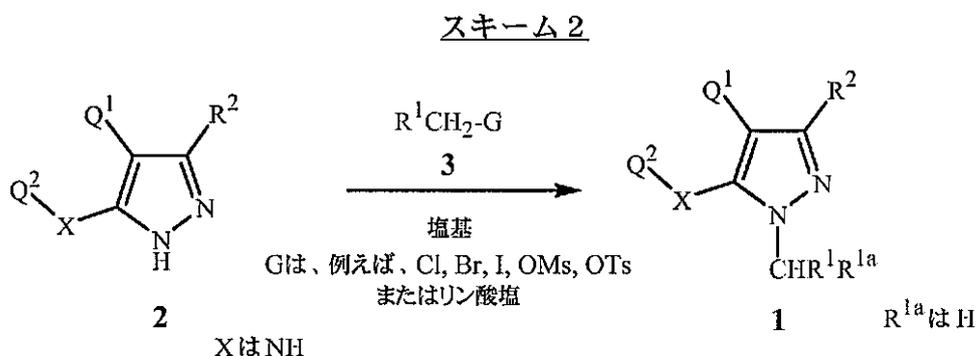
50

スキーム 2 に示されているとおり、X が NH であり、および、 r^{1a} が H である式 1 の化合物は、式 2 の 1H-ピラゾール化合物と、ヨードアルカン、アルキルスルホネート（例えば、メシレート（oms）またはトシレート（ots））またはトリアルキルホスフェートなどの種々のアルキル化剤（例えば、式 3）とを、好ましくは 1, 8-ジアザピシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン、炭酸カリウムまたは水酸化カリウムなどの有機塩基または無機塩基の存在下におよび、N, N-ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、トルエンまたは水などの溶剤中に反応させることにより調製することが可能である。

【0224】

【化16】

10



20

【0225】

CHR^{1a} が任意により置換されているシクロプロピル環を形成する式 1 の化合物は、同様に、式 2 のピラゾールと、トリシクロプロピルビスマスなどの有機金属試薬とを、銅アセテートなどの触媒の存在下に、技術分野において公知である条件下で反応させることにより調製されることが可能である。例えば、J. Am. Chem. Soc. 2007年、129(1), 44~45ページを参照のこと。スキーム 2 の方法における出発材料として注目すべきは、以下の表 588~671 に具体的に開示されている式 2 の化合物である。

【0226】

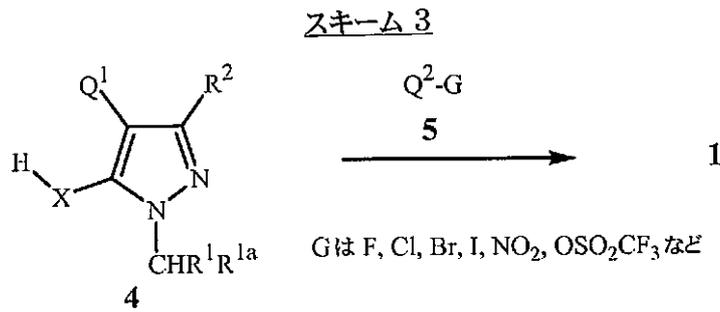
スキーム 3 に示されているとおり、式 1 の化合物は、式 4 の化合物（すなわち、X が NR^4 であれば 5-アミノピラゾール、X が O であれば 5-ヒドロキシピラゾール（5-ピラズロン）、または、X が S であれば 5-メルカプトピラゾール）と、脱離基 G（すなわち、ハロゲンまたは（ハロ）アルキルスルホネート）を含有する式 5 の芳香族化合物とを、任意により、金属触媒の存在下に、ならびに、一般に、塩基、および、N, N-ジメチルホルムアミドまたはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶剤の存在下に反応させることにより調製されることが可能である。例えば、 Q^2 が、電子不足芳香族複素環、または、電子求引性置換基を有するベンゼン環である式 5 の化合物は、環からの脱離基 G の直接的な置き換えにより反応して式 1 の化合物をもたらす。 Q^2 が sp^3 -混成炭素原子を介して結合している式 5 の化合物について、G は、典型的には、Cl, Br, I、

30

40

【0227】

【化17】



10

【0228】

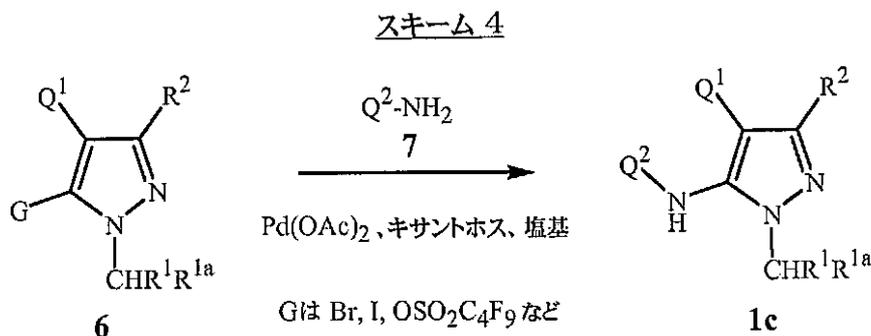
十分に電子求引性の置換基に欠く、XがOまたはNR⁴である式4の化合物とQが芳香族または芳香族複素環Qである式5の化合物(Q²-G)とのスキーム3の方法による反応について、あるいは、反応速度、収率または生成物純度を改善するために、触媒量から超化学両論量の範囲の量での金属触媒(例えば、金属または金属塩)の使用が所望の反応を促進させることが可能である。典型的には、これらの条件については、Gは、Br、または、I、または、OS(O)₂CF₃もしくはOS(O)₂(CF₂)₃CF₃などのスルホネートである。例えば、銅塩錯体(例えば、CuIとN,N'-ジメチル-エチレンジアミン、プロリンまたはピリジル)、パラジウム錯体(例えば、トリス(ジベンジリデン-アセトン)ジパラジウム(0))、または、パラジウム塩(例えば、パラジウムアセテート)と4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9,9-ジメチルキサンテン(すなわち、「キサントホス」)、2-ジシクロヘキシル-ホスフィノ-2',4',6'-トリイソプロピルピフェニル(すなわち、「Xphos」)または2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフタレン(すなわち、「BINAP」)などのリガンドが、炭酸カリウム、炭酸セシウム、ナトリウムフェノキシドまたはナトリウムt-ブトキシドなどの塩基の存在下に、N,N-ジメチルホルムアミド、1,2-ジメトキシエタン、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサンまたはトルエンなどの、任意によりエタノールなどのアルコールと混合される溶剤中に用いられることが可能である。あるいは、スキーム4に例示されているとおり、式1cの化合物(すなわち、XがNR⁴であり、および、R⁴がHである式1)は、式6の化合物(すなわち、5-プロモピラゾール、または、5位で脱離基で置換されている他のピラゾール)と、式7の化合物とを、スキーム3について上述したものと同様の金属触媒条件下で反応させることにより調製されることが可能である。式7の化合物は市販されているか、または、これらの調製は技術分野において公知である。

20

30

【0229】

【化18】



40

【0230】

スキーム5に示されているとおり、GがBrまたはIである式6の化合物は、式4aの5-アミノピラゾール(すなわち、XがNHである式4)を、ジアゾ化条件下に、臭化物

50

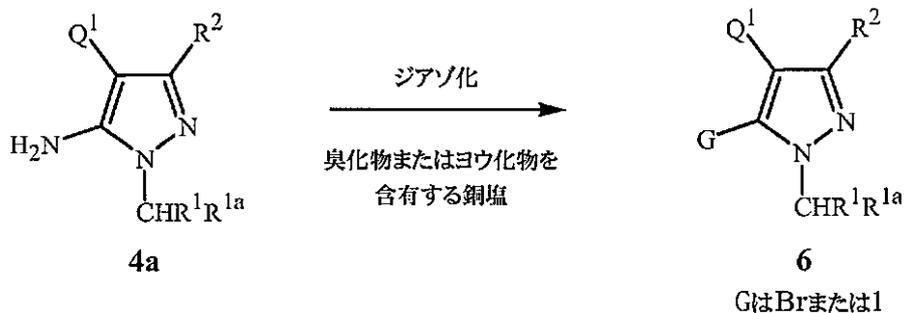
またはヨウ化物を含有する銅塩の存在下に、または、続いて、これらの組み合わせ下で反応させることにより調製されることが可能である。例えば、亜硝酸 t - プチルの式 4 a の 5 - アミノピラゾールの溶液への、アセトニトリルなどの溶剤中の CuBr_2 の存在下での添加が、式 6 の対応する 5 - プロモピラゾールをもたらす。同様に、式 4 a の 5 - アミノピラゾールは、典型的には同一のハロゲン化原子を含有する鉱酸（G が I である場合水性 HI 溶液など）の存在下での、水、酢酸またはトリフルオロ酢酸などの溶剤中の亜硝酸ナトリウムでの処理、続いて、当業者に周知である基本手順に従う対応する銅（I）または銅（II）塩での処理により、ジアゾニウム塩に、次いで、式 6 の対応する 5 - ハロピラゾールに転化されることが可能である。

【 0 2 3 1 】

【 化 1 9 】

10

スキーム 5



20

【 0 2 3 2 】

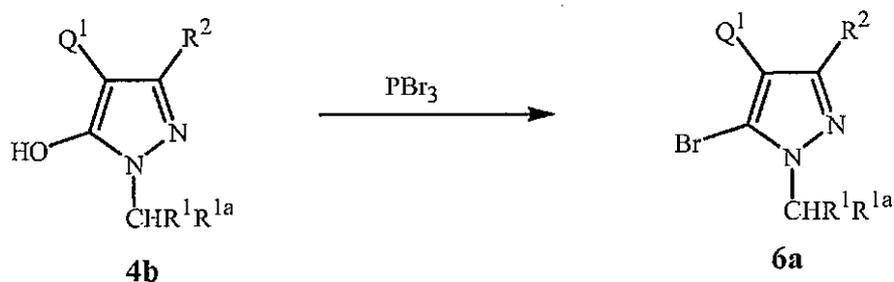
スキーム 6 に示されているとおり、式 6 a の 5 - プロモピラゾール（すなわち、G が Br である式 6）は、Tetrahedron Lett. 2000 年、41 (24)、4713 ページに記載のとおり、式 4 b の 5 - ヒドロキシピラゾール（すなわち、X が O である式 4）を三臭化リンと反応させることにより調製されることが可能である。

【 0 2 3 3 】

【 化 2 0 】

30

スキーム 6



【 0 2 3 4 】

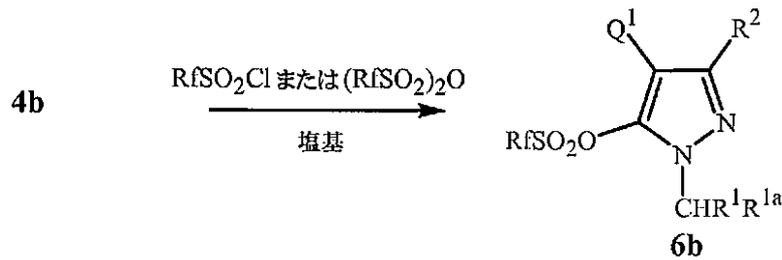
スキーム 7 に示されているとおり、式 4 b の 5 - ヒドロキシピラゾールはまた、Synlett, 2004 年、5, 795 ページに記載されているとおり、式 6 b の 5 - フルオロアルキルスルホニル（例えば、5 - トリフルオロメタンスルホニル、5 - ノナフルオロプチルスルホニル）ピラゾール（すなわち、G がフルオロアルキルスルホニルである式 6）の調製に用いられることが可能である。

【 0 2 3 5 】

40

【化21】

スキーム7



式中、RfはCF₃または(CF₂)₂CF₃などのフルオロアルキル

10

【0236】

スキーム8に示されているとおり、式1の化合物は、Xが、O、NR⁴、C(=O)またはS(O)_m (mは2である)である式10の4-プロモまたはヨードピラゾールと、式Q¹-M (式11)の有機金属化合物とを、遷移金属触媒クロスカップリング反応条件下で反応させることにより調製されることが可能である。式10の4-プロモまたはヨードピラゾールと、式11のボロン酸、トリアルキルスズ、亜鉛または有機マグネシウム試薬とを、必要な場合には適切なりガンド(例えば、トリフェニルホスフィン(pph₃)、ジベンジリデンアセトン(dba)、ジシクロヘキシル(2',6'-ジメトキシ-[1,1'-ビフェニル]-2-イル)ホスフィン(sphos))および塩基を有するパラジウムまたはニッケル触媒の存在下に反応させることにより、式1の対応する化合物が得られる。例えば、置換アリールボロン酸または誘導体(例えば、Q¹が任意により置換されているフェニルまたはヘテロシクリルであり、および、Mが、B(OH)₂、B(OC(CH₃)₂C(CH₃)₂O)である式11)またはB(O-i-Pr)₃・Li⁺は、式10の4-プロモ-または4-ヨードピラゾールと、ジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)、および、炭酸ナトリウムまたは水酸化カリウムなどの水性塩基の存在下に、1,4-ジオキサン、1,2-ジメトキシエタン、トルエンあるいはエチルアルコールなどの溶剤中に、または、ホスフィンオキシドまたは亜リン酸塩リガンド(例えば、ジフェニルホスフィンオキシド)およびフッ化カリウムなどのリガンドと共に無水条件下で、1,4-ジオキサンなどの溶剤中に(Angewandte Chemie, International Edition, 2008年, 47(25), 4695~4698ページを参照のこと)反応して、式1の対応する化合物をもたらす。

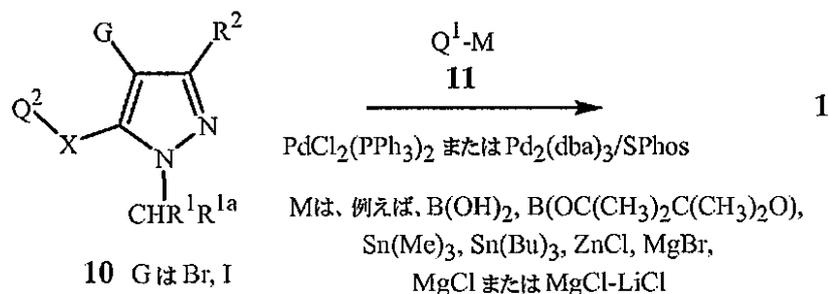
20

30

【0237】

【化22】

スキーム8



40

【0238】

スキーム9に例示されているとおり、式4aの化合物(すなわち、XがNHである式4)は、式12の化合物を式11の化合物(Q¹-B(OH)₂(式11a)など)と、スキーム8の方法に記載の遷移金属触媒クロスカップリング反応条件を用いて反応させるこ

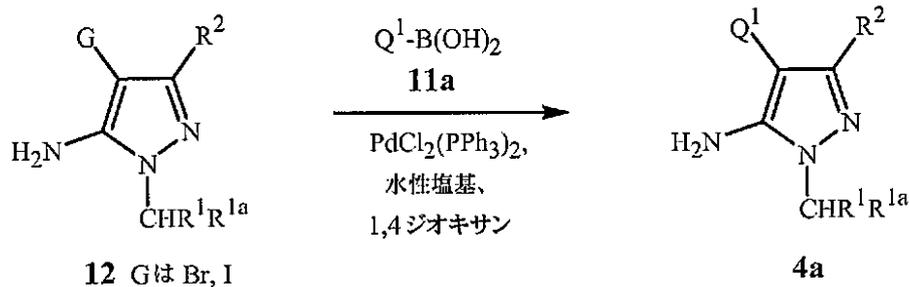
50

とにより調製されることが可能である。

【0239】

【化23】

スキーム9



10

【0240】

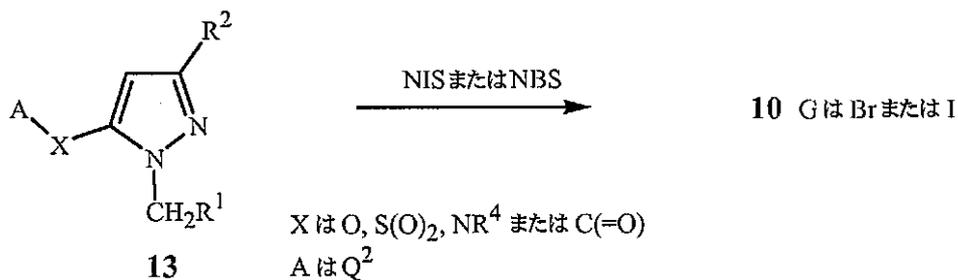
スキーム10に例示されているとおり、XがO、S(O)₂、NR⁴またはC(=O)であり、および、GがBrまたはIである式10のピラゾールは、4位(式13)が未置換であるピラゾールと、臭素、臭化ナトリウム、N-ブロモスクシンイミド(NBS)またはN-ヨードスクシンイミド(NIS)などのハロゲン化試薬とを、酢酸、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセタミドあるいは1,4-ジオキサン、または、水と前述の溶剤との混合物などの溶剤中に、周囲温度から溶剤の沸点の範囲の温度で反応させることにより迅速に調製される。

20

【0241】

【化24】

スキーム10



30

【0242】

しかも、スキーム10の方法のものと同様の反応条件を用いて、AがHまたは保護基である式13の化合物を、式1の化合物の調製に有用である、Q²がそれぞれAで置換されているかまたは保護基である式10に対応する中間体に転化させることが可能である。AがHである式13の化合物は、技術分野において公知である方法によって調製されることが可能である；例えば、Synlett, 2004年, 5, 795~798ページ、米国特許第4256902号明細書およびその中で引用されている文献を参照のこと。しかも、特にR²がメチル、エチルまたはハロゲンである、AがHである式13の化合物のいくつかは市販されている。

40

【0243】

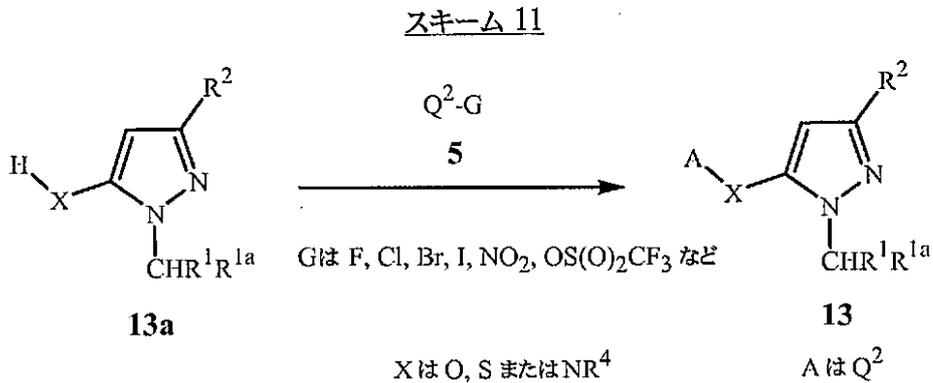
スキーム11に示されているとおり、Xが、O、S(O)_mまたはNR⁴であり、mが0であり、および、AがQ²である式13の化合物は、式13aの対応する化合物(すなわち、AがHである式13)から、スキーム3の方法に用いられるものと同様の手法により調製されることが可能である。XがSである式13の化合物(すなわち、mが0であるS(O)_m)は、次いで、スキーム1の方法について用いられるものなどの手法を用いて

50

酸化されて、スキーム 10 の方法における使用のために、X が $S(O)_2$ である式 13 の対応する化合物をもたらすことが可能である。式 13 a の化合物は、市販されているか、または、技術分野において公知である方法によって調製されることが可能である。

【 0 2 4 4 】

【 化 2 5 】



10

【 0 2 4 5 】

スキーム 12 に示されているとおり、式 1 a の化合物（すなわち、X が $S(O)_m$ であり、および、m が 0 である式 1）、式 1 d（すなわち、X が $CR^{15}R^{16}$ であり、 R^{15} が H であり、 R^{16} が OR^{18} であり、および、 R^{18} が H である式 1）、および、式 1 e（すなわち、X が $C(=O)$ である式 1）は、アルキルリチウム、好ましくは n-ブチルリチウム、または、アルキルマグネシウム試薬、好ましくは塩化イソプロピルマグネシウム（任意により、塩化リチウムで錯化される）などの有機金属試薬（すなわち、式 26）での式 6 の化合物の処理、続いて、硫黄求電子剤（すなわち、式 27）またはカルボニル求電子剤（すなわち、式 28、29 または 30）の添加により調製されることが可能である。反応温度は、 $-90 \sim$ 反応溶剤の沸点の範囲であることが可能であり； $-78 \sim$ 周囲温度の温度が一般に好ましく、アルキルリチウム試薬が用いられる場合 $-78 \sim -10$ の温度が好ましく、および、アルキルマグネシウム試薬が使用される場合は $-20 \sim$ 温度が好ましい。トルエン、エチルエーテル、テトラヒドロフランまたはジメトキシメタンなどの多様な溶剤が有用であり；無水テトラヒドロフランが好ましい。塩化亜鉛、臭化亜鉛、または、ヨウ化銅（I）もしくは銅（I）シアン化物などの一価銅塩などの第 2 の金属成分を、求電子剤が $Q^2C(O)Cl$ （すなわち、式 30）である場合には、求電子剤の前に添加することが遊離である可能性がある。式 27、28、29 および 30 の Q^2 含有硫黄およびカルボニル中間体は、市販されているか、または、技術分野において公知である方法によって調製されることが可能である。

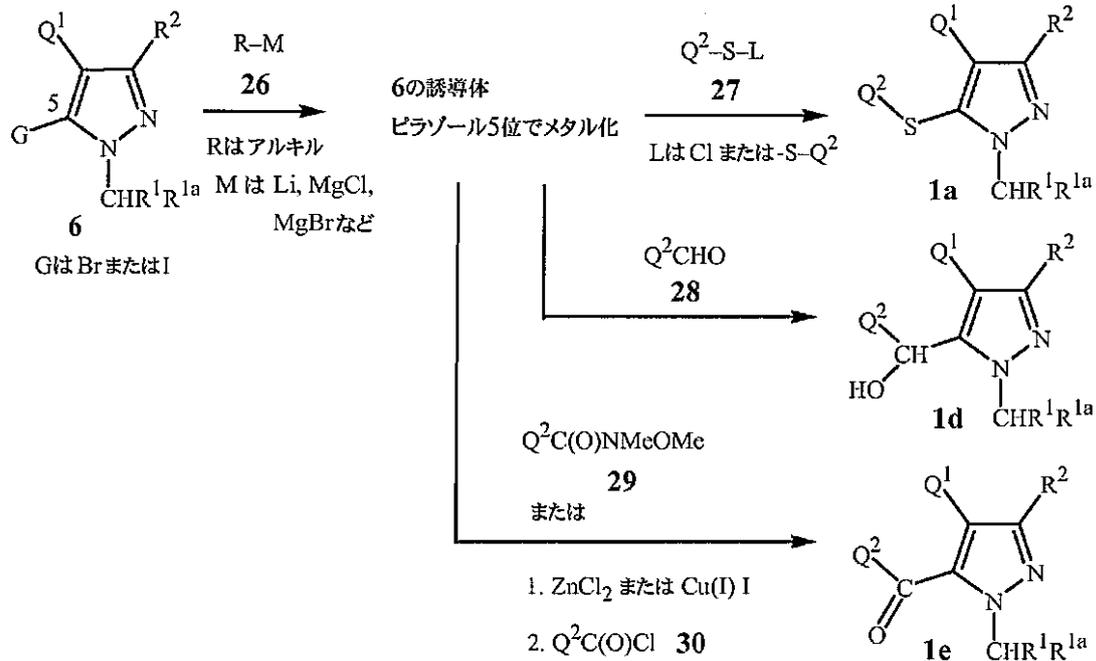
【 0 2 4 6 】

20

30

【化26】

スキーム 12



【0247】

当業者は、スキーム12に示されているものと同様の反応をまた Q^1 置換基を欠くピラゾールに利用し、これにより、スキーム10において概説されている方法において有用である式13の一定の化合物を得ることが可能であることを認識するであろう。

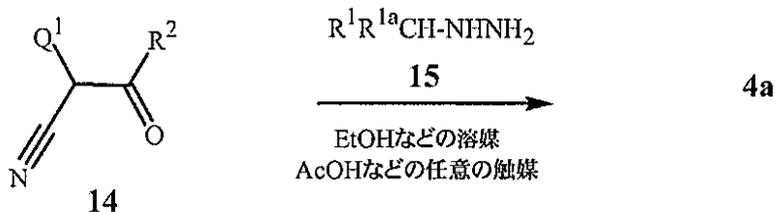
【0248】

式4aの5-アミノピラゾールを調製するために有用な一般的な方法は、技術分野において周知である；例えば、Journal fuer Praktische Chemie (Leipzig), 1911年, 83, 171ページ、および、J. Am. Chem. Soc., 1954年, 76, 501ページを参照のこと。このような方法は、 R^2

【0249】

【化27】

スキーム 13

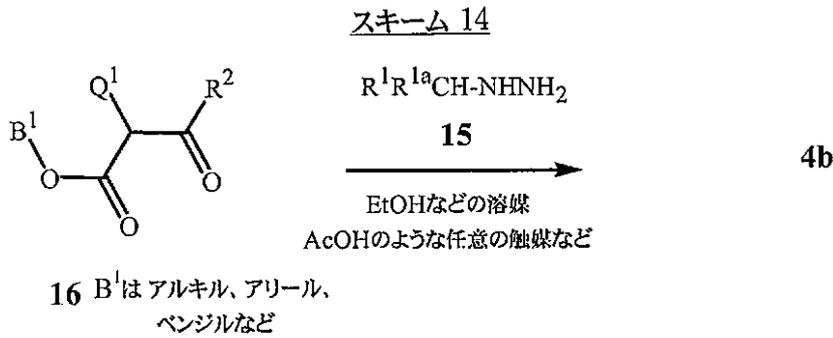


【0250】

同様に、式4bの5-ヒドロキシピラゾールを調製するために有用な一般的な方法は技術分野において周知である；例えば、Annalen der Chemie, 1924年, 436, 88ページを参照のこと。このような方法は、 R^2 がアルキルまたはシクロアルキルであるスキーム14において例示されている。

【0251】

【化28】



10

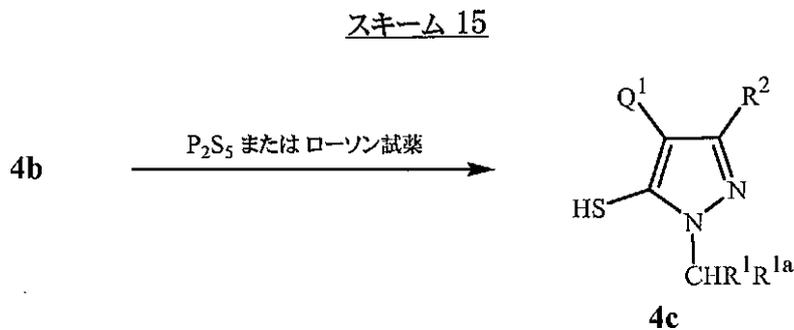
【0252】

スキーム 15 に示されているとおり、式 4 c の 5 - チオピラゾール化合物（すなわち、X が S である式 4）は、式 4 b の対応する 5 - ヒドロキシピラゾール化合物と、P₂S₅（例えば、Justus Liebig's Annalen der Chemie, 1908年, 361, 251ページを参照のこと）、または、Lawesson試薬（2,4 - ビス - (4 - メトキシフェニル) - 1,3 - ジチア - 2,4 - ジホスフェタン 2,4 - ジスルフィド；例えば、国際公開第 2005/118575 号パンフレットを参照のこと）とを、トルエン、キシレンまたはテトラヒドロフランなどの溶剤中で反応させることにより調製されることが可能である。

20

【0253】

【化29】



30

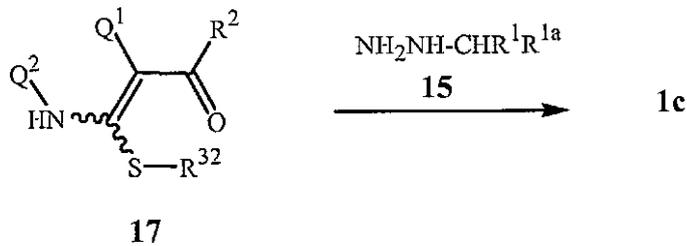
【0254】

スキーム 16 に示されているとおり、式 1 c の化合物（すなわち、X が NR⁴ であり、および、R⁴ が H である式 1）は、式 17 の化合物を、式 15 のアルキルヒドラジンと共に、エタノールまたはメタノールなどの溶剤中に、および、任意により、酢酸、ピペリジンまたはナトリウムメトキシドなどの酸または塩基触媒の存在下に、技術分野において公知である基本手順に従って、縮合させることにより調製されることが可能である。

【0255】

【化30】

スキーム 16



式中、 R^{32} はHまたは低級アルキル(例えば、 CH_3 、 CH_2CH_3 または $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$)

【0256】

スキーム16の方法と同様の様式において、XがNHである式2の化合物は、式17の化合物をヒドラジンと共に縮合させることにより同様に調製されることが可能である。この方法は、Chemistry of Heterocyclic Compounds, 2005, 41(1), 105~110ページに記載されている。

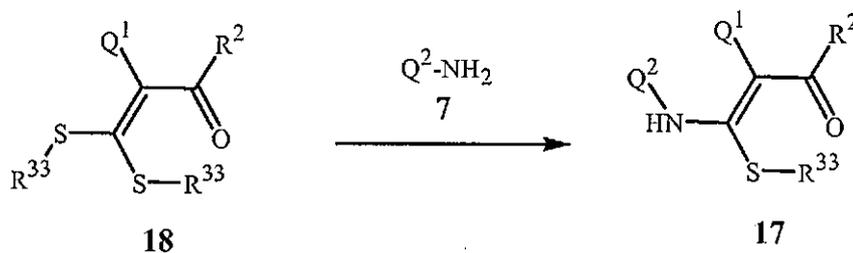
【0257】

スキーム17に示されているとおり、式17の化合物(式中、例えば、 R^2 は、メチル、エチル、または、任意により置換されているシクロプロピルであり、および、 R^{33} はH、または、 CH_3 、 CH_2CH_3 あるいは $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$ などの低級アルキルである)は、式18の対応するケテンジチオアセタール化合物と、式 Q^2-NH_2 の化合物(すなわち、式7)とを、任意により、水素化ナトリウムまたはエチル塩化マグネシウムなどの塩基の存在下に、トルエン、テトラヒドロフランまたはジメトキシメタンなどの溶剤中に、 $-10 \sim$ 溶剤の沸点の範囲の温度で反応させることにより調製されることが可能である。例えば、J. Heterocycl. Chem., 1975, 12(1), 139ページを参照のこと。式18の化合物を調製するために有用な方法は技術分野において公知である。

【0258】

【化31】

スキーム 17



式中、 R^{33} はHまたは低級アルキル(例えば、 CH_3 、 CH_2CH_3 または $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$)

【0259】

スキーム3の方法に従って、2つの R^{33} 基が単一の CH_2 基として一緒になっている(それ故、ジチエタン環を形成する)式18の化合物が化学量論的に過剰量の式15のヒドラジンと反応して、XがSである式1の化合物の調製に有用である式4cの化合物をもたらすこともまた、技術分野において公知である(例えば、Synthesis, 1989年, 398ページを参照のこと)。

【0260】

スキーム18に示されているとおり、式17aの化合物(すなわち、 R^{33} がHである式17の互変異性体)は、式19の対応するイソチオシアネート化合物と、 R^2 がメチル

10

20

30

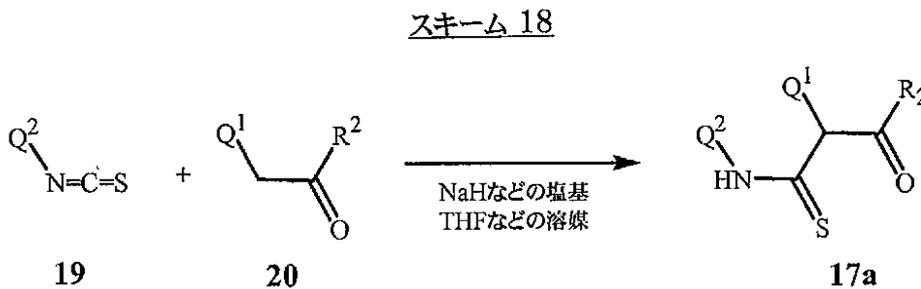
40

50

、エチルまたは任意により置換されているシクロプロピルである式20のアリールアセトン化合物との反応により調製されることが可能である；例えば、*Zhurnal Organicheskoi Khimii*, 1982年, 18(12), 2501ページを参照のこと。この反応に有用な塩基としては、水素化ナトリウム、アルコキシド塩基（例えば、カリウム *t*-ブトキシドまたはナトリウムエトキシド）、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム、または、アミン塩基（例えば、トリエチルアミンまたは *N,N*-ジイソプロピルエチルアミン）が挙げられる。テトラヒドロフラン、エーテル、トルエン、*N,N*-ジメチル-ホルムアミド、アルコール（例えば、エタノール）、エステル（例えば、酢酸エチルまたは酢酸イソプロピル）、またはこれらの混合物などの多様な溶剤が有用である。溶剤は、技術分野において周知であるとおり、選択された塩基との親和性に対して選択される。反応温度は、-78 ~ 溶剤の沸点の範囲であることが可能である。塩基と溶剤との有用な混合物はテトラヒドロフラン中のカリウム *t*-ブトキシドであり、これに、-70 ~ 0 で、式19のイソチオシアネートと式20のカルボニル化合物との混合溶液が添加される。

【0261】

【化32】



【0262】

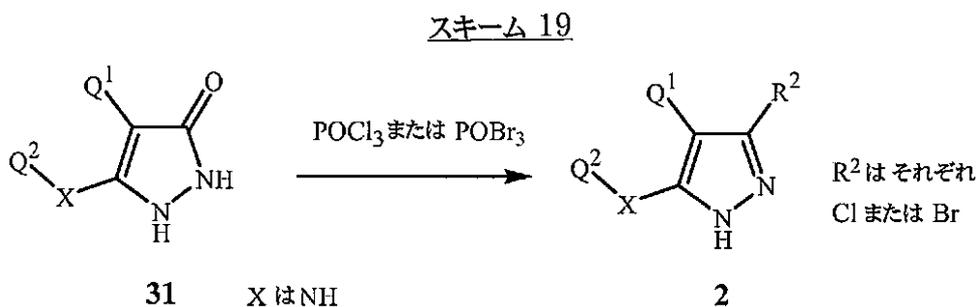
式17のケトチオアミドはまた、対応するケトアミドを、Lawesson試薬または P_2S_5 などの硫化剤と反応させることにより調製されることが可能である；例えば、*Helv. Chim. Act.*, 1998年, 81(7), 1207ページを参照のこと。

【0263】

スキーム2の方法に従った式1の化合物の調製に有用である、XがNHであり、および、 R^2 がClまたはBrである式2の化合物は、式31の対応する化合物と、 $POCl_3$ または $POBr_3$ とを、スキーム19に示されているとおり、技術分野において公知である基本手順を用いて反応させることにより調製されることが可能である。

【0264】

【化33】



【0265】

スキーム20に示されているとおり、式1fの化合物（すなわち、 R^1 および r^{1a} がHであり、および、 R^2 が OCH_3 である式1）は、式31の対応する化合物と、ジアゾメタンまたはヨードメタンとを、塩基の存在下に、*J. Heterocyclic Ch*

10

20

30

40

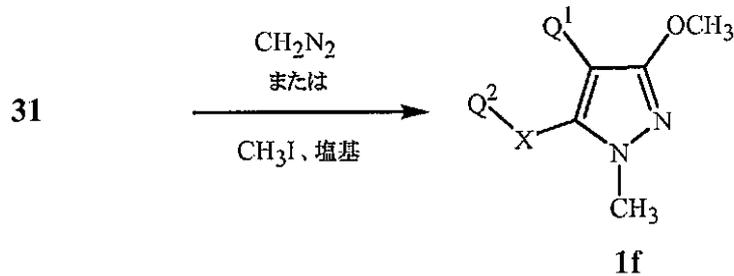
50

em., 1988年, 1307~1310ページに記載のものなどの技術分野において公知である基本手順を用いて反応させることにより調製されることが可能である。

【0266】

【化34】

スキーム 20



10

【0267】

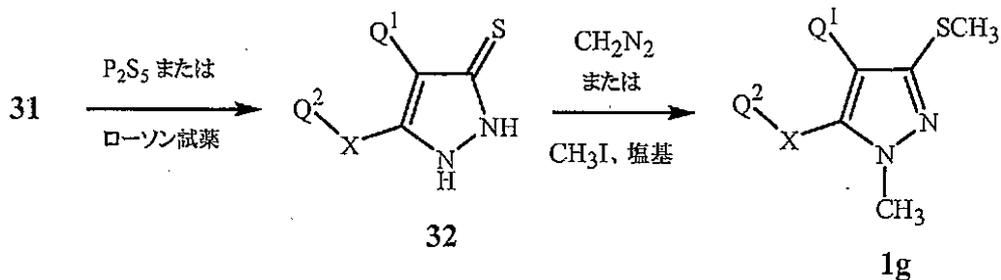
式1gの化合物(すなわち、 R^1 および r^{1a} がHであり、および、 R^2 がSCH₃である式1)は、式31の対応する化合物をP₂S₅またはLawesson試薬で処理して式32の化合物を調製し、次いで、これをジアゾメタンまたはヨードメタンと、塩基の存在下に、スキーム21に示されている技術分野において公知である基本手順を用いて反

20

【0268】

【化35】

スキーム 21



30

【0269】

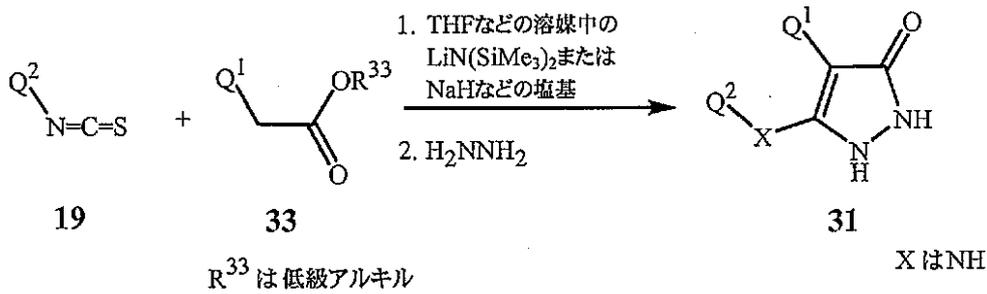
スキーム22に示されているとおり、XがNHである式31の化合物は、式19の対応するイソチオシアネートを、 R^{33} が低級アルキル(例えば、メチル、エチル、プロピル)である式33のエステルと、水素化ナトリウムまたはヘキサメチルジシラザンリチウムなどの非求核性強塩基の存在下に、テトラヒドロフランなどの不活性溶剤(スキーム18の方法と同様に)中に縮合させ、続いて、中間体と、例えば、アセテートもしくは塩酸塩などのヒドラジンの酸塩またはヒドラジンとを反応させること(スキーム16の方法と同様に)により調製されることが可能である。

40

【0270】

【化36】

スキーム 22



10

【0271】

当業者は、スキーム22の方法における未置換ヒドラジンの代わりに式H₂NNHCHR¹R^{1a}の置換ヒドラジンの使用、これに続く、スキーム19、20および21に記載のさらなる操作もまた式1の化合物をもたらすであろうことを認識するであろう。

【0272】

R²がハロゲンである式1cの化合物(すなわち、XがNR⁴であり、および、R⁴がHである式1)はまた、スキーム23に示されているとおり調製されることが可能である。この方法においては、式21のアセトニトリル化合物は、式22のイソチオシアネート化合物と共に、水素化ナトリウムまたはカリウムt-ブトキシドなどの塩基の存在下に、N,N-ジメチルホルムアミドまたはテトラヒドロフランなどの溶剤中に縮合されてシアノケトアミド中間体化合物をもたらし、次いで、これが、塩基の存在下にヨードメタンまたはジメチル硫酸などのメチル化剤と反応されて式23の対応する化合物がもたらされる。あるいは、メチル化剤は、シアノケトアミド中間体を単離することなく、式21および22の化合物と共に反応混合物中に包含させることが可能である。当業者は、式23の化合物はまた、式18の化合物のC(O)R²がシアノにより置き換えられたスキーム17と同様の方法により調製されることが可能であることを認識するであろう。スキーム23の方法によれば、得られる式23の化合物は、次いで、技術分野において公知である基本手順を用いて式15のアルキルヒドラジンと反応されて、式24の対応する3-アミノピラゾール化合物が形成される;例えば、J. Chem. Soc. Perkin 1, 1988年, 2, 169~173ページ、および、J. Med. Chem., 2003年, 46(7), 1229~1241ページを参照のこと。次いで、式24の化合物のアミノ基は、スキーム5について既述のものなどの技術分野において公知である条件を用いるジアゾ化反応により、式1c中のハロゲンであるR²に転化されることが可能である。

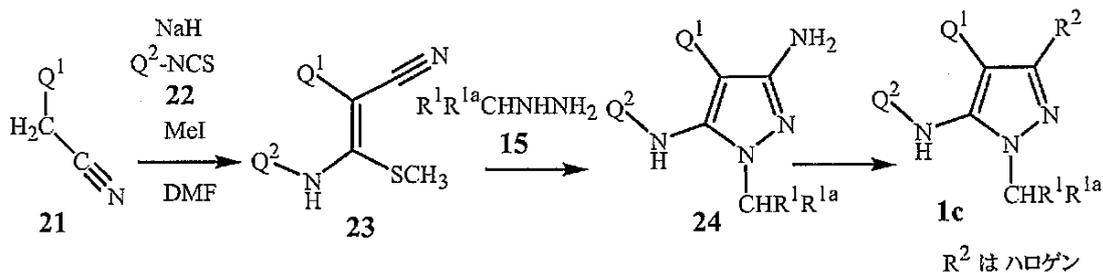
20

30

【0273】

【化37】

スキーム 23



40

【0274】

スキーム23の方法と同様に、XがNHであり、および、R²がハロゲンである式2の化合物は、式23の化合物を、式15のアルキルヒドラジンの代わりにヒドラジンと縮合

50

させることにより、同様に調製されることが可能である。

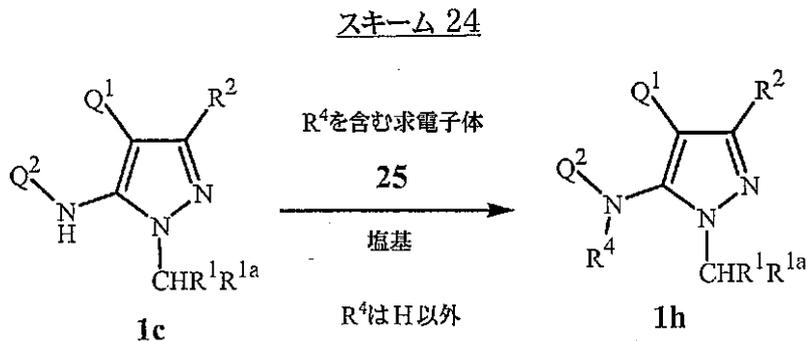
【0275】

スキーム24に示されているとおり、式1hの化合物(すなわち、XがNR⁴である式1)は、式1cの対応する化合物(すなわち、XがNHである式1)と、R⁴を含む求電子剤(すなわち、式25)とを、典型的には、nahなどの塩基、および、N,N-ジメチルホルムアミドなどの極性溶剤の存在下に反応させることにより調製されることが可能である。この文脈において、「R⁴を含む求電子剤」という表記は、R⁴部分を求核剤に移すことが可能である化学化合物を意味する(式1c中のQ²に結合している窒素原子など)。度々、R⁴を含む求電子剤は、式R⁴Lgを有し、式中、Lgは脱離基である(すなわち、求核性反応における脱離基)。典型的な脱離基としては、ハロゲン(例えば、Cl、Br、I)およびスルホン酸塩(例えば、OS(O)₂CH₃、OS(O)₂CF₃、OS(O)₂-(4-CH₃-Ph))が挙げられる。しかしながら、R⁴を含むいくつかの求電子剤は脱離基を含まず;一例は、式1c中のQ²に結合している窒素原子の脱プロトン化(式M⁺H⁻(式中、M⁺はカチオンである)の塩基によるものなど)の後、-SO₃⁻M⁺置換基として窒素原子に結合することが可能である三酸化硫黄(SO₃)である。

10

【0276】

【化38】



20

【0277】

種々の官能基を他のものに変えて異なる式1の化合物をもたらすことが可能であることが当業者によって認識されている。例えば、R²が、メチル、エチルまたはシクロプロピルである式1の化合物は、遊離ラジカルハロゲン化によって変性されて、R²がハロメチル、ハロエチルまたはハロシクロプロピルである式1の化合物を形成することが可能である。ハロメチル化合物は、R²がヒドロキシメチルまたはシアノメチルである式1の化合物を調製するための中間体として用いられることが可能である。式1の化合物またはその調製のための中間体は、芳香族ニトロ基を含有していてもよく、これは、アミノ基に還元されることが可能であり、次いで、Sandmeyer反応などの技術分野において周知である反応を介して種々のハロゲン化物に転化されて、式1の他の化合物をもたらすことが可能である。同様の公知の反応により、芳香族アミン(アニリン)は、ジアゾニウム塩を介して、フェノールに転化されることが可能であり、これは、次いで、アルキル化されてアルコキシ置換基を有する式1の化合物を調製することが可能である。同様に、Sandmeyer反応を介して調製された臭化物またはヨウ化物などの芳香族ハロゲン化物は、Ullmann反応または公知のその変形などの銅触媒条件下でアルコールと反応して、アルコキシ置換基を含有する式1の化合物をもたらすことが可能である。さらに、フッ素または塩素などのいくつかのハロゲン基は、塩基性条件下でアルコールと置き換えられて対応するアルコキシ置換基を含有する式1の化合物をもたらすことが可能である。得られるアルコキシ化合物は、それら自体、R³が-U-V-Tである式1の化合物を調製するさらなる反応に用いられることが可能である(例えば、国際公開第2007/149448A2号パンフレットを参照のこと)。R²またはR³がハロゲン化物である式1の化合物、または、好ましくは臭化物もしくはヨウ化物であるその前駆体は、式1の化合物

30

40

50

を調製するための遷移金属触媒されたクロスカップリング反応に対する特に有用な中間体である。これらの種の反応は、文献中に十分に文書化されている；例えば、Tsuji, *Transition Metal Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis*, John Wiley and Sons, Chichester, 2002年；Tsuji, *Palladium in Organic Synthesis*, Springer, 2005年；ならびに、MiyauraおよびBuchwald, *Cross Coupling Reactions: A Practical Guide*, 2002年；ならびに、その中で引用されている文献を参照のこと。

【0278】

当業者は、スルフィド基は、技術分野において周知である条件によって対応するスルホキシドまたはスルホンにする酸化ことが可能であることを認識するであろう。同様に、Xが $CR^{15}R^{16}$ であり、 R^{15} がHであり、 R^{16} が OR^{18} であり、および、 R^{18} がHである式1の化合物は、技術分野において周知であるアルコール酸化およびケトン還元反応により、XがC(=O)である式1の対応する化合物と容易に相互転化されることが可能である。XがC(=O)である式1の化合物（すなわち、ケトン）は、技術分野において公知である一般的な方法を用いて容易にケタールに転化され、それ故、Xが、 $CR^{15}R^{16}$ であり、ならびに、 R^{15} および R^{16} が一緒になって $-OCH_2CH_2O-$ とされる式1の化合物をもたらすことが可能である。XがC(=O)である式1の化合物はまた、Lawesson試薬の使用により、XがC(=S)である式1の対応する化合物を調製するために転化されることが可能である。しかも、Xが $CR^{15}R^{16}$ であり、 R^{15} が $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、 R^{16} が OR^{18} であり、および、 R^{18} がHである式1の化合物は、アルキルグリニヤール試薬をXがC(=O)である式1の対応する化合物に添加することにより調製されることが可能である。

【0279】

上記の反応はまた、多くの事例においては、スキーム2における反応における使用のための1Hピラゾールの調製などの代替的なシーケンスにおいて、置換ピラゾールの一般的な調製のために以下に例示されている反応により実施されることが可能である。一定の官能基の存在はこれらの反応条件のすべてと適合性ではない可能性があり、および、保護基の使用が、所望の生成物を高い収率および/または純度で得るために望ましい場合がある。

【0280】

式1の化合物の調製について上述されたいくつかの試薬および反応条件は中間体中に存在する一定の官能基とは適合性ではない可能性があることが認識される。これらの事例においては、合成への保護/脱保護シーケンスまたは官能基相互転化の組み込みが、所望の生成物の入手を補助するであろう。保護基の使用および選択は化学合成の当業者には明らかであろう（例えば、Greene, T.W.; Wuts, P.G.M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第2版；Wiley: New York, 1991年を参照のこと）。当業者は、いくつかの場合において、いずれかの個別のスキームにおいて示されているとおり所与の試薬を導入した後、式1の化合物の合成を完了するために、詳細には記載されていない追加のルーチン合成ステップを実施する必要があることを認識するであろう。当業者はまた、上記スキームにおいて例示されているステップの組み合わせを、式1の化合物を調製するために提示された特定のシーケンスにより示唆されるもの以外の順番で実施する必要性があり得ることを認識するであろう。当業者はまた、本明細書に記載の式1の化合物および中間体を、種々の求電子性、求核性、ラジカル、有機金属、酸化、および、還元反応に供して、置換基または既存の置換基を変性させることが可能であることを認識するであろう。

【0281】

さらなる詳細を伴わずに、上記の記載を用いる当業者は、本発明を最大限に利用することが可能であると考えられている。以下の合成例は、従って、単なる例示であって、およ

10

20

30

40

50

び、本開示を如何様にも全く限定しないと解釈されるべきである。以下の合成例におけるステップは、全体的な合成形質転換における各ステップについての手法を例示し、および、各ステップについての出発材料は、必ずしも、手法が他の実施例またはステップにおいて記載されている特定の調製実験によって調製されていなくてもよい。パーセンテージは、クロマトグラフ溶媒混合物、または、他に記載のある場合を除き、重量基準である。クロマトグラフ溶媒混合物に対する部およびパーセンテージは、他に示されていない限りにおいて体積基準である。¹H NMRスペクトルは、特に記載のない限り、CDCl₃中のテトラメチルシランの低磁場側にppmで報告されており；「s」は一重項を意味し、「m」は多重項を意味し、「br s」は幅広の一重項を意味する。質量分析スペクトルは、H⁺（分子量1）の分子への添加により形成され、大気圧化学イオン化（AP⁺）を用いた質量分光測定で観察された、同位体存在度が最も高い親イオン（M+1）の分子量として報告されており、ここで、「amu」は原子質量単位を表す。

10

【実施例】

【0282】

合成例1

N-(3-クロロフェニル)-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン(化合物1)の調製

ステップA: アセチル-2,4-ジフルオロベンゼンアセトニトリル(代替名メチル-シアノ-2,4-ジフルオロベンゼンアセテート)の調製

水素化ナトリウム(鉍物油中に60%)(1.5g, 38mmol)を、キシレン(7mL)中に、窒素雰囲気下に周囲温度で撹拌した。無水エタノール(6.3mL, 64mmol)のキシレン(2mL)中の溶液を、約40℃の温度で約20分間かけて滴下した。反応混合物を70℃に加熱し、2,4-ジフルオロフェニルアセトニトリル(3.9g, 25mmol)、酢酸エチル(3.8mL, 38mmol)およびキシレン(1mL)の溶液を15分間かけて滴下した。追加のキシレン(5mL)を添加して撹拌を助けた。反応混合物を2時間加熱し、次いで、冷却させた。水(50mL)を添加し、混合物をヘキサン(50mL)で抽出した。次いで、水性相を、pH3~4に1N水性HCl溶液で酸性化した。水性相をエーテル(50mL)で抽出し、および、エーテル抽出物を水(25mL)および塩水で洗浄し、次いで、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮して表題の化合物を粘性の残渣(3.3g)として得た。

20

¹H NMR 7.42(m, 1H), 6.8~7.0(m, 2H), 4.95(s, 1H), 2.36(s, 3H)。

30

【0283】

ステップB: 4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミンの調製

酢酸(0.5mL, 8.3mmol)およびメチルヒドラジン(534μL, 10.0mmol)を、ステップA(1.6g, 8.5mmol)において得られた残渣のエチルアルコール(8mL)中の溶液に添加した。次いで、反応混合物を、窒素雰囲気下に還流で16時間加熱した。反応混合物がまだ温かい間に、沈殿物が形成されるまで水を少量づつ(一度に1mL)添加した(合計で約12mLの水)。混合物を再加熱して固形分を溶解させ、次いで、室温に冷却させた。得られた沈殿物をガラスフリットで回収し、2~3mLの50%水性エチルアルコールで洗浄し、および、減圧下で乾燥させて白色の固体(0.99g)として化合物を得た。

40

¹H NMR 7.20(m, 1H), 6.92(m, 2H), 3.68(s, 3H), 3.47(br s, 2H), 2.14(s, 3H)。

【0284】

ステップC: N-(3-クロロフェニル)-4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミンの調製

パラジウム(II)アセテート(90mg, 0.40mmol)、4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9,9-ジメチルキサンテン(460mg, 0.80mmol)お

50

よび炭酸カリウム粉末 (5.5 g、40 mmol) を無水 1,4-ジオキサン (20 mL) 中に組み合わせ、混合物を液面下の N₂ ガス流で 10 分間スパージした。4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン (すなわち、ステップ B の生成物) (0.89 g、4.0 mmol) を一度に添加し、および 1-ブロモ-3-クロロベンゼン (0.47 mL、4.0 mmol) をシリンジを介して添加した。反応混合物を窒素雰囲気下に 3 時間還流で加熱した。追加の 1-ブロモ-3-クロロベンゼン (0.09 mL、0.8 mmol) を添加し、および、1 時間の間加熱を続けた。反応混合物を室温に冷却させ、次いで、水 (40 mL) と酢酸エチル (40 mL) との間に分割した。有機相を追加の水 (40 mL)、塩水 (40 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、減圧下で濃縮した。残渣をヘキサン/酢酸エチル (1:1) で溶離した 10 g のシリカゲルを通した行クロマトグラフィーで精製して、本発明の化合物である表題の化合物を固体 (0.41 g) として得た。

¹H NMR 7.2~7.3 (m, 2H), 7.10 (m, 1H), 6.9~7.0 (m, 2H), 6.70 (m, 1H), 6.58 (m, 1H), 6.52 (m, 1H), 3.64 (s, 3H), 2.14 (s, 3H). MS: 334 amu.

【0285】

合成例 2

4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン (化合物 17) の調製
ステップ A: 5-ブロモ-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾールの調製

臭化銅 (II) (3.94 g、17.7 mmol) を、4-[2-クロロ-4-フルオロフェニル]-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミン (合成例 1 のステップ A および B における 4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミンの調製と同様に調製した) (2.4 g、10 mmol) のアセトニトリル (50 mL) 中の溶液に添加し、混合物を攪拌し、亜硝酸 t-ブチル (90% 工業銘柄、2.33 mL、17.7 mmol) を 5 分間かけて滴下している間に、氷水浴中で冷却した。反応混合物を徐々に周囲温度に温めさせた。水性 HCl 溶液 (20 mL) を添加し、次いで、酢酸エチルを添加した (20 mL)。この混合物を Celite (登録商標) 珪藻土ろ過助剤の 2 cm パッドを通してろ過した。フィルタパッドを酢酸エチル (20 mL) で洗浄し、および相を分離した。有機相を 1.0 N 水性塩酸溶液および塩水で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、濃縮して、表題の化合物をオレンジ-茶色の半固体 (2.8 g) として残留させた。

¹H NMR 7.18~7.25 (m, 2H), 7.04 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 2.14 (s, 3H)。

【0286】

ステップ B: 4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-N-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミンの調製

5-ブロモ-4-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール (すなわち、ステップ A の生成物) (0.20 g、0.66 mmol)、パラジウム (II) アセテート (15 mg、0.066 mmol)、4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9,9-ジメチルキサンテン (76 mg、0.13 mmol) および炭酸カリウム粉末 (1.8 g、13 mmol) を無水 1,4-ジオキサン (3 mL) 中で組み合わせ、混合物を液面下の N₂ ガス流で 10 分間スパージした。2,6-ジフルオロ-4-メトキシアニリン (0.22 g、1.3 mmol) を一度に添加し、および、反応混合物を、還流で 22 時間加熱した。反応混合物を Celite (登録商標) 珪藻土ろ過助剤を通してろ過し、および、フィルタパッドを酢酸エチル (20 mL) で洗浄した。濾液を水 (10 mL) および塩水 (10 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、濃縮して、半固体の残渣を残留させた。この残渣を、ヘキサン/酢酸エチル (20:1~1:3) の勾配で溶離した 5 g のシリカゲルを通した行クロマトグラフィーで精製して、本

10

20

30

40

50

発明の化合物である表題の化合物を明るい茶色固体 (48 mg) として得た。

$^1\text{H NMR}$ 7.0 ~ 7.1 (m, 2H), 6.85 (m, 1H), 6.26 (m, 2H), 4.84 (br s, 1H), 3.78 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 2.08 (s, 3H). MS: 382 amu.

【0287】

合成例3

4-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1,3-ジメチル-N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-1H-ピラゾール-5-アミン(化合物24)の調製
ステップA: 2,6-ジフルオロ-4-メトキシベンゼンアセトニトリルの調製

水(2 mL)中に溶解させたKCN(0.88 g、13 mmol)の溶液を、2,6-ジフルオロ-4-メトキシ臭化ベンジル(2.50 g、10.5 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド(10 mL)中の水浴で冷却した溶液に滴下した。反応混合物を20分間攪拌した。水を添加し(20 mL)、次いで、反応混合物を飽和水性NaHCO₃溶液(20 mL)中に注ぎ入れ、および、エーテル(50 mL)で抽出した。有機相を水(5 × 25 mL)で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮して油を得、これを静置して結晶化させて、表題の化合物を白色の固体(1.9 g)として得た。

$^1\text{H NMR}$ 6.50 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.65 (s, 2H)

。

【0288】

ステップB: -アセチル-2,6-ジフルオロ-4-メトキシベンゼンアセトニトリルの調製

固体ナトリウムエトキシド(4.7 g、66 mmol)をキシレン(20 mL)とエタノール(10 mL)との混合物中で攪拌し、および、50 に加熱した。2,6-ジフルオロ-4-メトキシベンゼン-アセトニトリル(すなわち、ステップAの生成物)(8.0 g、44 mmol)の酢酸エチル(10.4 mL)中の溶液を滴下した。反応混合物を50 で4時間加熱し、次いで、周囲温度に冷却させた。反応混合物を水(100 mL)に注ぎ入れ、および、酢酸エチル(25 mL)で抽出した。水性相を3N水性HClでpH4に酸性化し、酢酸エチル(100 mL)で抽出した。この有機相を水(50 mL)、塩水(50 mL)で洗浄し、次いで、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮して、表題の化合物を褐色の半固体(8.0 g)として残留させた。

$^1\text{H NMR}$ 6.56 (m, 2H), 4.86 (s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.40 (s, 3H)。

【0289】

ステップC: 4-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-アミンの調製

-アセチル-2,6-ジフルオロ-4-メトキシベンゼンアセトニトリル(すなわち、ステップBの生成物)(8.03 g、35.7 mmol)および酢酸(5 mL)をエタノール(35 mL)中で攪拌し、メチルヒドラジン(1.91 mL、35.7 mmol)を添加した。反応混合物を、還流で16時間加熱し、冷却し、次いで、水(100 mL)中に注ぎ入れた。得られた混合物を酢酸エチル(100 mL)で抽出した。有機相を1N水性NaOH(50 mL)、次いで、塩水(50 mL)で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮して、固体を残留させた。固体をメタノール中に溶解させ、得られた溶液を45 に温めた。水(25 mL)を滴下し、混合物を冷却させた。沈殿物をガラスフリットに回収して、表題の化合物を白色の固体(3.88 g)として得た。

$^1\text{H NMR}$ 6.55 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.43 (br s, 2H), 2.09 (s, 3H)。

【0290】

ステップD: 5-ブロモ-4-(2,6-ジフルオロ-4-メトキシフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾールの調製

臭化銅(II)(3.81 g、16.9 mmol)を4-(2,6-ジフルオロ-4-

10

20

30

40

50

メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール (すなわち、ステップ C の生成物) (3.88 g、15.4 mmol) のアセトニトリル (50 mL) 中の溶液に添加し、混合物を攪拌し、および、亜硝酸 t - ブチル (90% 工業銘柄、3.54 mL、26.9 mmol) を 5 分間かけて滴下している間、氷水浴中で冷却した。反応混合物を徐々に周囲温度に温めさせた。水性塩酸溶液 (25 mL) を添加し、次いで、酢酸エチル (25 mL) を添加し、および、得られた混合物を Celite (登録商標) 珪藻土ろ過助剤の 2 cm パッドを通してろ過した。フィルタパッドを酢酸エチル (50 mL) で洗浄し、相を分離した。有機相を 1 N 水性 HCl 溶液 (25 mL) および塩水 (25 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、濃縮した。残渣を、ヘキサン / 酢酸エチル (9 : 1 ~ 1 : 1) の勾配で溶離した 24 g のシリカゲルを通した行クロマトグラフィーで精製して、表題の化合物を白色の固体 (3.25 g) として得た。

10

¹H NMR (CDCl₃) 6.54 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)。

【0291】

ステップ E : 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - N - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - アミンの調製
5 - ブロモ - 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール (すなわち、ステップ D の生成物) (0.30 g、0.94 mmol)、パラジウム (II) アセテート (20 mg、0.090 mmol)、4, 5 - ビス (ジフェニルホスフィノ) - 9, 9 - ジメチルキサンテン (0.11 g、0.19 mmol) および炭酸カリウム粉末 (2.6 g、19 mmol) を、無水 1, 4 - ジオキサン (4 mL) 中で組み合わせ、得られた混合物を液面下の N₂ ガス流で 10 分間スパーズした。2, 4, 6 - トリフルオロアニリン (0.28 g、1.9 mmol) を一度に添加し、反応混合物を窒素下で 22 時間還流で加熱した。反応混合物を冷却し、次いで、Celite (登録商標) 珪藻土ろ過助剤を通してろ過した。フィルタパッドを酢酸エチル (20 mL) で洗浄し、および、濾液を水 (10 mL) および塩水 (10 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、濃縮して、半固体の残渣を残留させた。残渣をヘキサン / 酢酸エチル (20 : 1 ~ 1 : 3) の勾配で溶離した 12 g のシリカゲルを通した行クロマトグラフィーで精製して、本発明の化合物である表題の化合物を半固体 (73 mg) として得た。

20

30

¹H NMR (アセトン - d₆) 6.84 (br s, 1H), 6.68 (m, 2H), 6.43 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 1.99 (s, 3H)。MS : 384 amu (AP⁺)。

【0292】

合成例 4

4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] オキシ] - 3, 5 - ジフルオロベンゾニトリル (化合物 45) の調製
ステップ A : 4 - [(1, 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) オキシ] - 3, 5 - ジフルオロベンゾニトリルの調製

炭酸カリウム (1.38 g、10 mmol) を、2, 4 - ジヒドロ - 2, 5 - ジメチル - 3 H - ピラゾール - 3 - オン (0.70 g、6.3 mmol) の N, N - ジメチルホルムアミド (15 mL) 中の溶液に添加した。3, 4, 5 - トリフルオロベンゾニトリル (0.94 g、6.0 mmol) を添加し、反応混合物を 75 °C で、窒素雰囲気下に 16 時間加熱し、次いで、冷却させた。反応混合物を、水 (60 mL) と酢酸エチル (30 mL) との間に分割した。有機相を水 (2 × 30 mL) および塩水 (30 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、濃縮して、表題の化合物を黄色の油 (1.38 g) として得た。

40

¹H NMR (CDCl₃) 7.36 (m, 2H), 5.24 (s, 1H), 3.78 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)。

【0293】

50

ステップB：3，5 - ジフルオロ - 4 - [(4 - ヨード - 1 ， 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) オキシ] ベンゾニトリルの調製

4 - [(1 ， 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) オキシ] - 3 ， 5 - ジフルオロベンゾニトリル (すなわち、ステップAの生成物) (1 . 3 8 g 、 5 . 5 m m o l) のアセトニトリル (2 0 m L) 中の溶液を周囲温度で攪拌し、および、N - ヨードスクシンイミド (1 . 3 5 g 、 6 . 0 m m o l) を一度に添加した。反応混合物を還流で2時間加熱し、冷却し、次いで、水 (4 0 m L) 中に注いだ。得られた混合物を酢酸エチル (4 0 m L) で抽出した。有機相を水 (2 0 m L) および飽和水性NaHCO₃溶液 (2 0 m L) で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、および、減圧下で濃縮して表題の化合物を褐色の固体 (2 . 1 g) として得た。

¹H NMR (アセトン - d₆) 7 . 8 0 (m , 2 H) , 3 . 8 2 (s , 3 H) , 2 . 0 9 (s , 3 H) . MS : 3 7 6 a m u (A P ⁺) .

【 0 2 9 4 】

ステップC：4 - [[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 ， 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] オキシ] - 3 ， 5 - ジフルオロベンゾニトリルの調製

3 ， 5 - ジフルオロ - 4 - [(4 - ヨード - 1 ， 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) オキシ] - ベンゾニトリル (すなわち、ステップBの生成物) (1 . 0 g 、 2 . 6 7 m m o l) の1 ， 4 - ジオキサン (6 m L) 中の溶液に、2 - クロロ - 4 - フルオロベンゼンボロン酸 (代替名B - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - ボロン酸) (0 . 9 3 g 、 5 . 3 3 m m o l) 、ジクロロ (ビス) トリフェニルホスフィンパラジウム (I I) (代替名ビス (トリフェニルホスフィン)) パラジウム (I I) ジクロリド (9 3 m g 、 0 . 1 3 m m o l) 、炭酸カリウム (0 . 7 4 g 、 5 . 3 3 m m o l) 、および水 (4 m L) を添加した。得られた混合物を、還流で5時間加熱し、冷却させ、および、水 (2 0 m L) と酢酸エチル (2 0 m L) との間に分割した。有機層をMgSO₄で乾燥させ、および、濃縮した。残渣をヘキサン / 酢酸エチルの勾配を伴うシリカゲルでのクロマトグラフィにより精製して、本発明の化合物である表題の化合物をオフホワイトの固体 (1 1 0 m g) として得た。

¹H NMR 7 . 0 0 ~ 7 . 0 9 (m , 3 H) , 6 . 9 7 (m , 1 H) , 6 . 8 6 (m , 1 H) , 3 . 8 5 (s , 3 H) , 2 . 0 2 (s , 3 H) .

【 0 2 9 5 】

合成例5

4 - (2 ， 4 - ジクロロフェニル) - N - (2 ， 4 - ジフルオロフェニル) - 1 ， 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン (化合物69) の調製

ステップA： - アセチル - 2 ， 4 - ジクロロ - N - (2 ， 4 - ジフルオロフェニル) ベンゼン - エタンチオアミドの調製

2 ， 4 - ジフルオロフェニルイソチオシアネート (0 . 2 7 m L 、 2 . 0 m m o l) を、水素化ナトリウム (鉍物油中に60%) (1 1 2 m g 、 2 . 8 m m o l) の、窒素雰囲気下で氷水浴中で冷却した無水テトラヒドロフラン (4 m L) 中の攪拌懸濁液に添加した。(2 ， 4 - ジクロロフェニル) - 2 - プロパノン (5 7 0 m g 、 2 . 8 m m o l) のテトラヒドロフラン (4 m L) 中の溶液を5分間かけて滴下した。得られた黄色の溶液を5 ~ 1 0 で1時間攪拌した。水 (1 0 m L) を注意深く添加し、反応混合物を酢酸エチル (1 0 m L) で抽出した。水性相をpH3に1N水性HClで酸性化し、次いで、酢酸エチル (2 0 m L) で抽出した。有機抽出物を水 (1 0 m L) および塩水 (1 0 m L) で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮して固体を残留させた。固体をヘキサン / 酢酸エチル (2 : 1) で倍散させ、ガラスフリットで回収し、および、空気乾燥させて、表題の化合物を白色の固体 (2 4 0 m g) として得た。MS : 3 7 3 a m u (A P ⁺) .

【 0 2 9 6 】

ステップB：4 - (2 ， 4 - ジクロロフェニル) - N - (2 ， 4 - ジフルオロフェニル) - 1 ， 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミンの調製

酢酸 (5 0 μ L) およびメチルヒドラジン (4 1 μ L) を、 - アセチル - 2 ， 4 - ジ

10

20

30

40

50

クロロ - N - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) ベンゼンエタンチオアミド (238 mg、0.64 mmol) のエタノール (4 mL) 中の攪拌懸濁液に添加した。反応混合物を、還流で2時間加熱し、および、冷却させた。次いで、反応混合物を酢酸エチル (10 mL) で希釈し、および、1 N 水性 NaOH (10 mL)、水 (10 mL) および塩水 (10 mL) で洗浄し、MgSO₄ で乾燥させ、および、濃縮して固体残渣を残留させた。残渣をヘキサン/酢酸エチル (2 : 1 ~ 1 : 1) の勾配が伴う5gのシリカゲルでの行クロマトグラフィーで精製して、表題の化合物を固体 (170 mg) として得た。

¹H NMR 7.43 (s , 1H) , 7.19 (m , 1H) , 7.07 (m , 1H) , 6.78 (m , 1H) , 6.62 (m , 1H) , 6.37 (m , 1H) , 5.22 (br s , 1H) , 3.70 (s , 3H) , 2.18 (s , 3H) . MS : 368 amu (AP⁺) .

【0297】

合成例6

4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (化合物 351) の調製

5 - ブロモ - 4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール (すなわち、合成例2の生成物、ステップA) (0.25 g、0.82 mmol) を無水テトラヒドロフラン (12 mL) 中に溶解させ、および、混合物を、窒素雰囲気下でドライアイス/アセトン浴中に冷却した。n - ブチルリチウム (2.0 M、0.49 mL、0.98 mmol) のシクロヘキサン溶液を5分間かけて滴下した。15分間の後、2 , 4 - ジフルオロベンズアルデヒド (0.09 mL、0.82 mmol) の無水テトラヒドロフラン (3 mL) 中の溶液をゆっくりと滴下して、濃い赤色の溶液を黄色に明るくさせた。45分間の後、反応混合物を飽和水性 NH₄Cl 溶液 (約 20 mL) の添加により急冷し、および、周囲温度に温めさせた。この混合物を酢酸エチルで抽出し、有機相を飽和水性 NH₄Cl 溶液 (25 mL) および塩水で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、および、濃縮して粘性の残渣を残留させた。この残渣を、ヘキサン中の酢酸エチル (7% ~ 10%) の勾配で溶離されるシリカゲルを通した行クロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題の生成物を、白色の半固体 (109 mg) として得た。

¹H NMR 7.5 (m , 1H) , 7.1 (m , 2H) , 7.0 (m , 1H) , 6.85 (m , 2H) , 6.0 (br s , 1H) , 5.9 (s , 1H) , 3.8 (s , 3H) , 2.1 (s , 3H) . MS : 367 amu (AP⁺) .

【0298】

合成例7

[4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] (2 , 4 - ジフルオロフェニル) メタノン (化合物 370) の調製

4 - (2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル) - - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - メタノール (すなわち、合成例6の生成物) (90 mg、0.25 mmol) をジクロロメタン (8 mL) 中に溶解させ、および、ピリジニウムジクロメート (113 mg、0.3 mmol) を一度に添加した。反応混合物を周囲温度で16時間攪拌し、次いで、反応混合物を、水 (5 mL) とジクロロメタン (5 mL) との間に分割した。有機相を追加の水 (5 mL) および塩水 (5 mL) で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、および、減圧下で濃縮して、粘性の残渣を得た。この残渣をヘキサン中の酢酸エチル (25% ~ 30%) の勾配で溶離したシリカゲルを通した行クロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題の生成物を、うすい黄色の粘性の油 (29 mg) として得た。

¹H NMR 7.94 (m , 1H) , 7.32 (s , 1H) , 7.27 (m , 1H) , 7.03 (m , 1H) , 6.95 (m , 1H) , 6.78 (m , 1H) , 3.82 (s , 3H) , 2.13 (s , 3H) . MS : 365 amu (AP⁺) .

【0299】

合成例8

10

20

30

40

50

5 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 - ニトロフェノキシ) - 1 , 3 - ジメチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール (化合物 5 4) の調製

ステップ A : メチル 2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゼンアセテートの調製

2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゼン酢酸 (5 . 0 0 g , 2 6 . 3 m m o l) のメタノール (2 5 m L) 中の溶液を周囲温度で攪拌し、塩化チオニル (6 m L 、 約 3 当量) を滴下して、反応混合物の温度を 6 0 に到達させた。反応混合物を周囲温度に冷却させ、および、3 時間攪拌した。水 (2 5 m L) を氷で冷却しながら添加した。混合物を酢酸エチル (2 × 1 0 0 m L) で抽出した。組み合わせた有機相を水 (2 ×) 、飽和水性重炭酸ナトリウム溶液、および、塩水で洗浄し、M g S O ₄ で乾燥させた。濃縮物は、表題の生成物を清透な油 (5 . 3 8 g) としてもたらした。

¹ H N M R 6 . 6 8 (m , 2 H) , 3 . 7 2 (s , 3 H) , 3 . 6 6 (s , 2 H)

【 0 3 0 0 】

ステップ B : メチル - アセチル - 2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゼンアセテートの調製

窒素雰囲気下で攪拌し、および、- 6 5 の内部温度に冷却した、市販されていたリチウムビス (トリメチル - シリル) アミドのテトラヒドロフラン溶液 (1 . 0 M 、 2 1 . 0 m L) に、乾燥テトラヒドロフラン (1 0 m L) 中に溶解させたメチル 2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゼンアセテート (すなわち、ステップ A の生成物) (2 . 0 4 g , 1 0 . 0 m m o l) の溶液を 3 0 分間かけて滴下した。反応混合物をさらに 3 0 分間攪拌し、次いで、- 6 5 の温度を維持しつつ、新たに蒸留した乾燥テトラヒドロフラン (3 m L) 中の塩化アセチル (0 . 8 0 m L 、 1 1 m m o l) の溶液を滴下した。反応混合物を徐々に周囲温度に温めさせ、次いで、水 (3 0 m L) を添加した。得られた混合物を酢酸エチル (6 0 m L) で抽出した。水性相を 1 N 塩酸で酸性化し、および、酢酸エチル (6 0 m L) で抽出した。薄層クロマトグラフィ分析で、第 2 の抽出物は明らかに極性の不純物を追加の所望の生成物と共に含有していることが示されたため、最初の抽出物のみを保持した。初期の有機相を 1 N 塩酸、水および塩水でさらに洗浄し、M g S O ₄ で乾燥させ、および、濃縮して、表題の生成物を清透な油 (1 . 8 6 g) として得た。

¹ H N M R 6 . 6 9 (m , 2 H) , 3 . 7 (m , 1 H a n d s , 3 H) , 1 . 8 7 (s , 3 H) ; 1 3 . 2 p p m および 4 . 9 p p m での軽微な共鳴が、エノール互変異性体の存在を示していた。

【 0 3 0 1 】

ステップ C : 1 , 3 - ジメチル - 4 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) - 1 H - ピラゾール - 5 - オルの調製

メチル - アセチル - 2 , 4 , 6 - トリフルオロベンゼンアセテート (すなわち、ステップ B の生成物) (2 . 4 6 g , 1 0 . 0 m m o l) のメタノール (1 5 m L) 中の溶液に、メチルヒドラジン (0 . 6 6 5 m L , 1 2 . 5 m m o l) を添加し、混合物を周囲温度で 3 日間にわたって攪拌した。水性クエン酸溶液 (1 M 、 1 0 m L) を添加し、次いで、水 (5 0 m L) を添加した。混合物を酢酸エチル (2 × 5 0 m L) で抽出した。組み合わせた有機抽出物を水および塩水で洗浄し、M g S O ₄ で乾燥させ、および、濃縮して、黄色の固体を残留させた。この固体を少量の酢酸エチル (約 5 m L) 中に懸濁させ、当量のヘキサンを徐々に添加し、および、懸濁液を 3 0 分間攪拌した。固体成分をガラスフリットに回収し、少量の酢酸エチル / ヘキサン (1 : 1 および 1 : 2 v : v) で洗浄し、および、空気中で乾燥させて白色の固体 (1 . 0 2 g) を得た。既述のとおり、母液の蒸発、ならびに、少量の酢酸エチルおよびヘキサンでの得られた残渣の処理で、表題の生成物 (合計で 1 . 1 5 g) を含有するさらに 0 . 1 3 g の固体を得た。L C / M S による組み合わせた固形分の分析は、質量 2 4 2 (A P +) の主成分と、同様に 2 4 2 (A P +) の質量を有する、逆相 L C により後に溶離される微量成分を示した。成分の見かけ上の比は 9 4 : 6 であった。

¹ H N M R (アセトン - d ₆) 6 . 9 5 (m , 2 H) , 3 . 5 2 (s , 3 H) , 1 . 9 8 (s , 3 H) ; 5 - ヒドロキシ共鳴はこの溶剤中では観察されなかった。

【0302】

ステップD：5 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - ニトロフェノキシ) - 1, 3 - ジメチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1H - ピラゾールの調製

1, 3 - ジメチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 5 - オル (すなわち、ステップCの生成物) (0.310 g、1.28 mmol) を、3, 4, 5 - トリフルオロニトロベンゼン (157 μ L、1.35 mmol) および炭酸カリウム粉末 (0.27 g、2 mmol) と、乾燥N, N - ジメチルホルムアミド (4 mL) 中に組み合わせた。この混合物を攪拌し、80 で45分間加熱し、次いで、冷却させた。反応混合物を水 (10 mL) で希釈し、酢酸エチル (2 x 10 mL) で抽出した。有機相を水および塩水で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮して、粘性の残渣を残留させた。この残渣をヘキサン中の酢酸エチル (30% ~ 100%) の勾配で溶離したシリカゲルを通した行クロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題の生成物をオフホワイトの固体 (209 mg) として得た。

¹H NMR 7.71 (m, 2H), 6.54 (m, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.07 (s, 3H); 400 amu (AP+).

【0303】

合成例9

4 - [[1, 3 - ジメチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 5 - イル] オキシ] - 3, 5 - ジフルオロベンゼンアミン (化合物371) の調製

5 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - ニトロフェノキシ) - 1, 3 - ジメチル - 4 - (2, 4, 6 - トリフルオロフェニル) - 1H - ピラゾール (すなわち、合成例8の生成物) (0.780 g、1.95 mmol) を、鉄粉末 (325メッシュ、0.58 g、10 mmol) および塩化アンモニウム (64 mg、1.2 mmol) と、水 (3 mL) を添加したエタノール (27 mL) 中で組み合わせた。混合物を1.25時間還流で加熱し、次いで、冷却させた。反応混合物を当量の酢酸エチルで希釈し、Celite[®]を通過してろ過した。濾液をMgSO₄で乾燥させ、濃縮した。LC/MSによる分析は、主成分 (93%) が370 amu (AP+) の質量を有していることを示した。残渣を無水ジメチルスルホキシド (8 mL) 中に溶解させ、および、市販されているナトリウムメトキシドのメタノール (0.45 mLの25%溶液) 中の溶液を添加した。この溶液を窒素下で攪拌し、還流で1時間加熱した。追加のナトリウムメトキシド/メタノール溶液 (0.20 mL) を添加し、および、追加の30分間の間加熱を継続した。反応混合物を冷却させ、次いで、これを水性クエン酸溶液 (1M、5 mL) で処理し、水 (50 mL) で希釈し、および、酢酸エチル (2 x 25 mL) で抽出した。有機相を水 (3 x) および塩水で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、濃縮して、本発明の化合物である表題の生成物を、粘性の油 (0.52 g) として残留させた。

¹H NMR 6.29 (m, 2H), 5.95 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.55 ~ 3.75 (br s, NH₂), 2.01 (s, 3H); 382 amu (AP+).

【0304】

合成例10

5 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジフルオロフェノキシ) - 4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール (化合物58) の調製

塩化銅 (I) (56 mg、0.42 mmol) を、4 - [[4 - (2, 6 - ジフルオロ - 4 - メトキシフェニル) - 1, 3 - ジメチル - 1H - ピラゾール - 5 - イル] オキシ] - 3, 5 - ジフルオロベンゼンアミン (合成例9と同様に調製した) (132 mg、0.346 mmol) のアセトニトリル (5 mL) 中の溶液に添加した。攪拌した混合物を氷水浴を用いて冷却し、亜硝酸t - プチル (90%工業銘柄、72 μ L) を滴下した。反応混合物を徐々に周囲温度に温めさせ、室温で一晩攪拌し、次いで、これを、還流で1時間加熱した。塩酸 (1N、5 mL) を添加し、混合物を酢酸エチル (約20 mL) で抽出した。有機相を塩水で洗浄し、MgSO₄で乾燥させ、および、濃縮した。残渣をヘキサン

10

20

30

40

50

中の 20% 酢酸エチルで溶離したシリカゲルを通した行クロマトグラフィーにより精製して、本発明の化合物である表題の生成物を、粘性の油 (45 mg) として得た。

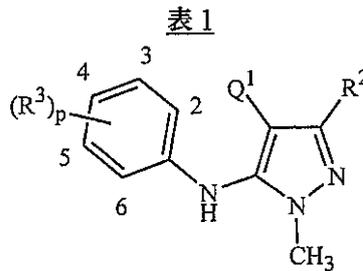
$^1\text{H NMR}$ 6.74 (m, 2H), 6.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 2.03 (s, 3H); 401 amu (AP+).

【0305】

技術分野において公知である方法を伴う本明細書に記載の手法により、以下の表中に開示されている化合物を調製することが可能である。以下の略語が以下の表中に用いられている：Me はメチルを意味し、Et はエチルを意味し、n-Pr は n-プロピルを意味し、c-Pr はシクロプロピルを意味し、Ph はフェニルを意味し、OMe (または MeO) はメトキシを意味し、OEt (または EtO) はエトキシを意味し、-CN はシアノを意味し、および -NO₂ はニトロを意味する。

【0306】

【表1】



Q¹ は 2,6-ジ-F-Ph であり R² は Me

| (R ³) _p |
|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| 2-F | 3-F | 4-F | 2-Cl | 3-Cl |
| 4-Cl | 2-Br | 3-Br | 4-Br | 2,4-ジ-F |
| 2,6-ジ-F | 2,4,6-トリ-F | 2,4,5-トリ-F | 2,3,5-トリ-F | 2,3,6-トリ-F |
| 2-Cl-4-F | 2-F-4-Cl | 2,4-ジ-Cl | 2,6-ジ-Cl | 2,4,6-トリ-Cl |
| 2-Br-4-F | 2-I-4-F | 2-Me-4-F | 2-F-4-MeO | 2-Cl-4-MeO |
| 2-Br-4-MeO | 2,6-ジ-F-4-MeO | 2-F-4-CN | 2-Cl-4-CN | 2-Br-4-CN |
| 2,6-ジ-F-4-CN | 2-Cl-4,5-ジ-F | 2-Cl-4,6-ジ-F | 2-Br-4,5-ジ-F | 2-Br-4,6-ジ-F |
| 4-Cl-2,5-ジ-F | 4-Cl-2,6-ジ-F | 4-Br-2,5-ジ-F | 4-Br-2,6-ジ-F | 2,4-ジ-Cl-6-F |
| 2,6-ジ-Cl-4-F | 2,6-ジ-Cl-4-MeO | 2-CF ₃ -4-F | 4-Me | 2,4-ジ-Me |
| 2-F-4-Br | 2-Cl-4-Br | 2-Br-4-Cl | 2-Br-4-F-6-Cl | 2-Cl-4-Br-6-F |

【0307】

本開示は表 2 ~ 84 をも含み、これらの各々は、表 1 中の行表題 (すなわち、「Q¹ は 2, 6-ジ-F-Ph であり、および、R² は Me である。») が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表 1 と同じく構成されている。例えば、表 2 において、行表題は「Q¹ は 2, 6-ジ-F-Ph であり、および、R² は Cl である。」であり、および、(R³)_p は上記の表 1 において定義されているとおりである。それ故、表 2 中の最初の記載事項は、2-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-アミンを特定的に開示する。表 3 ~ 84 も同様に構成されている。

【0308】

【表 2】

表	行表題	表	行表題
2	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありR ² はCl	47	Q ¹ は2-Br-PhでありR ² はCl
3	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありR ² はBr	48	Q ¹ は2-Br-PhでありR ² はBr
4	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ² はMe	49	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ² はMe
5	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ² はCl	50	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ² はCl
6	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ² はBr	51	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ² はBr
7	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ² はMe	52	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ² はMe
8	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ² はCl	53	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ² はCl
9	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ² はBr	54	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ² はBr
10	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ² はMe	55	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ² はMe
11	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ² はCl	56	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ² はCl
12	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ² はBr	57	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ² はBr
12A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ² はMe	58	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ² はMe
12B	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ² はCl	59	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ² はCl
12C	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ² はBr	60	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ² はBr
13	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ² はMe	60A	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ² はMe
14	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ² はCl	60B	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ² はCl
15	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ² はBr	60C	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ² はBr
16	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ² はMe	61	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ² はMe
17	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ² はCl	62	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ² はCl
18	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ² はBr	63	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ² はBr
19	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ² はMe	63A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ² はMe
20	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ² はCl	63B	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ² はCl
21	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ² はBr	63C	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ² はBr

【 0 3 0 9 】

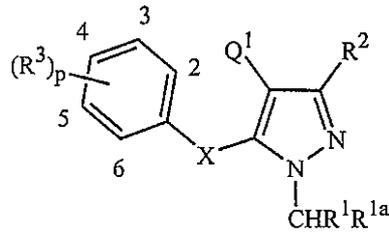
【表3】

表	行表題	表	行表題
22	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ² はMe	64	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ² はMe
23	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ² はCl	65	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ² はCl
24	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ² はBr	66	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ² はBr
25	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ² はMe	66A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ² はMe
26	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ² はCl	66B	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ² はCl
27	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ² はBr	66C	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ² はBr
28	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ² はMe	67	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ² はMe
29	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ² はCl	68	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ² はCl
30	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ² はBr	69	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ² はBr
31	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ² はMe	70	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ² はMe
32	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ² はCl	71	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ² はCl
33	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ² はBr	72	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ² はBr
34	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ² はMe	73	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ² はMe
35	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ² はCl	74	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ² はCl
36	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ² はBr	75	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ² はBr
37	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ² はMe	76	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ² はMe
38	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ² はCl	77	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ² はCl
39	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ² はBr	78	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ² はBr
40	Q ¹ は2-F-PhでありR ² はMe	79	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ² はMe
41	Q ¹ は2-F-PhでありR ² はCl	80	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ² はCl
42	Q ¹ は2-F-PhでありR ² はBr	81	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ² はBr
43	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ² はMe	82	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ² はMe
44	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ² はCl	83	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ² はCl
45	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ² はBr	84	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ² はBr
46	Q ¹ は2-Br-PhでありR ² はMe		

【0310】

【表4】

表85



Q¹は2,6-ジ-F-Ph, XはO, R¹およびR^{1a}は共にHでありR²はMe

| (R ³) _p |
|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| 4-F | 4-Cl | 4-Br | 2,4-ジ-F | 2-Br-4-F |
| 2,6-ジ-F | 2,4-ジ-Cl | 2,6-ジ-Cl | 2-Cl-4-F | 2-F-4-Cl |
| 2-F-4-Br | 2-Br-6-F | 2-Cl-4-Br | 2-Br-4-Cl | 2-I-4-F |
| 2-F-4-I | 2-Cl-4,6-ジ-F | 4-Cl-2,6-ジ-F | 2-Br-4,6-ジ-F | 4-Br-2,6-ジ-F |
| 2-F-4-MeO | 2-Cl-4-MeO | 2,6-ジ-F-4-MeO | 2-F-4-CN | 2-Cl-4-CN |
| 2-Br-4-CN | 2,6-ジ-F-4-CN | 2-F-4-NO ₂ | 2-Cl-4-NO ₂ | 2-Br-4-NO ₂ |
| 2,5-ジ-F-4-CN | 4-Cl-2,5-ジ-F | 2-Br-4,5-ジ-F | 4-Br-2,5-ジ-F | 2-Cl-4,5-ジ-F |

10

20

【0311】

本開示は表86～280をも含み、これらの各々は、表85中の行表題（すなわち、「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、XはOであり、R¹およびR^{1a}は共にHであり、および、R²はMeである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表85と同じく構成されている。例えば、表86において、行表題は、「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、XはOであり、R¹およびR^{1a}は共にHであり、および、R²はClである。」であり、および、(R³)_pは上記の表85において定義されているとおりである。それ故、表86中の最初の記載事項は、3-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-(4-フルオロフェノキシ)-1-メチル-1

30

【0312】

【表5】

表	行表題	
86	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
87	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
88	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
89	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
90	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
91	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	10
92	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
93	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
94	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
95	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
96	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
96A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
96B	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
96C	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
97	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	20
98	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
99	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
100	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
101	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
102	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
103	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
104	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
105	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	30
106	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
107	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	

【0313】

【表6】

表	行表題	
108	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
109	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
110	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
111	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
112	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
113	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	10
114	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
115	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
116	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
117	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
118	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
119	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
120	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
121	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
122	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	20
123	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
124	Q ¹ は2-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
125	Q ¹ は2-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
126	Q ¹ は2-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
127	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
128	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
129	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
130	Q ¹ は2-Br-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
131	Q ¹ は2-Br-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	30
132	Q ¹ は2-Br-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
133	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
134	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
135	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
136	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
137	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
138	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
139	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	40
140	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
141	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
142	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
143	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
144	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	

【表 7】

表	行表題	
144A	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
144B	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
144C	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
145	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
146	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
147	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	10
147A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
147B	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
147C	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
148	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
149	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
150	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
150A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
150B	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	20
150C	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
151	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
152	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
153	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
154	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
155	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
156	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
157	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
158	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	30
159	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
160	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
161	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
162	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
163	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
164	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
165	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
166	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	40
167	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
168	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
169	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
170	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
171	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
172	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	

【表 8】

表	行表題	
173	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
174	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
175	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
176	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
177	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
178	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	10
179	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
180	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
180A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
180B	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
180C	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
181	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
182	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
183	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	20
184	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
185	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
186	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
187	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
188	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
189	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
190	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
191	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
192	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	30
193	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
194	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
195	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
196	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
197	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
198	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
199	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
200	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
201	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	40
202	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
203	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
204	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
205	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
206	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	

【表9】

表	行表題	
207	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
208	Q ¹ は2-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
209	Q ¹ は2-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
210	Q ¹ は2-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
211	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
212	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	10
213	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
214	Q ¹ は2-Br-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
215	Q ¹ は2-Br-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
216	Q ¹ は2-Br-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
217	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
218	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
219	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
220	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
221	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	20
222	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
223	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
224	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
225	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
226	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
227	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
228	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
228A	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	30
228B	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
228C	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
229	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
230	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
231	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
231A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
231B	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
231C	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
232	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	40
233	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
234	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
234A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
234B	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
234C	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	

【表 10】

表	行表題	
235	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
236	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
237	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
238	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
239	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
240	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	10
241	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
242	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
243	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
244	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
245	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
246	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
247	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
248	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	20
249	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
250	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
251	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
252	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
253	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはNH, R ¹ およびR ^{1a} は <i>c</i> -Prを形成し、およびR ² はMe	
254	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはO, R ¹ はEt, R ^{1a} はHでありR ² はCl	
255	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はEt	
256	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはCHOH, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCF ₃	
257	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはNH, R ¹ はCH=CH ₂ , R ^{1a} はHでありR ² はCl	30
258	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはCHOH, XはO, R ¹ は <i>c</i> -Pr, R ^{1a} はHでありR ² はBr	
259	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は <i>c</i> -Prを形成し、およびR ² はMe	
260	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはCHOH, R ¹ は <i>c</i> -Pr, R ^{1a} はHでありR ² はCl	
261	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはNH, R ¹ はEt, R ^{1a} はHでありR ² はBr	
262	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはO, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はEt	
263	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはS, R ¹ はCH ₂ CH=CH ₂ , R ^{1a} はHでありR ² はCl	
264	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはCHOH, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² は <i>c</i> -Pr	
265	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはNH, R ¹ はCH ₂ CF ₃ , R ^{1a} はHでありR ² はMe	
266	Q ¹ は2-F-Ph, XはO, R ¹ はCH ₂ F, R ^{1a} はHでありR ² はCl	40
267	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCH ₂ Cl	
268	Q ¹ は2-Br-Ph, XはCHCH ₃ , R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
269	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはC(CH ₃)OH, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はMe	
270	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはO, R ¹ はEt, R ^{1a} はHでありR ² はBr	
271	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はOMe	

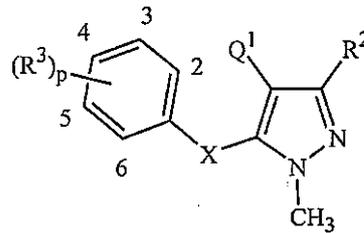
【表 1 1】

表	行表題	
272	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはCHOCH ₃ , R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はCl	
273	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはNH, R ¹ およびR ^{1a} は <i>c</i> -Prを形成し、およびR ² はBr	
274	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはO, R ¹ は <i>n</i> -Pr, R ^{1a} はHでありR ² はMe	
275	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはNH, R ¹ はCH ₂ C≡CH, R ^{1a} はHでありR ² はCl	
276	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはC(OCH ₃) ₂ , R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はBr	
277	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはNH, R ¹ およびR ^{1a} は <i>c</i> -Prを形成し、およびR ² はMe	10
278	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはO, R ¹ は <i>c</i> -Pr, R ^{1a} はHでありR ² はCl	
279	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはS, R ¹ およびR ^{1a} は共にHでありR ² はEt	
280	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはCHOH, R ¹ はEt, R ^{1a} はHでありR ² はMe	

【0319】

【表 1 2】

表 281



Q¹は2,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR²はMe

| (R ³) _p |
|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| 4-F | 4-Cl | 4-Br | 4-Me | 2,4-ジ-F |
| 2,6-ジ-F | 2,4-ジ-Cl | 2,6-ジ-Cl | 2-Cl-4-F | 2-F-4-Cl |
| 2-F-4-Br | 2-Br-6-F | 2-Cl-4-Br | 2-Br-4-Cl | 2-I-4-F |
| 2-F-4-I | 2-Cl-4,6-ジ-F | 4-Cl-2,6-ジ-F | 2-Br-4,6-ジ-F | 4-Br-2,6-ジ-F |
| 2-Br-4-F | 2-Me-4-F | 2,4,6-トリ-F | 2-Cl-4,5-ジ-F | 4-Cl-2,5-ジ-F |
| 2-F-4-CN | 2-Cl-4-CN | 2-Br-4-CN | 2,6-diF-4-CN | 2-F-4-MeO |
| 2-Cl-4-MeO | 2-Br-4-MeO | 2,6-ジ-F-4-MeO | 4-Br-2,5-ジ-F | 2-Br-4,5-ジ-F |

【0320】

本開示は表 282 ~ 448 をも含み、これらの各々は、表 281 中の行表題（すなわち、「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、XはCHOHであり、および、R²はMeである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表 281 と同じく構成されている。例えば、表 282 において、行表題は、「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、XはCHOHであり、および、R²はClである。」であり、および、(R³)_p は上記の表 281 において定義されているとおりである。それ故、表 282 中の最初の記載事項は、3-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-1H-ピラゾール-5-メタノールを特定的に開示する。表 283 ~ 448 も同様に構成されている。

【0321】

【表 1 3】

表	行表題
282	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl
283	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr
284	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe
285	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl
286	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr
287	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe

10

【 0 3 2 2 】

【表 1 4】

表	行表題	
288	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
289	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
290	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
291	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
292	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
292A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	10
292B	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
292C	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
293	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
294	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
295	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
296	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
297	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
298	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
299	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	20
300	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
301	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
302	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
303	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
304	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
305	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
306	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
307	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	30
308	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
309	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
310	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
311	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
312	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
313	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
314	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
315	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
316	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	40
317	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
318	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
319	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
320	Q ¹ は2-F-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
321	Q ¹ は2-F-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	

【表 15】

表	行表題	
322	Q ¹ は2-F-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
323	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
324	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
325	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
326	Q ¹ は2-Br-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
327	Q ¹ は2-Br-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	10
328	Q ¹ は2-Br-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
329	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
330	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
331	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
332	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
333	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
334	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
335	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
336	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	20
337	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
338	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
339	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
340	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
340A	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
340B	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
340C	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
341	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	30
342	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
343	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
343A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
343B	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
343C	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
344	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
345	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
346	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
346A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	40
346B	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
346C	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
347	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
348	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
349	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	

【表 16】

表	行表題	
350	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
351	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
352	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	
353	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はMe	
354	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はCl	
355	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはCHOHでありR ² はBr	10
356	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはCHOHでありR ² はMe	
357	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはCHOHでありR ² はCl	
358	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはCHOHでありR ² はBr	
359	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはCHOHでありR ² はMe	
360	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはCHOHでありR ² はCl	
361	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはCHOHでありR ² はBr	
362	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはCHOHでありR ² はMe	
363	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはCHOHでありR ² はCl	20
364	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはCHOHでありR ² はBr	
365	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
366	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
367	Q ¹ は2,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
368	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
369	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
370	Q ¹ は2,4-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
371	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
372	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	30
373	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
374	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
375	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
376	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
376A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
376B	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
376C	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
377	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
378	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	40
379	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
380	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
381	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
382	Q ¹ は2-Cl-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
383	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	

【表 17】

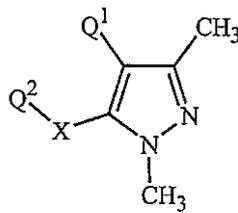
表	行表題	
384	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
385	Q ¹ は2-Cl-6-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
386	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
387	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
388	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
389	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	10
390	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
391	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
392	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
393	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
394	Q ¹ は2-Br-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
395	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
396	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
397	Q ¹ は2-Br-6-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
398	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	20
399	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
400	Q ¹ は2-Me-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
401	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
402	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
403	Q ¹ は2-I-4-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
404	Q ¹ は2-F-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
405	Q ¹ は2-F-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
406	Q ¹ は2-F-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	30
407	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
408	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
409	Q ¹ は2-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
410	Q ¹ は2-Br-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
411	Q ¹ は2-Br-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
412	Q ¹ は2-Br-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
413	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
414	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
415	Q ¹ は2-F-4-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	40
416	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
417	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
418	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
419	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
420	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	

【表 18】

表	行表題	
421	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
422	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
423	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
424	Q ¹ は2-F-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
424A	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
424B	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	10
424C	Q ¹ は2-F-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
425	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
426	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
427	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
427A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
427B	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
427C	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
428	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
429	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	20
430	Q ¹ は2-Br-4-MeO-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
430A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
430B	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
430C	Q ¹ は2-Br-4-EtO-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
431	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
432	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
433	Q ¹ は2-F-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
434	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	30
435	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
436	Q ¹ は2-Cl-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
437	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はMe	
438	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はCl	
439	Q ¹ は2-Br-4-CN-Ph, XはC(O)でありR ² はBr	
440	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはC(O)でありR ² はMe	
441	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはC(O)でありR ² はCl	
442	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル, XはC(O)でありR ² はBr	
443	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはC(O)でありR ² はMe	40
444	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはC(O)でありR ² はCl	
445	Q ¹ は2-Cl-3-チエニル, XはC(O)でありR ² はBr	
446	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはC(O)でありR ² はMe	
447	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはC(O)でありR ² はCl	
448	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニル, XはC(O)でありR ² はBr	

【表 19】

表 449



Q¹は2,6-ジ-F-PhでありXはNH

Q ²	Q ²	Q ²	Q ²
2-Cl-3-ピリジニル	6-Cl-3-ピリジニル	2,6-ジ-Cl-3-ピリジニル	3-Cl-2-ピリジニル
3,5-ジ-Cl-2-ピリジニル	3,5-ジ-F-2-ピリジニル	5-Me-2-ピリジニル	5-CN-2-ピリジニル
5-ピリミジニル	2-Cl-5-ピリミジニル	1,3-ジ-Me-5-ピラゾリル	5-Me-2-チアゾリル
5-Cl-2-ピリジニル	3,5-ジ-Cl-4-ピリジニル	テトラヒドロ-2H-ピラン-4-イル	キノリン-2-イル

10

【0328】

本開示は表450～587をも含み、これらの各々は、表449中の行表題（すなわち、「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、および、Xは、NHである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表449と同じく構成されている。例えば、表450において、行表題は、「Q¹は2,4-ジ-F-Phであり、および、XはNHである。」であり、および、Q²は上記の表449において定義されているとおりである。それ故、表450中の最初の記載事項は、2-クロロ-N-[4-(2,4-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-イル]-3-ピリジンアミンを特定的に開示する。表451～587も同様に構成されている。

20

【0329】

【表20】

表	行表題	表	行表題
450	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありXはNH	519	Q ¹ は2-Cl-PhでありXはS
451	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありXはNH	520	Q ¹ は2-Br-PhでありXはS
452	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありXはNH	521	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありXはS
453	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありXはNH	522	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありXはS
454	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありXはNH	523	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありXはS
455	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありXはNH	524	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありXはS
456	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありXはNH	525	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありXはS
457	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありXはNH	526	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありXはS
458	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありXはNH	527	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありXはS
459	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありXはNH	528	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありXはS
460	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありXはNH	529	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありXはS
461	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありXはNH	530	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありXはS

30

40

【0330】

【表 2 1】

表	行表題	表	行表題	
462	Q ¹ は2-F-PhでありXはNH	531	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありXはS	
463	Q ¹ は2-Cl-PhでありXはNH	532	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありXはS	
464	Q ¹ は2-Br-PhでありXはNH	533	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありXはCHOH	
465	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありXはNH	534	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありXはCHOH	
466	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありXはNH	535	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありXはCHOH	
467	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありXはNH	536	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありXはCHOH	10
468	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありXはNH	537	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありXはCHOH	
469	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありXはNH	538	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありXはCHOH	
470	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありXはNH	539	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありXはCHOH	
471	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありXはNH	540	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありXはCHOH	
472	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありXはNH	541	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありXはCHOH	
473	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありXはNH	542	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありXはCHOH	
474	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありXはNH	543	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありXはCHOH	
475	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありXはNH	544	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありXはCHOH	
476	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありXはNH	545	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありXはCHOH	20
477	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありXはO	546	Q ¹ は2-F-PhでありXはCHOH	
478	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありXはO	547	Q ¹ は2-Cl-PhでありXはCHOH	
479	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありXはO	548	Q ¹ は2-Br-PhでありXはCHOH	
480	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありXはO	549	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありXはCHOH	
481	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありXはO	550	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありXはCHOH	
482	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありXはO	551	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありXはCHOH	
483	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありXはO	552	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありXはCHOH	
484	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありXはO	553	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありXはCHOH	
485	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありXはO	554	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありXはCHOH	30
486	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありXはO	555	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありXはCHOH	
487	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありXはO	556	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありXはCHOH	
488	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありXはO	557	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありXはCHOH	
489	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありXはO	558	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-ピリジン-3-イルでありXはCHOH	
490	Q ¹ は2-F-PhでありXはO	559	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-チエン-3-イルでありXはCHOH	
491	Q ¹ は2-Cl-PhでありXはO	560	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありXはC(O)	
492	Q ¹ は2-Br-PhでありXはO	561	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありXはC(O)	
493	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありXはO	562	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありXはC(O)	
494	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありXはO	563	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OM-Ph eでありXはC(O)	40
495	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありXはO	564	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありXはC(O)	
496	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありXはO	565	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありXはC(O)	
497	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありXはO	566	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありXはC(O)	
498	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありXはO	567	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありXはC(O)	

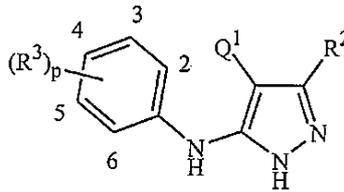
【表 2 2】

表	行表題	表	行表題
499	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありXはO	568	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありXはC(O)
500	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありXはO	569	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありXはC(O)
501	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありXはO	570	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありXはC(O)
502	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-ピリジン-3-イルでありXはO	571	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありXはC(O)
503	Q ¹ は2-Cl-チエン-3-イルでありXはO	572	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありXはC(O)
504	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-チエン-3-イルでありXはO	573	Q ¹ は2-F-PhでありXはC(O)
505	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありXはS	574	Q ¹ は2-Cl-PhでありXはC(O)
506	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありXはS	575	Q ¹ は2-Br-PhでありXはC(O)
507	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありXはS	576	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありXはC(O)
508	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありXはS	577	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありXはC(O)
509	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありXはS	578	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありXはC(O)
510	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありXはS	579	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありXはC(O)
511	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありXはS	580	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありXはC(O)
512	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありXはS	581	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありXはC(O)
513	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありXはS	582	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありXはC(O)
514	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありXはS	583	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありXはC(O)
515	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありXはS	584	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありXはC(O)
516	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありXはS	585	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありXはC(O)
517	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありXはS	586	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありXはC(O)
518	Q ¹ は2-F-PhでありXはS	587	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありXはC(O)

【 0 3 3 2 】

【表 23】

表 588



Q¹は2,6-ジ-F-PhでありR²はMe

| (R ³) _p |
|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| 2-F | 3-F | 4-F | 2-Cl | 3-Cl |
| 4-Cl | 2-Br | 3-Br | 4-Br | 2,4-ジ-F |
| 2,6-ジ-F | 2,4,6-トリ-F | 2,4,5-トリ-F | 2,3,5-トリ-F | 2,3,6-トリ-F |
| 2-Cl-4-F | 2-F-4-Cl | 2,4-ジ-Cl | 2,6-ジ-Cl | 2,4,6-トリ-Cl |
| 2-Br-4-F | 2-I-4-F | 2-Me-4-F | 2-F-4-MeO | 2-Cl-4-MeO |
| 2-Br-4-MeO | 2,6-ジ-F-4-MeO | 2-F-4-CN | 2-Cl-4-CN | 2-Br-4-CN |
| 2,6-ジ-F-4-CN | 2-Cl-4,5-ジ-F | 2-Cl-4,6-ジ-F | 2-Br-4,5-ジ-F | 2-Br-4,6-ジ-F |
| 4-Cl-2,5-ジ-F | 4-Cl-2,6-ジ-F | 4-Br-2,5-ジ-F | 4-Br-2,6-ジ-F | 2,4-ジ-Cl-6-F |
| 2,6-ジ-Cl-4-F | 2,6-ジ-Cl-4-MeO | 2-CF ₃ -4-F | 4-Me | 2,4-ジ-Me |
| 2-F-4-Br | 2-Cl-4-Br | 2-Br-4-Cl | 2-Br-4-F-6-Cl | 2-Cl-4-Br-6-F |

10

20

【0333】

本開示は表589～671をも含み、これらの各々は、表588中の行表題（すなわち、「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、および、R²はMeである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表588と同じく構成されている。例えば、表589において、行表題は「Q¹は2,6-ジ-F-Phであり、および、R²はClである。」であり、および、(R³)_pは上記の表588において定義されているとおりである。それ故、表589中の最初の記載事項は、5-クロロ-4-(2,6-ジフルオロフェニル)-N-(2-フルオロフェニル)-1H-ピラゾール-3-アミンを特定的に開示する。表589～671も同様に構成されている。

30

【0334】

【表 2 4】

表	行表題	表	行表題
589	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありR ² はCl	634	Q ¹ は2-Br-PhでありR ² はCl
590	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありR ² はBr	635	Q ¹ は2-Br-PhでありR ² はBr
591	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ² はMe	636	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ² はMe
592	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ² はCl	637	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ² はCl
593	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ² はBr	638	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ² はBr
594	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ² はMe	639	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ² はMe
595	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ² はCl	640	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ² はCl
596	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ² はBr	641	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ² はBr
597	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ² はMe	642	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ² はMe
598	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ² はCl	643	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ² はCl
599	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ² はBr	644	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ² はBr
599A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ² はMe	645	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ² はMe
599B	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ² はCl	646	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ² はCl
599C	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ² はBr	647	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ² はBr
600	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ² はMe	647A	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ² はMe
601	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ² はCl	647B	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ² はCl
602	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ² はBr	647C	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ² はBr
603	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ² はMe	648	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ² はMe
604	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ² はCl	649	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ² はCl
605	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ² はBr	650	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ² はBr
606	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ² はMe	650A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ² はMe
607	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ² はCl	650B	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ² はCl
608	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ² はBr	650C	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ² はBr
609	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ² はMe	651	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ² はMe
610	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ² はCl	652	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ² はCl
611	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ² はBr	653	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ² はBr
612	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ² はMe	653A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ² はMe
613	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ² はCl	653B	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ² はCl

【 0 3 3 5 】

【表 2 5】

表	行表題	表	行表題
614	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ² はBr	653C	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ² はBr
615	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ² はMe	654	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ² はMe
616	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ² はCl	655	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ² はCl
617	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ² はBr	656	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ² はBr
618	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ² はMe	657	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ² はMe
619	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ² はCl	658	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ² はCl
620	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ² はBr	659	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ² はBr
621	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ² はMe	660	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ² はMe
622	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ² はCl	661	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ² はCl
623	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ² はBr	662	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ² はBr
624	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ² はMe	663	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ² はMe
625	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ² はCl	664	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ² はCl
626	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ² はBr	665	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ² はBr
627	Q ¹ は2-F-PhでありR ² はMe	666	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ² はMe
628	Q ¹ は2-F-PhでありR ² はCl	667	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ² はCl
629	Q ¹ は2-F-PhでありR ² はBr	668	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ² はBr
630	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ² はMe	669	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ² はMe
631	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ² はCl	670	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ² はCl
632	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ² はBr	671	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ² はBr
633	Q ¹ は2-Br-PhでありR ² はMe		

【0336】

表 5 8 8 ~ 6 7 1 の化合物は X が NH である式 2 の化合物を示し、これは、スキーム 2 の方法を用いて式 1 の化合物を調製するために有用な中間体である。

【0337】

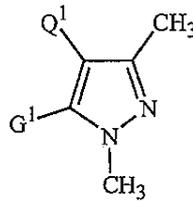
10

20

30

【表 26】

表 672

G¹は-OH

Q ¹	Q ¹	Q ¹	Q ¹
2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-トリ-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-Ph	2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-チエニル
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-ジ-Cl-3-チエニル
2,6-ジ-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

10

20

【0338】

本開示は表 673 ~ 676 をも含み、これらの各々は、表 672 中の行表題（すなわち、「G¹は-OHである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表 672 と同じく構成されている。例えば、表 673 において、行表題は「G¹は-SHである。」であり、および、Q¹は上記の表 672 において定義されているとおりである。それ故、表 673 中の最初の記載事項は、4-(2,6-ジフルオロフェニル)-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-5-チオールを特定的に開示する。表 674 ~ 676 も同様に構成されている。

【0339】

【表 27】

表	行表題	表	行表題
673	G ¹ は-SH	675A	G ¹ はI
674	G ¹ はCl	676	G ¹ は-NH ₂
675	G ¹ はBr		

30

【0340】

表 672 および 673 の化合物は、XがOまたはSであり、R¹およびR^{1a}が各々各Hであり、および、R²がCH₃である式 4 の化合物を示し、これは、スキーム 3 の方法を用いて式 1 の化合物を調製するために有用な中間体である。表 672 の化合物は、R¹およびR^{1a}が各々各Hであり、および、R²がCH₃である式 4 b の化合物をさらに示し、これは、スキーム 6 の方法を用いて式 6 a の中間化合物を調製するために、および、スキーム 7 の方法を用いて式 6 b の中間化合物を調製するために有用な中間体である。表 674 および 675 は、GがClまたはBrであり、および、R^{1a}が各々各Hであり、および、R²がCH₃である式 6 の化合物を示し、これは、スキーム 4 の方法を用いて式 1 c の化合物を調製するために有用な中間体である。表 676 は、式 R¹およびR^{1a}が各々各Hであり、および、R²がCH₃である 4 a の化合物を示し、これは、スキーム 5 の方法を用いて式 6 の中間化合物を調製するために有用な中間体である。

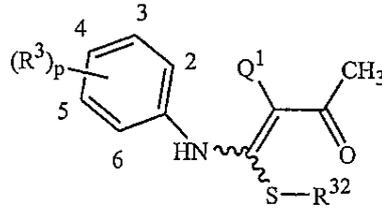
40

50

【 0 3 4 1 】

【 表 2 8 】

表 677

Q¹は2,6-ジ-F-PhでありR³²はMe

| (R ³) _p |
|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|--------------------------------|
| 2-F | 3-F | 4-F | 2-Cl | 3-Cl |
| 4-Cl | 2-Br | 3-Br | 4-Br | 2,4-ジ-F |
| 2,6-ジ-F | 2,4,6-トリ-F | 2,4,5-トリ-F | 2,3,5-トリ-F | 2,3,6-トリ-F |
| 2-Cl-4-F | 2-F-4-Cl | 2,4-ジ-Cl | 2,6-ジ-Cl | 2,4,6-トリ-Cl |
| 2-Br-4-F | 2-I-4-F | 2-Me-4-F | 2-F-4-MeO | 2-Cl-4-MeO |
| 2-Br-4-MeO | 2,6-ジ-F-4-MeO | 2-F-4-CN | 2-Cl-4-CN | 2-Br-4-CN |
| 2,6-ジ-F-4-CN | 2-Cl-4,5-ジ-F | 2-Cl-4,6-ジ-F | 2-Br-4,5-ジ-F | 2-Br-4,6-ジ-F |
| 4-Cl-2,5-ジ-F | 4-Cl-2,6-ジ-F | 4-Br-2,5-ジ-F | 4-Br-2,6-ジ-F | 2,4-ジ-Cl-6-F |
| 2,6-ジ-Cl-4-F | 2,6-ジ-Cl-4-MeO | 2-CF ₃ -4-F | 4-Me | 2,4-ジ-Me |
| 2-F-4-Br | 2-Cl-4-Br | 2-Br-4-Cl | 2-Br-4-F-6-Cl | 2-Cl-4-Br-6-F |

10

【 0 3 4 2 】

本開示は表 678 ~ 704 をも含み、これらの各々は、表 677 中の行表題（すなわち、「Q¹は2,6-ジ-F-Phである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表 677 と同じく構成されている。例えば、表 2 において、行表題は「Q¹は2,4-ジ-F-Phである。」であり、および、(R³)_p は上記の表 677 において定義されているとおりである。それ故、表 678 中の最初の記載事項は、3-(2,6-ジフルオロフェニル)-4-[(2,4-ジフルオロフェニル)アミノ]-4-(メチルチオ)-3-ブテン-2-オンを特定的に開示する。表 679 ~ 704 も同様に構成されている。

20

30

【 0 3 4 3 】

【表 29】

表	行表題	表	行表題
678	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ³² はMe	721	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ³² はEt
679	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ³² はMe	722	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ³² はEt
680	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ³² はMe	723	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ³² はEt
680A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ³² はMe	724	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ³² はEt
681	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ³² はMe	724A	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ³² はEt
682	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ³² はMe	725	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ³² はEt
683	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ³² はMe	725A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ³² はEt
684	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ³² はMe	726	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ³² はEt
685	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ³² はMe	726A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ³² はEt
686	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ³² はMe	727	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ³² はEt
687	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ³² はMe	728	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ³² はEt
688	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ³² はMe	729	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ³² はEt
689	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ³² はMe	730	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ³² はEt
690	Q ¹ は2-F-PhでありR ³² はMe	731	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ³² はEt
691	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ³² はMe	732	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ³² はEt
692	Q ¹ は2-Br-PhでありR ³² はMe	733	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
693	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ³² はMe	734	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
694	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ³² はMe	735	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
695	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ³² はMe	736	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
696	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ³² はMe	736A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
696A	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ³² はMe	737	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
697	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ³² はMe	738	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
697A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ³² はMe	739	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr
698	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ³² はMe	740	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr

【0344】

【表 3 0】

表	行表題	表	行表題	
698A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ³² はMe	741	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
699	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ³² はMe	742	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
700	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ³² はMe	743	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
701	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ³² はMe	744	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
702	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ³² はMe	745	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
703	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ³² はMe	746	Q ¹ は2-F-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	10
704	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ³² はMe	747	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
705	Q ¹ は2,6-ジ-F-PhでありR ³² はEt	748	Q ¹ は2-Br-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
706	Q ¹ は2,4-ジ-F-PhでありR ³² はEt	749	Q ¹ は2-F-4-Cl-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
707	Q ¹ は2,4,6-トリ-F-PhでありR ³² はEt	750	Q ¹ は2,4-ジ-Cl-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
708	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OMe-PhでありR ³² はEt	751	Q ¹ は2,6-ジ-Cl-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
708A	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-OEt-PhでありR ³² はEt	752	Q ¹ は2-F-4-MeO-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
709	Q ¹ は2,6-ジ-F-4-CN-PhでありR ³² はEt	752A	Q ¹ は2-F-4-EtO-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
710	Q ¹ は2-Cl-4-F-PhでありR ³² はEt	753	Q ¹ は2-Cl-4-MeO-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	20
711	Q ¹ は2-Cl-6-F-PhでありR ³² はEt	753A	Q ¹ は2-Cl-4-EtO-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
712	Q ¹ は2-Cl-4,6-ジ-F-PhでありR ³² はEt	754	Q ¹ は2-Br-4-MeO-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
713	Q ¹ は4-Cl-2,6-ジ-F-PhでありR ³² はEt	754A	Q ¹ は2-Br-4-EtO-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
714	Q ¹ は2-Br-4-F-PhでありR ³² はEt	755	Q ¹ は2-F-4-CN-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
715	Q ¹ は2-Br-6-F-PhでありR ³² はEt	756	Q ¹ は2-Cl-4-CN-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
716	Q ¹ は2-Me-4-F-PhでありR ³² はEt	757	Q ¹ は2-Br-4-CN-PhでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
717	Q ¹ は2-I-4-F-PhでありR ³² はEt	758	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-ピリジニルでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
718	Q ¹ は2-F-PhでありR ³² はEt	759	Q ¹ は2-Cl-3-チエニルでありR ³² は <i>n</i> -Pr	
719	Q ¹ は2-Cl-PhでありR ³² はEt	760	Q ¹ は2,5-ジ-Cl-3-チエニルでありR ³² は <i>n</i> -Pr	30
720	Q ¹ は2-Br-PhでありR ³² はEt			

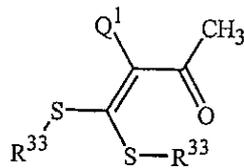
【 0 3 4 5】

表 6 7 7 ~ 7 6 0 の化合物は、R²がCH₃である式 1 7 の化合物を示し、これは、スキーム 1 6 の方法を用いて式 1 c の化合物を調製するために有用な中間体である。

【 0 3 4 6】

【表 3 1】

表 761

各 R³³は Me

Q ¹	Q ¹	Q ¹	Q ¹
2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-トリ-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-Ph	2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-チエニル
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-ジ-Cl-3-チエニル
2,6-ジ-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

10

20

【 0 3 4 7 】

本開示は表 7 6 2 ~ 7 6 4 をも含み、これらの各々は、表 7 6 1 中の行表題（すなわち、「各 R³³ は Me である。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表 7 6 1 と同じく構成されている。例えば、表 7 6 2 において、行表題は「各 R³³ は Et である。」であり、および、Q¹ は上記の表 7 6 1 において定義されているとおりである。それ故、表 7 6 2 中の最初の記載事項は、3 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 4 - ビス (エチルチオ) - 3 - ブテン - 2 - オンを特定的に開示する。表 7 6 3 および 7 6 4 も同様に構成されている。

【 0 3 4 8 】

【表 3 2】

表	行表題	表	行表題
762	各 R ³³ は Et	764	2つの R ³³ 一緒になって -CH ₂ -となる
763	各 R ³³ は n-Pr		

30

【 0 3 4 9 】

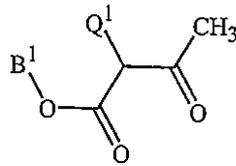
表 7 6 1 ~ 7 6 3 の化合物は、R² が CH₃ である式 1 8 の化合物を示し、これは、スキーム 1 7 の方法を用いて式 1 7 の中間化合物を調製するために有用な中間体である。表 7 6 4 の化合物は、R² が CH₃ である式 1 8 の化合物を示し、これは、以下のスキーム 1 7 に記載の方法を用いて式 4 c の中間化合物を調製するために有用な中間体である。

40

【 0 3 5 0 】

【表 3 3】

表 765



B¹はMe

Q¹	Q¹	Q¹	Q¹	10
2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph	
2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph	
2,4,6-トリ-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	
2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph	
2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-Ph	2,5-ジ-Cl-3-ピリジニル	
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-チエニル	
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-ジ-Cl-3-チエニル	
2,6-ジ-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph	20

【0351】

本開示は表 766 ~ 769 をも含み、これらの各々は、表 765 中の行表題（すなわち、「B¹はMeである。」）が以下に示されるそれぞれの行表題で置き換えられていること以外は、上記の表 765 と同じく構成されている。例えば、表 766 において、行表題は「B¹はEtである。」であり、および、Q¹は上記の表 765 において定義されるとおりである。それ故、表 766 中の最初の記載事項は、エチル - アセチル - 2,6 - ジフルオロベンゼンアセテートを特定の開示する。表 767 ~ 769 も同様に構成されている。

【0352】

【表 3 4】

表	行表題	表	行表題
766	B¹はEt	768	B¹はPh
767	B¹はn-Pr	769	B¹はCH₂Ph

【0353】

表 765 ~ 769 の化合物は、R²がCH₃である式 16 の化合物を示し、これは、スキーム 14 の方法を用いて式 4b の中間化合物を調製するために有用な中間体である。

【0354】

配合物 / 実用性

本発明の化合物は、一般に、組成物、すなわち配合物で殺菌・殺カビ性活性成分として、キャリアとなる界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分と共に用いられることとなる。配合物または組成物処方成分は、活性成分の物理特性、適用形態、および、土壌タイプ、水分および温度などの環境要因と合致するよう選択される。

【0355】

有用な配合物は、液体組成物および固体組成物の両方を含む。液体組成物としては、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、乳液（マイクロエマルジョンおよび/またはサスポエマルジョンを含む）などが挙げられ、これらは、任意により、ゲルに増粘されることが可能である。水性液体組成物の一般的なタイプは、可溶性濃縮物、懸濁濃縮物、カプセル懸

30

40

50

濁液、濃縮乳液、ミクロエマルジョンおよびサスポエマルジョンである。非水性液体組成物の一般的なタイプは、乳化性濃縮物、ミクロ乳化性濃縮物、分散性濃縮物および油分散体である。

【0356】

固体組成物の一般的なタイプは、粉剤、粉末、顆粒、ペレット、プリル、香錠、錠剤、充填フィルム（種子粉衣を含む）などであり、これらは、水分散性（「湿潤性」）または水溶性であることが可能である。フィルム形成性溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングが、種子処理に特に有用である。活性成分は（マイクロ）カプセル化されていることが可能であり、さらに、懸濁液または固体配合物に形成されることが可能である；あるいは、活性成分の全配合物をカプセル化することが可能である（または「オーバーコート」）。カプセル化は、活性成分の放出を制御または遅らせることが可能である。乳化性顆粒は、乳化性濃縮物配合物の利点と乾燥粒状配合物の利点とを兼ね備えている。高強度組成物は、さらなる配合物への中間体として主に用いられる。

10

【0357】

噴霧可能な配合物は、典型的には、吹付けの前に好適な媒体中に希釈される。このような液体および固体配合物は、通常は水である噴霧媒体中に容易に希釈されるよう配合される。噴霧量は、およそ約1～数千リットル/ヘクタールの範囲であることが可能であるが、より典型的には、約10～数百リットル/ヘクタールの範囲である。噴霧可能な配合物は、空中もしくは地上散布による葉の処理のために、または、植物の生育培地への適用のために好適な他の媒体または水と、タンク中で混合されることが可能である。液体および乾燥配合物は、点滴灌漑システムに直接的に計量可能であり、または、植え付けの最中に畝間に計量可能である。液体および固体配合物は、植え付けの前に、成長する根および他の地下植物部位および/または群葉を保護するために、全身摂取を介して作物および他の望ましい植生の種子に種子処理として適用されることが可能である。

20

【0358】

配合物は、典型的には、有効量の活性成分、希釈剤および界面活性剤を、合計が100重量パーセントとなる以下のおよその範囲内で含有するであろう。

【0359】

【表35】

30

	重量%		
	活性成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性の顆粒、 錠剤および粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散体、懸濁液、乳液、溶液 (乳化性濃縮物を含む)	1-50	40-99	0-50
粉剤	1-25	70-99	0-5
顆粒およびペレット	0.001-95	5-99.999	0-15
高濃度組成物	90-99	0-10	0-2

40

【0360】

固体希釈剤としては、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタパルジャイトおよびカオリンなどのクレイ、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンプン、デキストリン、糖質（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土

50

、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび炭酸水素塩、および硫酸ナトリウムが挙げられる。典型的な固体希釈剤は、Watkinsら, Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 第2の版, Dorland Books, Caldwell, New Jerseyに記載されている。

【0361】

液体希釈剤としては、例えば、水、N, N - ジメチルアルカンアミド（例えば、N, N - ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N - アルキルピロリドン（例えば、N - メチルピロリジノン）、エチレングリコール、トリエチレングリコール、プロピレングリコール、ジプロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、プロピレンカーボネート、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、鉱油、正パラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、トリアセチン、芳香族炭化水素、脱芳香族化脂肪族、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン；シクロヘキサノン、2 - ヘプタノン、イソホロンおよび4 - ヒドロキシ - 4 - メチル - 2 - ペンタノンなどのケトン；イソアミルアセテート、ヘキシルアセテート、ヘプチルアセテート、オクチルアセテート、ノニルアセテート、トリデシルアセテートおよびイソボルニルアセテートなどの酢酸塩；アルキル化乳酸塩エステル、二塩基性エステルおよび - ブチロラクトンなどの他のエステル類；ならびに、メタノール、エタノール、n - プロパノール、イソプロピルアルコール、n - ブタノール、イソブチルアルコール、n - ヘキサノール、2 - エチルヘキサノール、n - オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ジアセトンアルコールおよびベンジルアルコールなどの直鎖、分岐、飽和または不飽和であることが可能であるアルコールが挙げられる。液体希釈剤としてはまた、植物種子油および果実油（例えば、オリーブ、ヒマ、亜麻仁、ゴマ、コーン（トウモロコシ）、ピーナッツ、ヒマワリ、ブドウ種子、ペニバナ、綿実、ダイズ、ナタネ、ココナツおよびパーム核の油）、動物性脂肪（例えば、牛脂、豚脂、ラード、タラ肝油、魚油）、ならびに、これらの混合物などの飽和および不飽和脂肪酸のグリセロールエステル（典型的にはC₆ ~ C₂₂）が挙げられる。液体希釈剤としてはまたアルキル化脂肪酸（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）が挙げられ、ここで、脂肪酸は、植物性および動物性グリセロールエステルの加水分解により入手され得、蒸留によって精製されることが可能である。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 第2版, Interscience, New York, 1950年に記載されている。

【0362】

本発明の固体および液体組成物は、度々、1種以上の界面活性剤を含む。液体に添加される場合、界面活性剤（「表面活性薬剤」としても公知である）は、一般に、液体の表面張力を変性、最も頻繁には低減させる。界面活性剤分子中の親水性基および親油性基の性質に応じて、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用であることが可能である。

【0363】

界面活性剤は、ノニオン性、アニオン性またはカチオン性に区分けされることが可能である。本組成物に有用なノニオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：天然および合成アルコール（分岐または直鎖であり得る）系であり、ならびに、アルコールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されるアルコールアルコキシレートなどのアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミドおよびエトキシル化アルカノールアミド；エトキシル化ダイズ油、ヒマシ油およびナタネ油などのアルコキシル化トリグリセリド；オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレートおよびドデシ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コキシ

レート（フェノールおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されたもの）；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドから調製されたブロックポリマー、および、末端ブロックがプロピレンオキシドから調製された逆ブロックポリマー；エトキシ化脂肪酸；エトキシ化脂肪エステルおよび油；エトキシ化メチルエステル；エトキシ化トリステリルフェノール（エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されたものを含む）；ポリエトキシ化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシ化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシ化グリセロール脂肪酸エステルなどの脂肪酸エステル、グリセロールエステル、ラノリン系誘導体、ポリエトキシレートエステル；ソルビタンエステルなどの他のソルビタン誘導体；ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキド P E G（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトまたはくし形ポリマーおよび星形ポリマーなどの高分子界面活性剤；ポリエチレングリコール（P E G）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコン系界面活性剤；ならびに、スクロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキル多糖類などの糖質 - 誘導体が挙げられる。

10

【 0 3 6 4 】

有用なアニオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：アルキルアールスルホン酸およびこれらの塩；カルボキシ化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホネート誘導体；リグノスルホネートなどのリグニンおよびリグニン誘導体；マレイン酸またはコハク酸またはこれらの無水物；オレフィンスルホン酸塩；アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステルおよびステリルフェノールエトキシレートのリン酸エステルなどのリン酸エステル；タンパク質系界面活性剤；サルコシン誘導体；硫酸ステリルフェノールエーテル；油および脂肪酸の硫酸塩およびスルホン酸塩；エトキシ化アルキルフェノールの硫酸塩およびスルホン酸塩；アルコールの硫酸塩；エトキシ化アルコールの硫酸塩；N, N - アルキルタウレートなどのアミンおよびアミドのスルホン酸塩；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、ならびに、ドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩；縮合ナフタレンのスルホン酸塩；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩；精留された石油のスルホン酸塩；スルホスクシナメート；ならびに、ジアルキルスルホコハク酸塩などのスルホコハク酸塩およびそれらの誘導体が挙げられる。

20

【 0 3 6 5 】

有用なカチオン性界面活性剤としては、これらに限定されないが：アミドおよびエトキシ化アミド；N - アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレントトラアミン、ならびに、エトキシ化アミン、エトキシ化ジアミンおよびプロポキシ化アミンなどのアミン（アミンおよびエチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはこれらの混合物から調製されたもの）；アミン酢酸塩およびジアミン塩などのアミン塩；第4級塩、エトキシ化第4級塩およびジ第4級塩などの第4級アンモニウム塩；ならびに、アルキルジメチルアミンオキシドおよびビス - （2 - ヒドロキシエチル） - アルキルアミンオキシドなどのアミンオキシドが挙げられる。

30

【 0 3 6 6 】

ノニオン性界面活性剤およびアニオン性界面活性剤の混合物、または、ノニオン性界面活性剤およびカチオン性界面活性剤の混合物もまた本組成物について有用である。ノニオン性、アニオン性およびカチオン性界面活性剤、ならびに、これらの推奨される使用が多様な発行済みの文献中に開示されており、McCUTCHEON'S Emulsifiers and Detergents, McCUTCHEON'S Division による発行の年刊米国および国際版, Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely および Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964年；ならびに、A. S. Davidson および B. Milwidsky, Synthetic Detergents, 第7版, John Wiley and Sons, New York, 1987年

40

50

が含まれる。

【0367】

本発明の組成物はまた、当業者に配合物用の助剤として公知である配合助剤および添加剤を含有していてもよい（これらのいく種かは、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としても機能するとみなされ得る）。このような配合助剤および添加剤は：pH（緩衝剤）、処理中の発泡（ポリオルガノシロキサンなどの消泡剤）、活性成分の沈降（懸濁剤）、粘度（チクソトロピー性増粘剤）、容器中の微生物の増殖（抗菌剤）、生成物の凍結（不凍液）、色（染料/顔料分散体）、洗濯堅牢性（塗膜形成剤または展着剤）、蒸発（蒸発抑制剤）、および、他の配合属性を制御し得る。塗膜形成剤としては、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが挙げられる。配合助剤および添加剤の例としては、McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, McCutcheon's Divisionによる発行の年刊国際および北米版, Manufacturing Confectioner Publishing Co.; ならびに、国際公開第03/024222号パンフレットに列挙されているものが挙げられる。

10

【0368】

式1の化合物および任意の他の活性成分は、典型的には、活性成分を溶剤中に溶解させることにより、または、液体もしくは乾燥希釈剤中に粉碎することにより、本組成物中に組み込まれる。乳化性濃縮物を含む溶液は、単に処方成分を混合することにより調製することが可能である。乳化性濃縮物として用いることが意図されている液体組成物の溶剤が水-不混和性である場合、乳化剤が、典型的には、水での希釈時に活性成分含有溶剤が乳化するよう添加される。2,000 μm以下の粒径を有する活性成分スラリーは、媒体ミルを用いて湿潤粉碎して、3 μm未満の平均直径を有する粒子を得ることが可能である。水性スラリーを、最終懸濁濃縮物（例えば、米国特許第3,060,084号明細書を参照のこと）とするか、または、噴霧乾燥によりさらに処理して水-分散性顆粒を形成することが可能である。乾燥配合物は、通常は、2~10 μmの範囲内の平均粒径をもたらす乾燥粉碎プロセスを必要とする。粉剤および粉末は、ブレンダー工程、および、通常は粉碎工程により調製することが可能である（ハンマーミルまたは流体-エネルギーミルなどで）。顆粒およびペレットは、予め形成した粒状キャリアに活性材を吹付けることにより、または、凝塊技術により調製することが可能である。Browning, 「Agglomeration」、Chemical Engineering, 1967年12月4日, 第147~48ページ、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 第4版, McGraw-Hill, New York, 1963年、第8~57ページおよびそれ以降、ならびに、国際公開第91/13546号パンフレットを参照のこと。ペレットは、米国特許第4,172,714号明細書に記載のとおり調製することが可能である。水分散性および水溶性顆粒は、米国特許第4,144,050号明細書、米国特許第3,920,442号明細書および独国特許第3,246,493号明細書に教示されているとおり調製することが可能である。錠剤は、米国特許第5,180,587号明細書、米国特許第5,232,701号明細書および米国特許第5,208,030号明細書に教示されているとおり調製することが可能である。フィルムは、英国特許2,095,558号明細書および米国特許第3,299,566号明細書に教示されているとおり調製することが可能である。

20

30

40

【0369】

配合技術分野に関するさらなる情報に関しては、T.S. Woods, 「The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture」、Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. BrooksおよびT.R. Roberts編, 9th International Congress on Pesticide Chemistryの予稿集

50

, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999年, 第120~133ページを参照のこと。また、米国特許第3,235,361号明細書、第6欄、第16行~第7欄、第19行および実施例10~41;米国特許第3,309,192号明細書、第5欄、第43行~第7欄、第62行および実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138~140、162~164、166、167および169~182;米国特許第2,891,855号明細書、第3欄、第66行~第5欄、第17行および実施例1~4;Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961年, 第81~96ページ;Hanceら, Weed Control Handbook, 第8版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989年;ならびに、Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000年を参照のこと。

10

【0370】

以下の実施例においては、すべてのパーセンテージは重量基準であり、および、すべての配合物は従来の方法によって調製されている。化合物番号は、索引表A中の化合物を指している。さらなる詳細なしで、当業者は、上記の記載を用いて、本発明を最大限利用可能であると考えられている。以下の実施例は、従って、単なる例示であって、本開示を如何様にも全く限定しないと解釈されるべきである。パーセンテージは、他に示されていない限りにおいて重量基準である。

20

【0371】

【表36】

実施例A

高強度濃縮物

化合物18	98.5%
シリカエーロゲル	0.5%
合成非晶質ファインシリカ	1.0%

30

【0372】

【表37】

実施例B

水和粉末

化合物22	65.0%
ドデシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグニンスルホン酸ナトリウム	4.0%
アルミノケイ酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト(焼成)	23.0%

40

【0373】

【表 3 8】

実施例 C顆粒

化合物23	10.0%
アタパルジャイト粒体 顆粒 (低揮発性物質、0.71/0.30mm、U.S.S No.25~50シーブ)	90.0%

【 0 3 7 4 】

【表 3 9】

10

実施例 D押出ペレット

化合物 24	25.0%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

20

【 0 3 7 5 】

【表 4 0】

実施例 E乳化性濃縮物

化合物 36	10.0%
ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレエート	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸メチルエステル	70.0%

30

【 0 3 7 6 】

【表 4 1】

実施例 Fマイクロエマルジョン

化合物 41	5.0%
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	30.0%
アルキルポリグリコシド	30.0%
モノオレイン酸グリセリル	15.0%
水	20.0%

40

【 0 3 7 7 】

【表 4 2】

実施例 G

種子処理

化合物 45	20.00%	
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	5.00%	
モンタン酸ワックス	5.00%	
リグニンスルホン酸カルシウム	1.00%	
ポリオキシエチレン/ポリオキシプロピレンブロックコポリマー	1.00%	10
ステアリルアルコール (POE 20)	2.00%	
ポリオルガノシラン	0.20%	
着色赤色染料	0.05%	
水	65.75%	

【0378】

配合物表中のものなどの配合物は、典型的には、適用の前に水で希釈されて水性組成物が形成される。植物またはその一部分への直接適用のための水性組成物（例えば、噴霧タンク組成物）は、典型的には、本発明の化合物の少なくとも約 1 ppm 以上（例えば、1 ppm ~ 100 ppm）である。

【0379】

本発明の化合物は、植物病害防除剤として有用である。本発明は、従って、保護されるべき植物もしくはその一部分、または、保護されるべき植物種子に、有効量の本発明の化合物または前記化合物を含有する殺菌・殺カビ組成物を適用する工程を含む、真菌性植物病原体により引き起こされる植物病害を防除する方法をさらに含む。本発明の化合物および/または組成物は、担子菌、子嚢菌、卵菌および不完全菌類クラスにおける幅広い範囲の真菌性植物病原体によって引き起こされる病害の防除をもたらす。これらは、幅広い範囲の植物病害、特に、観賞植物、芝生、野菜、圃場、穀類、および、果実作物の葉病原体の防除に有効である。これらの病原体としては：フィトフトラ インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、フィトフトラ メガスペルマ (*Phytophthora megasperma*)、フィトフトラ パラシティカ (*Phytophthora parasitica*)、フィトフトラ シンナモミ (*Phytophthora cinnamomi*) およびフィトフトラ カプシシ (*Phytophthora capsici*) などの疫病菌 (*Phytophthora*) 病害、ピシウム アファニデルマツム (*Pythium aphanidermatum*) などの腐敗病菌 (*Pythium*) 病害、および、プラズモパラ ビチコーラ (*Plasmopara viticola*)、ツユカビ種 (*Peronospora spp.*) (タバコベと病菌 (*Peronospora tabacina*) およびアブラナ科ベと病菌 (*Peronospora parasitica*) を含む)、プソイドペロノスポラ種 (*Pseudoperonospora spp.*) (プソイドペロノスポラ クベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*) を含む)、および、ブレミア ラクツカエ (*Bremia lactucae*) などのツユカビ (*Peronosporaceae*) 科における病害を含む卵菌；アルテルナリア ソラニ (*Alternaria solani*) およびアルテルナリア ブラッシカエ (*Alternaria brassicae*) などのアルテルナリア属 (*Alternaria*) 病害、ガイグナルディア ビドウェル (*Guignardia bidwellii*) などのガイグナルディア属 (*Guignardia*) 病害、ベンツリア イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) などのベンツリア属 (*Venturia*) 病害、セプトリア ノドルム (*Septoria nodorum*) およびセプトリア トリティシ (*Septoria tritici*)

tritici)などのセプトリア属(*Septoria*)病害、エリシフェ種(*Erysiphe* spp.) (エリシフェ グラミニス(*Erysiphe graminis*)およびエリシフェ ポリゴニ(*Erysiphe polygoni*)を含む)、ウンシヌラ ネカツル(*Uncinula necatur*)、スファエロテカ フリゲナ(*Sphaerotheca fuligena*)、および、ポドスファエラ ルコトリチャ(*Podosphaera leucotricha*)、プソイドセルコスポレラ ヘルポトリコイド(*Pseudocercospora herpotrichoides*)などのウドンコ病病害、ボトリチス シネレア(*Botrytis cinerea*)、モニリニア フルクティコーラ(*Monilinia fructicola*)などのボトリチス(*Botrytis*)病害、スクレロティニア スクレロティオルム(*Sclerotinia sclerotiorum*)、マグナポルテ グリセア(*Magnaporthe grisea*)、ホモプシス ビティコーラ(*Phomopsis viticola*)などのスクレロティニア属(*Sclerotinia*)病害、ヘルミントスポリウム トリティシ レペンティス(*Helminthosporium tritici repentis*)、ピレノホラ テレス(*Pyrenophora teres*)などのヘルミントスポリウム属(*Helminthosporium*)病害、グロメレラ属(*Glomerella*)またはコレトトリカム種(*Colletotrichum* spp.) (コレトトリカム グラミニコラ(*Colletotrichum graminicola*)およびコレトトリカム オルビクラレ(*Colletotrichum orbiculare*)など)、および、ゲーウマノミセス グラミニス(*Gaeumannomyces graminis*)などの炭疽病病害を含む子囊菌; プッシニア種(*Puccinia* spp.) (プッシニア レコンディタ(*Puccinia recondita*)、プッシニア ストリイフォルミス(*Puccinia striiformis*)、プッシニア ホルデイ(*Puccinia hordei*)、プッシニア グラミニス(*Puccinia graminis*)およびプッシニア アラキディス(*Puccinia arachidis*)など)によって引き起こされる銹病、ヘミレイア バスタトリクス(*Hemileia vastatrix*)、および、ファコプソラ パチリジ(*Phakopsora pachyrhizi*)を含む担子菌; ラストロエミア フロッコサム(*Rutstroemia floccosum*) (スクレロンティナ ホモエオカルパ(*Sclerontina homoeocarpa*)としても知られる); リゾクトニア(*Rhizoctonia* spp.) (リゾクトニア ソラニ(*Rhizoctonia solani*)など); フザリウム ロゼウム(*Fusarium roseum*)、フザリウム グラミネアルム(*Fusarium graminearum*)およびフザリウム オキシスポラム(*Fusarium oxysporum*)などのフザリウム属(*Fusarium*)病害; ベルティシリウム ダーリエ(*Verticillium dahliae*); スクレロティウム ロルフィシ(*Sclerotium rolfsii*); リンコスポリウム セカリス(*Rynchosporium secalis*); セルコスポリジウム ベルソナツム(*Cercosporidium personatum*)、セルコスポラ アラキディコーラ(*Cercospora arachidicola*)、および、セルコスポラ ベティコーラ(*Cercospora beticola*)を含む他の病原体; ならびに、これらの病原体に密接に関連している他の属および種が挙げられる。これらの殺菌・殺カビ活性に追加して、組成物または組み合わせは、エルウィニア アミロボラ(*Erwinia amylovora*)、キサントモナス カムペストリス(*Xanthomonas campestris*)、プソイドモナス シリンガエ(*Pseudomonas syringae*)、および他の関連種などの細菌に活性をも有している。

【0380】

植物病害防除は、通常、感染前または感染後に、根、茎、群葉、果実、種子、塊茎あるいは鱗茎などの保護されるべき植物の一部、または、保護されるべき植物が生育している媒体(土壌または砂土)に、有効量の本発明の化合物を適用することにより達成される。

10

20

30

40

50

化合物はまた、種子および種子から発育している実生を保護するために種子に適用することが可能である。化合物はまた、植物を処理するための灌漑水を介して適用されることが可能である。

【0381】

従って、本発明の本態様はまた、殺菌・殺カビ的に有効な量の式1の化合物、そのN-オキシドまたは塩を、植物（またはその一部）または植物種子（直接的に、または、植物もしくは植物種子の環境（例えば、生育培地）を介して）に適用する工程を含む植物または植物種子を真菌性病原体によって引き起こされる病害から保護するための方法として説明されることも可能である。

【0382】

これらの化合物の適用量は、環境の多くの要因により影響される可能性があり、実際の使用条件下で決定されるべきである。群葉は、通常、約1g/ha未満～約5,000g/haの活性成分の量で処理される場合に保護されることが可能である。種子および実生は、通常、種子が、1キログラムの種子当たり約0.1～約10gの量で処理される場合に保護されることが可能である。

【0383】

本発明の化合物はまた、殺菌・殺カビ剤、殺虫剤、抗線虫薬、殺菌剤、殺ダニ剤、除草剤、除草剤毒性緩和剤、昆虫脱皮阻害剤および発根促進剤などの成長調整剤、不妊化剤、信号化学物質、忌避剤、誘引剤、フェロモン、摂食刺激物質、植物栄養分、他の生体活性化合物または昆虫病原性細菌、ウイルスまたは真菌を含む1種以上の他の生体活性化合物または薬剤と混合されて、多成分有害生物防除剤を形成し、さらに幅広い範囲の農学的保護をもたらすことが可能である。それ故、本発明はまた、殺菌・殺カビ的に有効な量の式1の化合物と、生物学的に有効量の少なくとも1種の追加の生体活性化合物または薬剤とを含む組成物に関し、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも1種をさらに含んでいることが可能である。他の生体活性化合物または薬剤は、界面活性剤、固体または液体希釈剤の少なくとも1種を含む組成物中に配合されていることが可能である。本発明の混合物について、1種以上の他の生体活性化合物または薬剤を式1の化合物と一緒に配合して予混合物を形成することが可能であり、または、1種以上の他の生体活性化合物または薬剤を式1の化合物とは別に配合し、配合物を適用の前に（例えば、噴霧タンク中で）組み合わせること、もしくは、代わりに、連続して適用することが可能である。

【0384】

発明の概要に記載されているとおり、本発明の一態様は、（すなわち、混合物またはその組み合わせ）式1の化合物、そのN-オキシドまたは塩（すなわち、成分a）、および少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ剤（すなわち、成分b）を含む殺菌・殺カビ組成物である。

【0385】

注目すべきは、成分（a）である式1化合物に追加して、以下のクラスからなる群から選択される少なくとも1種の殺菌・殺カビ性化合物を成分（b）として含む組成物である：
 （b1）メチルベンズイミダゾールカルバメート（MBC）殺菌・殺カビ剤；
 （b2）ジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤；
 （b3）脱メチル化抑制（DMI）殺菌・殺カビ剤；
 （b4）フェニルアミド殺菌・殺カビ剤；
 （b5）アミン/モルホリン殺菌・殺カビ剤；
 （b6）リン脂質生合成抑制殺菌・殺カビ剤；
 （b7）カルボキサミド殺菌・殺カビ剤；
 （b8）ヒドロキシ（2-アミノ-）ピリミジン殺菌・殺カビ剤；
 （b9）アニリノピリミジン殺菌・殺カビ剤；
 （b10）N-フェニルカルバメート殺菌・殺カビ剤；
 （b11）キノン外部抑制（QoI）殺菌・殺カビ剤；
 （b12）フェニルピロール殺菌・殺カビ剤；
 （b13）キノリン殺菌・殺カビ剤；
 （b14）脂質過酸化抑制殺菌・殺カビ剤；
 （b15）メラニン生合成抑制-レダクターゼ（MBI-R）殺菌・殺カビ剤；
 （b16）メラニン生合成抑制-デヒドラターゼ（MBI-D）殺菌・殺カビ剤；
 （b17）ヒドロキシアニリド殺菌・殺カビ剤；
 （b18）スクアレン-エポキシダーゼ抑制殺菌・殺カビ剤；
 （b19）ポリオキシシン殺菌・殺カビ剤；
 （b20）フェニル尿素殺菌・殺カビ剤

10

20

30

40

50

; (b 2 1) キノン内部抑制 (Q i I) 殺菌・殺カビ剤; (b 2 2) ベンズアミド殺菌・殺カビ剤; (b 2 3) エノピラヌロン酸抗生物質殺菌・殺カビ剤; (b 2 4) ヘキソピラノシル抗生物質殺菌・殺カビ剤; (b 2 5) グルコピラノシル抗生物質: タンパク質合成殺菌・殺カビ剤; (b 2 6) グルコピラノシル抗生物質: トレハラーゼおよびイノシトール生合成殺菌・殺カビ剤; (b 2 7) シアノアセタミドオキシム殺菌・殺カビ剤; (b 2 8) カルバメート殺菌・殺カビ剤; (b 2 9) 酸化性リン酸化脱共役殺菌・殺カビ剤; (b 3 0) 有機錫殺菌・殺カビ剤; (b 3 1) カルボン酸殺菌・殺カビ剤; (b 3 2) 芳香族複素環式殺菌・殺カビ剤; (b 3 3) ホスホネート殺菌・殺カビ剤; (b 3 4) フタルアミド酸殺菌・殺カビ剤; (b 3 5) ベンゾトリアジン殺菌・殺カビ剤; (b 3 6) ベンゼン - スルホンアミド殺菌・殺カビ剤; (b 3 7) ピリダジノン殺菌・殺カビ剤; (b 3 8) チオフェン - カルボキサミド殺菌・殺カビ剤; (b 3 9) ピリミジンアミド殺菌・殺カビ剤; (b 4 0) カルボン酸アミド (C A A) 殺菌・殺カビ剤; (b 4 1) テトラサイクリン抗生物質殺菌・殺カビ剤; (b 4 2) チオカルバメート殺菌・殺カビ剤; (b 4 3) ベンズアミド殺菌・殺カビ剤; (b 4 4) 宿主植物防御誘起殺菌・殺カビ剤; (b 4 5) 多部位接触作用殺菌・殺カビ剤; (b 4 6) クラス (b 1) ~ (b 4 5) 以外の殺菌・殺カビ剤; ならびに、クラス (b 1) ~ (b 4 6) の化合物の塩。

10

【0386】

これらのクラスの殺菌・殺カビ性化合物のさらなる記載が以下に供されている。

【0387】

(b 1) 「メチルベンズイミダゾールカルバメート (M B C) 殺菌・殺カビ剤」 (F R A C (F u n g i c i d e R e s i s t a n c e A c t i o n C o m m i t t e e) コード 1) は、微小管会合中に - チュープリンに結合することにより有糸分裂を阻害する。微小管会合の阻害は、細胞分裂、細胞内輸送および細胞構造を攪乱することが可能である。メチルベンズイミダゾールカルバメート殺菌・殺カビ剤としては、ベンズイミダゾールおよびチオファネート殺菌・殺カビ剤が挙げられる。ベンズイミダゾールとしては、ベノミル、カルベンダジム、フベリダゾールおよびチアベンダゾールが挙げられる。チオファネートとしては、チオファネートおよびチオファネート - メチルが挙げられる。

20

【0388】

(b 2) 「ジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤」 (F R A C コード 2) は、N A D H チトクロム c レダクターゼへの干渉を介して真菌における脂質過酸化を阻害すると提案されている。例としては、クロゾリネート、イプロジオン、プロシミドンおよびピンクロリンが挙げられる。

30

【0389】

(b 3) 「脱メチル化抑制 (D M I) 殺菌・殺カビ剤」 (F R A C コード 3) は、ステロール産生に關与する C 1 4 - デメチラーゼを阻害する。エルゴステロールなどのステロールは、膜構造および機能のために必要であり、自身を機能性細胞壁の発達のために必須とする。従って、これらの殺菌・殺カビ剤への露出は、感受性の真菌の異常な成長および最終的には死滅をもたらす。D M I 殺菌・殺カビ剤は、数々の化学的区分に分類される。アゾール (トリアゾールおよびイミダゾールを含む)、ピリミジン、ピペラジンおよびピリジン。トリアゾールとしては、アザコナゾール、ピテルタノール、プロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール (ジニコナゾール - M を含む)、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、キンコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾールおよびウニコナゾールが挙げられる。イミダゾールとしては、クロトリマゾール、エコナゾール、イマザリル、イソコナゾール、ミコナゾール、オキスポコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエートおよびトリフルミゾールが挙げられる。ピリミジンとしては、フェナリモル、ヌアリモルおよびトリアリモルが挙げられる。ピペラジンとしては、トリホリンが挙げられる。ピリジンとしては、

40

50

ブチオベートおよびピリフェノックスが挙げられる。生化学的研究は、上述の殺菌・殺カビ剤のすべてが、K. H. Kuckら, *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (編), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995年, 205~258ページにより記載されているDMI殺菌・殺カビ剤であることを示した。

【0390】

(b4) 「フェニルアミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコード4)は、卵菌類真菌におけるRNAポリメラーゼの特異的抑制剤である。これらの殺菌・殺カビ剤に露出された感受性の真菌は、ウリジンをrRNAに組み込む能力の低下を示す。感受性の真菌における成長および発生は、このクラスの殺菌・殺カビ剤への露出により妨げられる。フェニルアミド殺菌・殺カビ剤としては、アシルアラニン、オキサゾリジノンおよびブチロラクトン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。アシルアラニンとしては、ベナラキシル、ベナラキシル-M、フララキシル、メタラキシル、メタラキシル-M(メフェノキサムとしても公知である)が挙げられる。オキサゾリジノンとしてはオキサジキシルが挙げられる。ブチロラクトンとしてはオフレースが挙げられる。

10

【0391】

(b5) 「アミン/モルホリン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード5)は、ステロール生合成経路、⁸ ⁷ イソメラーゼおよび ¹ ⁴ レダクターゼにおける2つの標的部位を阻害する。エルゴステロールなどのステロールは、膜構造および機能のために必要であり、自身を機能性細胞壁の発達のために必須とする。従って、これらの殺菌・殺カビ剤への露出は、感受性の真菌の異常な成長および最終的には死滅をもたらす。アミン/モルホリン殺菌・殺カビ剤(非DMIステロール生合成抑制剤としても公知である)としては、モルホリン、ピペリジンおよびスピロケタール-アミン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。モルホリンとしては、アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフおよびトリモルファミドが挙げられる。ピペリジンとしては、フェンプロピジンおよびピペラリンが挙げられる。スピロケタール-アミンとしてはスピロキサミンが挙げられる。

20

【0392】

(b6) 「リン脂質生合成抑制殺菌・殺カビ剤」(FRACコード6)は、リン脂質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。リン脂質生合成殺菌・殺カビ剤としては、ホスホロチオレートおよびジチオラン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。ホスホロチオレートとしては、エディフェンホス、イプロベンホスおよびピラゾホスが挙げられる。ジチオランとしてはイソプロチオランが挙げられる。

30

【0393】

(b7) 「カルボキサミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコード7)は、は、クレブス回路(TCA回路)における重要な酵素、すなわち、コハク酸塩脱水素酵素を攪乱することにより、複合体II(コハク酸塩脱水素酵素)真菌の呼吸を阻害する。呼吸の阻害は真菌類のATP形成を妨げ、それ故、成長および繁殖を阻害する。カルボキサミド殺菌・殺カビ剤としては、ベンズアミド、フランカルボキサミド、オキサチインカルボキサミド、チアゾールカルボキサミド、ピラゾールカルボキサミドおよびピリジンカルボキサミドが挙げられる。ベンズアミドとしては、ベノダニル、フルトラニルおよびメプロニルが挙げられる。フランカルボキサミドとしてはフェンフラムが挙げられる。オキサチインカルボキサミドとしては、カルボキシシンおよびオキシカルボキシシンが挙げられる。チアゾールカルボキサミドとしてはチフルザミドが挙げられる。ピラゾールカルボキサミドとしては、ピキサフェン、フラメトピル、イソピラザム、フルキサピロキサド、セダキサン(N-[2-(1S,2R)-[1,1'-ビシクロプロピル]-2-イルフェニル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド)およびペンフルフェン(N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(国際公開第2003/010149号パンフレット))が挙げられる。ピリジンカルボキサミドとしてはボスカリドが挙げられ

40

50

る。

【0394】

(b8)「ヒドロキシ(2-アミノ-)ピリミジン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード8)は、アデノシンデアミナーゼに干渉することにより核酸合成を阻害する。例としては、ブピリメート、ジメチリモールおよびエチリモールが挙げられる。

【0395】

(b9)「アニリノピリミジン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード9)は、アミノ酸メチオニンの生合成を阻害すると共に、感染の最中に植物細胞を溶解する加水分解酵素の分泌を攪乱すると提案されている。例としては、シプロジニル、メパニピリムおよびピリメタニルが挙げられる。

10

【0396】

(b10)「N-フェニルカルバメート殺菌・殺カビ剤」(FRACコード10)は、-チュープリンに結合し、微小管会合を攪乱することにより有糸分裂を阻害する。微小管会合の阻害は、細胞分裂、細胞内輸送および細胞構造を攪乱することが可能である。例としては、ジエトフェンカルブが挙げられる。

【0397】

(b11)「キノン外部抑制(QoI)殺菌・殺カビ剤」(FRACコード11)は、ユビキノールオキシダーゼに作用することにより真菌における複合体IIIミトコンドリアの呼吸を阻害する。ユビキノールの酸化は、真菌の内部ミトコンドリア膜内に位置されているチトクロムbc₁複合体の「キノン外部」(Q_o)部位でブロックされる。ミトコンドリアの呼吸の阻害は正常な真菌の成長および発生を妨げる。キノン外部抑制殺菌・殺カビ剤(ストロビルリン殺菌・殺カビ剤としても公知である)としては、メトキシアクリレート、メトキシカルバメート、オキシミノアセテート、オキシミノアセタミド、オキサゾリジンジオン、ジヒドロジオキサジン、イミダゾリノンおよびベンジルカルバメート殺菌・殺カビ剤が挙げられる。メトキシアクリレートとしては、アゾキシストロビン、エネストロビン(SYP-Z071)およびピコキシストロビンが挙げられる。メトキシカルバメートとしては、ピラクロストロビンおよびピラメトストロビンが挙げられる。オキシミノアセテートとしては、クレソキシム-メチル、ピラオキシストロビンおよびトリフロキシストロビンが挙げられる。オキシミノアセタミドとしては、ジモキシストロビン、メトミノストロビン、オリザストロビン、-[メトキシイミノ]-N-メチル-2-[[[1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ]イミノ]-メチル]-ベンゼンアセタミドおよび2-[[[3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-2-プロペン-1-イリデン]-アミノ]オキシ]メチル]--(メトキシイミノ)-N-メチルベンゼンアセタミドが挙げられる。オキサゾリジンジオンとしてはファモキサドンが挙げられる。ジヒドロジオキサジンとしてはフルオキサストロビンが挙げられる。イミダゾリノンとしてはフェンアミドンが挙げられる。ベンジルカルバメートとしてはピリベンカルブが挙げられる。

20

30

【0398】

(b12)「フェニルピロール殺菌・殺カビ剤」(FRACコード12)は、真菌における浸透圧シグナル伝達系に関連するMAPタンパク質キナーゼを阻害する。フェンピクロニルおよびフルジオキサニルがこの殺菌・殺カビ剤クラスの例である。

40

【0399】

(b13)「キノリン殺菌・殺カビ剤」(FRACコード13)は、初期細胞シグナリングにおけるG-タンパク質に作用することによりシグナル伝達を阻害すると提案されている。これらは、ウドンコ病の原因となる真菌における発芽および/または付着器形成に干渉すると見られている。キノキシフェンがこのクラスの殺菌・殺カビ剤の例である。

【0400】

(b14)「脂質過酸化抑制殺菌・殺カビ剤」(FRACコード14)は、真菌における膜合成に作用する脂質過酸化を阻害すると提案されている。エトリジアゾールなどのこのクラスの構成要素はまた、呼吸およびメラニン生合成などの他の生物学的プロセスにも

50

作用し得る。脂質過酸化殺菌・殺カビ剤としては、芳香族炭素および 1, 2, 4 - チアジアゾール殺菌・殺カビ剤が挙げられる。芳香族炭素殺菌・殺カビ剤としては、ピフェニル、クロロネブ、ジクロラン、キントゼン、テクナゼンおよびトルコホス - メチルが挙げられる。1, 2, 4 - チアジアゾール殺菌・殺カビ剤としてはエトリジアゾールが挙げられる。

【0401】

(b15) 「メラニン生合成抑制 - レダクターゼ (M B I - R) 殺菌・殺カビ剤」 (F R A Cコード16.1) は、メラニン生合成におけるナフタル還元 (naphthal reduction) ステップを阻害する。メラニンは、ある種の真菌によって宿主植物感染のために必要とされる。メラニン生合成抑制 - レダクターゼ殺菌・殺カビ剤としては、イソベンゾフラノン、ピロロキノリノンおよびトリアゾロベンゾチアゾール殺菌・殺カビ剤が挙げられる。イソベンゾフラノンとしてはフサライドが挙げられる。ピロロキノリノンとしてはピロキロンが挙げられる。トリアゾロベンゾチアゾールとしてはトリシクラゾールが挙げられる。

10

【0402】

(b16) 「メラニン生合成抑制 - デヒドラターゼ (M B I - D) 殺菌・殺カビ剤」 (F R A Cコード16.2) は、メラニン生合成におけるシタロンデヒドラターゼを阻害する。メラニンは、ある種の真菌によって宿主植物感染のために必要とされる。メラニン生合成抑制 - デヒドラターゼ殺菌・殺カビ剤としては、シクロプロパンカルボキサミド、カルボキサミドおよびプロピオンアミド殺菌・殺カビ剤が挙げられる。シクロプロパンカルボキサミドとしてはカルプロバミドが挙げられる。カルボキサミドとしてはジクロシメットが挙げられる。プロピオンアミドとしてはフェノキサニルが挙げられる。

20

【0403】

(b17) 「ヒドロキシアニリド殺菌・殺カビ剤 (F R A Cコード17) は、ステロール産生に關与する C 4 - デメチラーゼを阻害する。例としては、フェンヘキサミドが挙げられる。

【0404】

(b18) 「スクアレン - エポキシダーゼ抑制殺菌・殺カビ剤」 (F R A Cコード18) は、エルゴステロール生合成経路におけるスクアレン - エポキシダーゼを阻害する。エルゴステロールなどのステロールは、膜構造および機能のために必要であり、自身を機能性細胞壁の発達のために必須とする。従ってこれらの殺菌・殺カビ剤への露出は、感受性の真菌の異常な成長および最終的には死滅をもたらす。スクアレン - エポキシダーゼ抑制殺菌・殺カビ剤としては、チオカルバメートおよびアリルアミン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。チオカルバメートとしてはピリプチカルブが挙げられる。アリルアミンとしては、ナフチフィンおよびテルピナフィンが挙げられる。

30

【0405】

(b19) 「ポリオキシシン殺菌・殺カビ剤」 (F R A Cコード19) は、キチンシンターゼを阻害する。例としてはポリオキシシンが挙げられる。

【0406】

(b20) 「フェニル尿素殺菌・殺カビ剤」 (F R A Cコード20) は、細胞分裂に作用すると提案されている。例としては、ペンシクロンが挙げられる。

40

【0407】

(b21) 「キノン内部抑制 (Q i I) 殺菌・殺カビ剤」 (F R A Cコード21) は、ユビキノールレダクターゼに作用することにより真菌における複合体 I I I ミトコンドリアの呼吸を阻害する。ユビキノールの還元は、真菌の内部ミトコンドリア膜内に位置されているチトクロム b c ₁ 複合体の「キノン内部」 (Q_i) 部位でブロックされる。ミトコンドリアの呼吸の阻害は正常な真菌の成長および発生を妨げる。キノン内部抑制殺菌・殺カビ剤としては、シアノイミダゾールおよびスルファモイルトリアゾール殺菌・殺カビ剤が挙げられる。シアノイミダゾールとしてはシアゾファミドが挙げられる。スルファモイルトリアゾールとしてはアミスルプロムが挙げられる。

50

【0408】

(b22)「ベンズアミド殺菌・殺カビ剤」(FRACコード22)は、 β -チューブリンに結合すると共に微小管会合を攪乱することにより有糸分裂を阻害する。微小管会合の阻害は、細胞分裂、細胞内輸送および細胞構造を攪乱することが可能である。例としては、ゾキサミドが挙げられる。

【0409】

(b23)「エノピラヌロン酸抗生物質殺菌・殺カビ剤」(FRACコード23)は、タンパク質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、プラストサイジン-Sが挙げられる。

【0410】

(b24)「ヘキソピラノシル抗生物質殺菌・殺カビ剤」(FRACコード24)は、タンパク質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、カスガマイシンが挙げられる。

【0411】

(b25)「グルコピラノシル抗生物質：タンパク質合成殺菌・殺カビ剤」(FRACコード25)は、タンパク質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、ストレプトマイシンが挙げられる。

【0412】

(b26)「グルコピラノシル抗生物質：トレハラーゼおよびイノシトール生合成殺菌・殺カビ剤」(FRACコード26)は、イノシトール生合成経路におけるトレハラーゼを阻害する。例としては、バリダマイシンが挙げられる。

【0413】

(b27)「シアノアセタミドオキシム殺菌・殺カビ剤」(FRACコード27)としてはシモキサニルが挙げられる。

【0414】

(b28)「カルバメート殺菌・殺カビ剤」(FRACコード28)は、真菌の成長の多部位抑制剤であるとみなされる。これらは、細胞膜における脂肪酸の合成に干渉し、次いで、細胞膜浸透性を攪乱すると提案されている。プロパマカルブ、塩酸プロパマカルブ、ヨードカルブ、およびプロチオカルブがこの殺菌・殺カビ剤クラスの例である。

【0415】

(b29)「酸化性リン酸化脱共役殺菌・殺カビ剤」(FRACコード29)は、脱共役酸化性リン酸化により真菌の呼吸を阻害する。呼吸の阻害は正常な真菌の成長および発生を妨げる。このクラスは、フルアジナムなどの2,6-ジニトロアニリン、フェリムゾンなどのピリミドンヒドラゾン、ならびに、ジノカップ、メプチルジノカップおよびピナパクリルなどのクロトン酸ジニトロフェニルを含む。

【0416】

(b30)「有機錫殺菌・殺カビ剤」(FRACコード30)は、酸化性リン酸化経路におけるアデノシン三リン酸(ATP)シンターゼを阻害する。例としては、酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズおよびトリフェニルスズヒドロキシドが挙げられる。

【0417】

(b31)「カルボン酸殺菌・殺カビ剤」(FRACコード31)は、デオキシリボ核酸(DNA)トポイソメラーゼタイプII(ギラーゼ)に作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、オキシリン酸が挙げられる。

【0418】

(b32)「芳香族複素環式殺菌・殺カビ剤」(FRACコード32)は、DNA/リボ核酸(RNA)合成に作用すると提案されている。芳香族複素環式殺菌・殺カビ剤としては、イソオキサゾールおよびイソチアゾロン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。イソオキサゾールとしてはヒメキサゾールが挙げられ、ならびに、イソチアゾロンとしてはオクチリノンが挙げられる。

【0419】

10

20

30

40

50

(b 3 3) 「ホスホネート殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード3 3)としては、亜リン酸、および、ホセチル - アルミニウムを含むその種々の塩が挙げられる。

【0 4 2 0】

(b 3 4) 「フタルアミド酸殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード3 4)としてはテクロフタラムが挙げられる。

【0 4 2 1】

(b 3 5) 「ベンゾトリアジン殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード3 5)としてはトリアゾキシドが挙げられる。

【0 4 2 2】

(b 3 6) 「ベンゼン - スルホンアミド殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード3 6)としてはフルスルファミドが挙げられる。

10

【0 4 2 3】

(b 3 7) 「ピリダジノン殺菌・殺カビ剤」(F u n g i c i d e R e s i s t a n c e A c t i o n C o m m i t t e e (F R A C)コード3 7)としてはジクロメジンが挙げられる。

【0 4 2 4】

(b 3 8) 「チオフェン - カルボキサミド殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード3 8)は、A T P産生に作用すると提案されている。例としては、シルチオフアムが挙げられる。

【0 4 2 5】

(b 3 9) 「ピリミジンアミド殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード3 9)は、リン脂質生合成に作用することにより真菌の成長を阻害すると共に、ジフルメトリムを含む。

20

【0 4 2 6】

(b 4 0) 「カルボン酸アミド(C A A)殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード4 0)は、リン脂質生合成および細胞壁沈着を阻害すると提案されている。これらのプロセスの阻害は、成長を妨げて、目標真菌類に死をもたらす。カルボン酸アミド殺菌・殺カビ剤としては、桂皮酸アミド、パリンアミドカルバメートおよびマンデル酸アミド殺菌・殺カビ剤が挙げられる。桂皮酸アミドとしては、ジメトモルフおよびフルモルフが挙げられる。パリンアミドカルバメートとしては、ベンチアパリカルブ、ベンチアパリカルブ - イソプロピル、イプロバリカルブおよびバリフェナレート(バリフェナル)が挙げられる。マンデル酸アミドとしては、マンジプロパミド、N - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピン - 1 - イル] オキシ] - 3 - メトキシフェニル] エチル] - 3 - メチル - 2 - [(メチル - スルホニル) アミノ] - ブタンアミドおよびN - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピン - 1 - イル] オキシ] - 3 - メトキシ - フェニル] エチル] - 3 - メチル - 2 - [(エチルスルホニル) アミノ] ブタンアミドが挙げられる。

30

【0 4 2 7】

(b 4 1) 「テトラサイクリン抗生物質殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード4 1)は、複合体1ニコチンアミドアデニンジヌクレオチド(N A D H)オキシドレダクターゼに作用することにより真菌の成長を阻害する。例としては、オキシテトラサイクリンが挙げられる。

40

【0 4 2 8】

(b 4 2) 「チオカルバメート殺菌・殺カビ剤(b 4 2)」(F R A Cコード4 2)としてはメタスルホカルブが挙げられる。

【0 4 2 9】

(b 4 3) 「ベンズアミド殺菌・殺カビ剤」(F R A Cコード4 3)は、スペクトリン様タンパク質の非局在化により真菌の成長を阻害する。例としては、フルオピコリドおよびフルオピラム(f l u o p y r a m)などのアシルピコリド殺菌・殺カビ剤が挙げられる。

【0 4 3 0】

(b 4 4) 「宿主植物防御誘起殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードP)は、宿主植物防

50

御メカニズムを誘起する。宿主植物防御誘起殺菌・殺カビ剤としては、ベンゾ - チアジアゾール、ベンズイソチアゾールおよびチアジアゾール - カルボキサミド殺菌・殺カビ剤が挙げられる。ベンゾ - チアジアゾールとしてはアシベンゾラル - S - メチルが挙げられる。ベンズイソチアゾールとしてはプロベナゾールが挙げられる。チアジアゾール - カルボキサミドとしてはチアジニルおよびイソチアニルが挙げられる。

【 0 4 3 1 】

(b 4 5) 「多部位接触殺菌・殺カビ剤」は、多数の作用部位を介して真菌の成長を阻害すると共に、接触 / 予防活性を有する。このクラスの殺菌・殺カビ剤としては：(b 4 5 . 1) 「銅殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 1)、(b 4 5 . 2) 「硫黄殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 2)、(b 4 5 . 3) 「ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 3)、(b 4 5 . 4) 「フタルイミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 4)、(b 4 5 . 5) 「クロロニトリル殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 5)、(b 4 5 . 6) 「スルファミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 6)、(b 4 5 . 7) 「グアニジン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 7)、(b 4 5 . 8) 「トリアジン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 8)および(b 4 5 . 9) 「キノン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードM 9)が挙げられる。「銅殺菌・殺カビ剤」は、銅を、典型的には銅 (I I) 酸化状態で含有する無機化合物であり；例としては、ボルドー液 (三塩基性硫酸銅) などの組成物を含む、オキシ塩化銅、硫酸銅および水酸化銅が挙げられる。「硫黄殺菌・殺カビ剤」は、硫黄原子の環または鎖を含有する無機化学物質であり；例としては、元素硫黄が挙げられる。「ジチオカルバメート殺菌・殺カビ剤」は、ジチオカルバメート分子部分を含有し；例としては、マンコゼブ、メチラム、プロピネブ、フェルバム、マンネブ、チラム、ジネブおよびジラムが挙げられる。「フタルイミド殺菌・殺カビ剤」は、フタルイミド分子部分を含有し；例としては、ホルベット、キャプタンおよびカプタホールが挙げられる。「クロロニトリル殺菌・殺カビ剤」は、クロロおよびシアノで置換された芳香族環を含有し；例としては、クロロタロニルが挙げられる。「スルファミド殺菌・殺カビ剤」としては、ジクロフルアニドおよびトリフルアニドが挙げられる。「グアニジン殺菌・殺カビ剤」としては、ドジン、グアザチン、ならびに、イミノクタジンアルベシレートおよびイミノクタジントリアセテートを含むイモクタジン (i m o c t a d i n e) が挙げられる。「トリアジン殺菌・殺カビ剤」としてはアニラジンが挙げられる。「キノン殺菌・殺カビ剤」としてはジチアノンが挙げられる。

【 0 4 3 2 】

(b 4 6) 「クラス (b 1) ~ (b 4 5) の殺菌・殺カビ剤以外の殺菌・殺カビ剤」は、作用機構が未知であり得る一定の殺菌・殺カビ剤を含む。これらとしては：(b 4 6 . 1) 「チアゾールカルボキサミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードU 5)、(b 4 6 . 2) 「フェニル - アセトアミド殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードU 6)、(b 4 6 . 3) 「キナゾリノン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードU 7)および(b 4 6 . 4) 「ベンゾフェノン殺菌・殺カビ剤」(F R A CコードU 8)が挙げられる。チアゾールカルボキサミドとしてはエタボキサムが挙げられる。フェニル - アセトアミドとしては、シフルフェナミドおよびN - [[(シクロプロピルメトキシ) アミノ] [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] - メチレン] ベンゼンアセタミドが挙げられる。キナゾリノンとしては、プロキナジドおよび2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピル - 4 H - 1 - ベンゾピラン - 4 - オンが挙げられる。ベンゾフェノンとしては、メトラフェノンおよびピリオフェノンが挙げられる。(b 4 6) クラスとしてはまた、ベトキサジン、ネオアソジン (メタンアルソン酸第二鉄)、フェンピラザミン、ピロールニトリン、キノメチオネート、テブフロキン、N - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピル - 1 - イル] オキシ] - 3 - メトキシ - フェニル] エチル] - 3 - メチル - 2 - [(メチルスルホニル) アミノ] ブタンアミド、N - [2 - [4 - [[3 - (4 - クロロフェニル) - 2 - プロピル - 1 - イル] オキシ] - 3 - メトキシフェニル] エチル] - 3 - メチル - 2 - [(エチルスルホニル) アミノ] - ブタンアミド、2 - [[2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル] チオ] - 2 - [3 - (2 - メトキシフェニル

) - 2 - チアゾリジニリデン]アセトニトリル、3 - [5 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 - ジメチル - 3 - イソキサゾリジニル]ピリジン、4 - フルオロフェニルN - [1 - [[[1 - (4 - シアノフェニル) エチル] スルホニル] メチル] プロピル] カルバメート、5 - クロロ - 6 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) - 7 - (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン、N - (4 - クロロ - 2 - ニトロフェニル) - N - エチル - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド、N - [[(シクロプロピルメトキシ) - アミノ] - [6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 , 3 - ジフルオロフェニル] メチレン] ベンゼンアセトアミド、N ' - [4 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] - 2 , 5 - ジメチルフェニル] - N - エチル - N - メチルメタンイミド - アミドおよび 1 - [(2 - プロペニルチオ) カルボニル] - 2 - (1 - メチルエチル) - 4 - (2 - メチルフェニル) - 5 - アミノ - 1 H - ピラゾール - 3 - オンが挙げられる。

【 0 4 3 3 】

従って、注目すべきは、成分 (a) として式 1 の化合物 (または、その N - オキシドもしくは塩) と、成分 (b) として、上記のクラス (b 1) ~ (b 4 6) からなる群から選択される少なくとも 1 種の殺菌・殺カビ性化合物とを含む混合物 (すなわち、組成物) である。また、注目すべきは、成分 (b) が、(b 1) ~ (b 4 6) から選択される 2 つの異なる群の各々からの少なくとも 1 種の殺菌・殺カビ剤を含む実施形態である。また、注目すべきは、前記混合物 (殺菌・殺カビ的に有効な量で) を含み、さらに、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分を含む組成物である。特に注目すべきは、式 1 の化合物と、クラス (b 1) ~ (b 4 6) に関連して上記に列挙されている特定の化合物の群から選択される少なくとも 1 種の殺菌・殺カビ性化合物とを含む混合物 (すなわち、組成物) である。また、特に注目すべきは、前記混合物 (殺菌・殺カビ的に有効な量で) を含み、さらに、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の界面活性剤を含む組成物である。

【 0 4 3 4 】

本発明の化合物と共に配合可能である他の生体活性化化合物または薬剤の例は以下のとおりである：アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アセトプロール、アルジカルブ、アミドフルメト (S - 1 9 5 5)、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス - メチル、ピフェントリン、ピフェナゼート、ピストリフルロン、プロフェジン、カルボフラン、カルタップ、キノメチオネート、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロラントラニリプロール (D P X - E 2 Y 4 5)、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、クロロベンジレート、クロマフェノジド、クロチアニジン、シアントラニリプロール (3 - プロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - [(メチルアミノ) - カルボニル] フェニル] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド)、シフルメトフェン、シフルトリン、シフルトリン、シハロトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、シヘキサチン、シベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジコホル、ディルドリン、ジエノクロル、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトキサゾール、フェナミホス、フェナザキン、酸化フェンブタズ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルバリネート、フルフェネリム (U R - 5 0 7 0 1)、フルフェノクスロン、ホノホス、ハロフェノジド、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドラメチルノン、イミシアホス、イミダクロプリド、インドキサカルブ、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノクロトホス、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン (X D E - 0 0 7)、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パ

10

20

30

40

50

ラチオン - メチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロパルギット、プロチオカルブ、プロトリフェンブト、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピリジクロフェン、スピロメシフェン (BSN2060)、スピロテトラマト、スルプロホス、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テルブホス、テトラクロルピンホス、チアクロブリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ - ナトリウム、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルムロンなどの殺虫剤；アルジカルブ、イミシアホス、オキサミルおよびフェナミホス；ストレプトマイシンなどの抗線虫薬などの殺菌剤；アミトラズ、キノメチオネート、クロロベンジレート、シエノピラフェン、シヘキサチン、ジコホル、ジエノクロル、エトキサゾール、フェナザキン、酸化フェンブタズ、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾクス、プロパルギット、ピリダベンおよびテブフェンピラドなどの殺ダニ剤；ならびに、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp.) アイザワイ (*aizawai*)、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp.) クルスターキ (*kurstaki*)、および、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) の被包性デルタエンドキシン (例えば、Cellcap、MPV、MPVII) などの昆虫病原性細菌を含む生物学的薬剤；グリーンムスカリン菌などの昆虫病原性菌；ならびに、HzNPV、AfNPV などのバキュロウイルス、核多核体ウイルス (NPV) を含む昆虫病原性ウイルス；ならびに、CpGV などの顆粒病ウイルス (GV)。

10

20

【0435】

農学的保護剤 (すなわち、殺虫剤、殺菌・殺カビ剤、抗線虫薬、殺ダニ剤、除草剤および生物学的薬剤) に対する一般的な文献としては、The Pesticide Manual, 第13版, C. D. S. Tomlin 編, British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2003年、および、The BioPesticide Manual, 第2版, L. G. Copping 編, British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U. K., 2001年が挙げられる。

30

【0436】

これらの種々の混合パートナーの1種以上が用いられる実施形態については、これらの種々の混合パートナー (合計) 対式1の化合物 (または、N - オキシドもしくは塩) の重量比は、典型的には、約1 : 3000 ~ 約3000 : 1である。注目すべきは、約1 : 300 ~ 約300 : 1の重量比 (例えば、約1 : 30 ~ 約30 : 1の比) である。当業者は、単純な実験を通して、所望の範囲の生物活性に必要な活性成分の生物学的に有効な量を容易に判定することが可能である。これらの追加の成分を包含することで、式1の化合物単独で防除される範囲を超えて、防除される病害の範囲を拡大し得ることが明らかであろう。

40

【0437】

一定の事例においては、本発明の化合物と、他の生体活性 (特に殺菌・殺カビ) 化合物または薬剤 (すなわち、活性成分) との組み合わせは、相加的効果を超える効果 (すなわち、相乗的効果) をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を確保しつつ、環境中に放出される活性成分の量を低減することが常に望ましい。殺菌・殺カビ性活性成分の相乗作用が農業経済学的に十分なレベルの真菌性防除をもたらす施用量で生じる場合、このような組み合わせは、作物生産費用の削減および環境的負荷の低減に有利であることが可能である。

【0438】

本発明の化合物およびその組成物は、有害無脊椎生物に対して有害なタンパク質 (バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエン

50

ドトキシンなど)を発現するよう遺伝的に形質転換された植物に適用することが可能である。外因的に適用された殺菌・殺カビ性化合物の効果は、発現された毒素タンパク質と相乗的であり得る。

【0439】

注目すべきは、式1の化合物(または、そのN-オキシドもしくは塩)と、少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ性活性成分との組み合わせである。特に注目すべきは、他の殺菌・殺カビ性活性成分が、式1の化合物とは異なる作用部位を有するような組み合わせである。一定の事例において、同様の防除範囲を有するが異なる作用部位を有する少なくとも1種の他の殺菌・殺カビ性活性成分との組み合わせが、耐性管理のために特に有利であろう。それ故、本発明の組成物は、同様の防除範囲を有するが異なる作用部位を有する少なくとも1種の追加の殺菌・殺カビ性活性成分を生物学的に有効量でさらに含んでいることが可能である。

10

【0440】

特に注目すべきは、式1の化合物に追加して、(1)アルキレンビス(ジチオカルバメート)殺菌・殺カビ剤；(2)シモキサニル；(3)フェニルアミド殺菌・殺カビ剤；(4)ピリミジノン殺菌・殺カビ剤；(5)クロロタロニル；(6)真菌性ミトコンドリア呼吸系電子移動部位の錯体IIで作用するカルボキサミド；(7)キノキシフェン；(8)メトラフェノンまたはピリオフェノン；(9)シフルフェナミド；(10)シプロジニル；(11)銅化合物；(12)フタルイミド殺菌・殺カビ剤；(13)ホセチル-アルミニウム；(14)ベンズイミダゾール殺菌・殺カビ剤；(15)シアゾファミド；(16)フルアジナム；(17)イプロバリカルブ；(18)プロパモカルブ；(19)バリダマイシン(validomycin)；(20)ジクロロフェニルジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤；(21)ゾキサミド；(22)フルオピコリド；(23)マンジプロパミド；(24)リン脂質生合成および細胞壁沈着に作用するカルボン酸アミド；(25)ジメトモルフ；(26)非DMIステロール生合成抑制剤；(27)ステロール生合成におけるデメチラーゼの抑制剤；(28)bc₁複合体殺菌・殺カビ剤；ならびに、(1)~(28)の化合物の塩からなる群から選択される少なくとも1種の化合物を含む組成物である。

20

【0441】

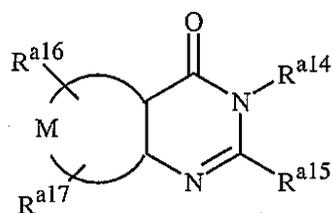
殺菌・殺カビ性化合物のクラスのさらなる記載が以下に提供されている。

30

【0442】

ピリミジノン殺菌・殺カビ剤(群(4))としては、式A1の化合物が挙げられる。

【化39】



A1

40

(式中、Mは縮合フェニル、チオフェンまたはピリジン環を形成し；R^{a14}はC₁~C₆アルキルであり；R^{a15}はC₁~C₆アルキルまたはC₁~C₆アルコキシであり；R^{a16}はハロゲンであり；および、R^{a17}は水素またはハロゲンである。)

【0443】

ピリミジノン殺菌・殺カビ剤は、国際公開第94/26722号パンフレットおよび米国特許第6,066,638号明細書、米国特許第6,245,770号明細書、米国特許第6,262,058号明細書、および、米国特許第6,277,858号明細書に記載されている。注目すべきは、群：6-プロモ-3-プロピル-2-プロピルオキシ-4(3H)-キナゾリノン、6,8-ジヨード-3-プロピル-2-プロピルオキシ-4(

50

3 H) - キナゾリノン、6 - ヨード - 3 - プロピル - 2 - プロピルオキシ - 4 (3 H) - キナゾリノン (プロキナジド)、6 - クロロ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピル - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン、6 - ブロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン、7 - ブロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルチエノ [3 , 2 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン、6 - ブロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピルピリド [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン、6 , 7 - ジブロモ - 2 - プロポキシ - 3 - プロピル - チエノ [3 , 2 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オン、および 3 - (シクロプロピルメチル) - 6 - ヨード - 2 - (プロピルチオ) ピリド - [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 (3 H) - オンから選択されるピリミジノン殺菌・殺力ビ剤である。

10

【 0 4 4 4 】

ステロール生合成抑制剤 (群 (2 7)) は、ステロール生合成経路において酵素を阻害することにより真菌を防除する。デメチラーゼ - 阻害殺菌・殺力ビ剤は、真菌におけるステロールへの前駆体であるラノステロールまたは 2 4 - メチレンジヒドロラノステロールの 1 4 位での脱メチル化の阻害を含む、共通の作用部位を真菌性ステロール生合成経路において有する。この部位で作用する化合物は、度々、デメチラーゼ抑制剤、DMI 殺菌・殺力ビ剤、または DMI と称される。デメチラーゼ酵素は、時々、生化学文献においては、チトクロム P - 4 5 0 (1 4 DM) を含む他の名称で称される。デメチラーゼ酵素は、例えば、J . Biol . Chem . 1 9 9 2 年、2 6 7、1 3 1 7 5 ~ 7 9 ページおよびその中で引用されている文献中に記載されている。DMI 殺菌・殺力ビ剤は、以下の数々の化学的分類に分けられる：アゾール (トリアゾールおよびイミダゾールを含む)、ピリミジン、ピペラジンおよびピリジン。トリアゾールとしては、アザコナゾール、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール (ジニコナゾール - M を含む)、エポキシコナゾール、エタコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、キンコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾールおよびウニコナゾールが挙げられる。イミダゾールとしては、クロトリマゾール、エコナゾール、イマザリル、イソコナゾール、ミコナゾール、オキスポコナゾール、プロクロラズおよびトリフルミゾールが挙げられる。ピリミジンとしては、フェナリモル、ヌアリモルおよびトリアリモルが挙げられる。ピペラジンとしては、トリホリンが挙げられる。ピリジンとしては、プチオベートおよびピリフェノックスが挙げられる。生化学的研究が、上述の殺菌・殺力ビ剤のすべてが、K . H . K u c k r a によって、Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action, H . L y r (編) , Gustav Fischer Verlag : New York , 1 9 9 5 年、2 0 5 ~ 2 5 8 ページに記載の DMI 殺菌・殺力ビ剤であることを示した。

20

30

【 0 4 4 5 】

b c ₁ 複合体殺菌・殺力ビ剤 (群 2 8) は、ミトコンドリア呼吸鎖中の b c ₁ 複合体を阻害する殺菌・殺力ビ性作用機構を有する。b c ₁ 複合体は、度々、生化学文献においては、電子移動鎖およびユビヒドロキノンの複合体 I I I : チトクロム c オキシドレダクターゼを含む他の名称で称される。この複合体は、酵素番号 (Enzyme Commission number) E C 1 . 1 0 . 2 . 2 によって固有に識別される。b c ₁ 複合体は、例えば、J . Biol . Chem . , 1 9 8 9 年、2 6 4 , 1 4 5 4 3 ~ 4 8 ページ ; Methods Enzymol . , 1 9 8 6 年、1 2 6 , 2 5 3 ~ 7 1 ページ ; およびその中で引用されている文献に記載されている。アゾキシストロピン、ジモキシストロピン、エネストロピン (S Y P - Z 0 7 1)、フルオキサストロピン、クレソキシム - メチル、メトミノストロピン、オリザストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピンおよびトリフロキシストロピンなどのストロビルリン殺菌・殺力ビ剤が、この作用機

40

50

構を有することで知られている (H. Sauterら, Angew. Chem. Int. Ed., 1999年, 38, 1328~1349ページ)。ミトコンドリア呼吸鎖における bc_1 複合体を阻害する他の殺菌・殺カビ化合物としては、ファモキサドンおよびフェンアミドンが挙げられる。

【0446】

アルキレンビス(ジチオカルバメート)(群(1))としては、マンコゼブ、マンネブ、プロピネブおよびジネブなどの化合物が挙げられる。フェニルアミド(群(3))としては、メタラキシル、ペナラキシル、フララキシルおよびオキサジキシルなどの化合物が挙げられる。カルボキサミド(群(6))としては、ボスカリド、カルボキシシン、フェンフラム、フルトラニル、フルキサピロキサド、フラメトピル、メプロニル、オキシカルボキシシン、チフルザミド、ペンチオピラドおよびペンフルフェン(N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(国際公開第2003/010149号パンフレット))などの化合物が挙げられ、呼吸系電子移動鎖における複合体II(コハク酸塩脱水素酵素)を攪乱させることによりミトコンドリアの機能を阻害すると知られている。銅化合物(群(11))としては、オキシ塩化銅、硫酸銅および水酸化銅などの化合物が挙げられ、ボルドー液(三塩基性硫酸銅)などの組成物を含む。フタルイミド(群(12))としては、ホルベットおよびキャプタンなどの化合物が挙げられる。ベンズイミダゾール殺菌・殺カビ剤(群(14))としては、ベノミルおよびカルベンダジウムが挙げられる。ジクロロフェニルジカルボキシイミド殺菌・殺カビ剤(群(20))としては、クロゾリネート、ジクロゾリン、イプロジオン、イソパレジオン、ミクロゾリン、プロシミドンおよびピンクロゾリンが挙げられる。

【0447】

非DMIステロール生合成抑制剤(群(26))としては、モルホリンおよびピペリジン殺菌・殺カビ剤が挙げられる。モルホリンおよびピペリジンは、ステロール生合成経路におけるDMIステロール生合成(群(27))によって達成される阻害よりも後の時点のステップを阻害すると示されているステロール生合成抑制剤である。モルホリンとしては、アルジモルフ、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、トリデモルフおよびトリモルフアミドが挙げられる。ピペリジンとしては、フェンプロピジンが挙げられる。

【0448】

成分(b)殺菌・殺カビ剤の例としては、アシベンゾラル-S-メチル、アルジモルフ、アメトクトラジン、アミスルプロム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ペナラキシル、ペナラキシル-M、ベノダニル、ベノミル、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブ-イソプロピル、ベトキサジン、ピナバクリル、ピフェニル、ピテルタノール、ピキサフェン、プラストサイジン-S、ボスカリド、プロムコナゾール、プピリメート、カルボキシシン、カルプロパミド、カプタホール、キャプタン、カルベンダジウム、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネート、クロトリマゾール、ボルドー液(三塩基性硫酸銅)、水酸化銅およびオキシ塩化銅などの銅塩、シアゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、ジノカップ、ジチアノン、ドデモルフ、ドジン、エディフェンホス、エネストロビン、エポキシコナゾール、エタボキサム、エチリモール、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナリモル、フェンプロコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズ、トリフェニルスズヒドロキシド、フェルバム、フェリムゾン、フルアジナム、フルジオキシソニル、フルメトベル(flumetover)、フルモルフ、フルオピコリド(ピコベンズアミド(picobenzamide)としても公知である)、フルオピラム(flupyram)、フルオロイミド、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フ

10

20

30

40

50

ルスルファミド、フルチアニル(2-[[2-フルオロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]チオ]-2-[3-(2-メトキシフェニル)-2-チアゾリジニリデン]アセトニトリル)、フルトラニル、フルトリアホール、フルキサピロキサド、ホルベット、ホセチル-アルミニウム、フベリダゾール、フララキシル、フラメトピル、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、グアザチン、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジン、ヨードカルブ、イブコナゾール、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、クレソキシム-メチル、マンコゼブ、マンジプロパミド、マンネブ、メプロニル、メプチルジノカップ、メタラキシル、メタラキシル-M、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メチラム、メトミノストロピン、メパニピリム、メトラフェノン、ミクロブタニル、ナフチフィン、ネオアソジン(メタンアルソン酸第二鉄)、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、オリザストロピン、オキサジキシル、オキシリン酸、オクスボコナゾール、オキシカルボキシ、オキシテトラサイクリン、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、ペフラゾエート、亜リン酸および塩、フタリド、ピコキシストロピン、ピペラリン、ポリオキシ、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、塩酸プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピラクロストロピン、ピラメトストロピン、ピラオキシストロピン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリプチカルブ、ピリフェノックス、ピリメタニル、ピリオフェノン、ピロキロン、ピロールニトリン、キノメチオネート、キノキシフェン、キントゼン、セダキサン、シルチオファミン、シメコナゾール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム、テクナゼン、テルピナフィン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネート、チオファネート-メチル、チラム、チアジニル、トルコホス-メチル、トリルフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアゾキシド、トリシクラゾール、トリデモルフ、トリフルミゾール、トリシクラゾール、トリフロキシストロピン、トリホリン、トリモルファミド、トリチコナゾール、ウニコナゾール、バリダマイシン、バリフェナレート(バリフェナル)、ピンクロゾリン、ジネブ、ジラム、ゾキサミド、N'-[4-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルメタンイミダミド、5-クロロ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン(BAS600)、ペンフルフェン(N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド)、N-[2-[4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(メチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド、N-[2-[4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(エチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド、2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-1-ベンゾピラン-4-オン、3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチル-3-イソキサゾリジニル]-ピリジン、4-フルオロフェニルN-[1-[[1-(4-シアノフェニル)エチル]スルホニル]メチル]プロピル]カルバメート、N-[[(シクロプロピルメトキシ)アミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2,3-ジフルオロ-フェニル]メチレン]ベンゼンアセタミド、-(メトキシイミノ)-N-メチル-2-[[[1-[3-(トリフルオロ-メチル)フェニル]エトキシ]イミノ]メチル]ベンゼンアセタミド、N'-[4-[4-クロロ-3-(トリフルオロ-メチル)フェノキシ]-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルメタンイミダミド、N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド、2-[[[3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-2-プロペン-1-イリデン]アミノ]オキシ]メチル]--(メトキシイミノ)-N-メチルベンゼンアセトアミド、1-[(2-プロペニルチオ)カルボニル]-2-(1-メチルエチル)-4-(2-メチルフェニル)-5-アミノ-1H-ピラゾール-3-オン、エチル-6-オクチル-[1,2,4]ト

10

20

30

40

50

リアゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミン、ペンチル N - [4 - [[[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニルメチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - チアゾリル] カルバメートおよびペンチル N - [6 - [[[[(1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル) フェニルメチレン] アミノ] オキシ] メチル] - 2 - ピリジニル] - カルバメートが挙げられる。

【 0 4 4 9 】

注目すべきは、式 1 の化合物 (または、その N - オキシもしくは塩) (すなわち、組成物中の成分 (a)) と、アゾキシストロピン、クレソキシム - メチル、トリフロキシストロピン、ピラクロストロピン、ピコキシストロピン、ピラメトストロピン、ピラオキシストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン / フェノミノストロピン、カルベンダジム、クロロタロニル、キノキシフェン、メトラフェノン、シフルフェナミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、ブロムコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、エポキシコナゾール、フェンプロコナゾール、フルシラゾール、フルキサピロキサド、ヘキサコナゾール、イプロコナゾール、メトコナゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピリオフェノン、テブコナゾール、トリチコナゾール、ファモキサドン、プロクロラズ、ペンチオピラドおよびボスカリド (ニコピフェン) (すなわち、組成物中の成分 (b) として) との組み合わせである。

【 0 4 5 0 】

本発明の化合物と、群 : アゾキシストロピン、クレソキシム - メチル、トリフロキシストロピン、ピラクロストロピン、ピコキシストロピン、ピラメトストロピン、ピラオキシストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン / フェノミノストロピン、キノキシフェン、メトラフェノン、シフルフェナミド、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、シプロコナゾール、エポキシコナゾール、フルシラゾール、メトコナゾール、プロピコナゾール、プロキナジド、プロチオコナゾール、ピリオフェノン、テブコナゾール、トリチコナゾール、ファモキサドンおよびペンチオピラドから選択される殺菌・殺カビ剤との混合物が、真菌性植物病原体によって引き起こされる植物病害のより良好な防除 (例えば、より低い使用割合または防除される植物病原体のより幅広い範囲) またはより良好な耐性管理に好ましい。

【 0 4 5 1 】

表 A 1 ~ A 5 4 は、本発明の混合物、組成物および方法を例示する、成分 (b) 化合物と、成分 (a) (化合物番号は索引表 A 中の化合物を参照している) との特定の組み合わせを列挙している。表 A 1 において、行表題「成分 (a)」および「成分 (b)」より下の各列は、化合物 2 2 である成分 (a) と、成分 (b) 殺菌・殺カビ剤との組み合わせ (すなわち、混合物) を特定の開示する。表題の項目「比の例示」は開示の混合物に対する成分 (b) 対成分 (a) の 3 種の特定の重量比を開示している。例えば、表 A 1 の最初の列は、化合物 2 2 とアシベンゾラル - S - メチルとの混合物を開示していると共に、1 : 1、1 : 4 または 1 : 17 のアシベンゾラル - S - メチル対化合物 2 2 の重量比を列挙している。

【 0 4 5 2 】

10

20

30

【表 4 3】

表 A1

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)			
化合物 22	アシベンゾラル-S-メチル	1:1	1:4	1:18	
化合物 22	アルジモルフ	7:1	3:1	1:1	
化合物 22	アメトクトラジン	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	アミスルプロム	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	アニラジン	22:1	8:1	4:1	10
化合物 22	アザコナゾール	2:1	1:2	1:4	
化合物 22	アゾキシストロピン	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	ベナラキシル	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	ベナラキシル-M	1:1	1:3	1:8	
化合物 22	ベノダニル	4:1	2:1	1:2	
化合物 22	ベノミル	11:1	4:1	1:1	
化合物 22	ベンチアバリカルブ	1:1	1:4	1:12	
化合物 22	ベンチアバリカルブ-イソプロピル	1:1	1:4	1:12	
化合物 22	ベトキサジン	15:1	5:1	2:1	20
化合物 22	ピナバクリル	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	ピフェニル	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	ピテルタノール	3:1	1:1	1:2	
化合物 22	ピキサフェン	2:1	1:1	1:3	
化合物 22	プラストサイジン-S	1:4	1:12	1:30	
化合物 22	ポルドー液(三塩基性硫酸銅)	45:1	15:1	5:1	
化合物 22	ポスカリド	4:1	2:1	1:2	
化合物 22	プロムコナゾール	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	プピリメート	1:3	1:10	1:30	30
化合物 22	カブタホール	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	キャプタン	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	カルベンダジム	11:1	4:1	2:1	
化合物 22	カルボキシシ	4:1	2:1	1:2	
化合物 22	カプロバミド	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	クロロネブ	100:1	35:1	14:1	
化合物 22	クロロタロニル	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	クロゾリネート	11:1	4:1	2:1	40
化合物 22	クロトリマゾール	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	水酸化銅	45:1	15:1	5:1	
化合物 22	オキシ塩化銅	45:1	15:1	5:1	
化合物 22	シアゾファミド	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	シフルフェナミド	1:2	1:6	1:24	

【表 4 4】

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)		
化合物 22	シモキサニル	1:1	1:2	1:5
化合物 22	シプロコナゾール	1:1	1:2	1:6
化合物 22	シプロジニル	4:1	2:1	1:2
化合物 22	ジクロフルアニド	15:1	5:1	2:1
化合物 22	ジクロシメット	15:1	5:1	2:1
化合物 22	ジクロメジン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	ジクロラン	15:1	5:1	2:1
化合物 22	ジエトフェンカルブ	7:1	2:1	1:2
化合物 22	ジフェノコナゾール	1:1	1:3	1:12
化合物 22	ジフルメトリン	15:1	5:1	2:1
化合物 22	ジメチリモール	1:3	1:8	1:30
化合物 22	ジメトモルフ	3:1	1:1	1:2
化合物 22	ジモキシストロピン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	ジニコナゾール	1:1	1:3	1:8
化合物 22	ジニコナゾール-M	1:1	1:3	1:12
化合物 22	ジノカップ	2:1	1:1	1:3
化合物 22	ジチアノン	5:1	2:1	1:2
化合物 22	ドデモルフ	7:1	3:1	1:1
化合物 22	ドジン	10:1	4:1	2:1
化合物 22	エディフェンホス	3:1	1:1	1:3
化合物 22	エネストロピン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	エボキシコナゾール	1:1	1:3	1:7
化合物 22	エタボキサム	2:1	1:1	1:3
化合物 22	エチリモール	7:1	3:1	1:1
化合物 22	エトリジアゾール	7:1	2:1	1:2
化合物 22	ファモキサドン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	フェンアミドン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	フェナリモル	1:2	1:7	1:24
化合物 22	フェンブコナゾール	1:1	1:3	1:10
化合物 22	フェンフラム	4:1	1:1	1:2
化合物 22	フェンヘキサミド	10:1	4:1	2:1
化合物 22	フェノキサニル	15:1	4:1	1:1
化合物 22	フェンピクロニル	15:1	5:1	2:1
化合物 22	フェンプロビジン	7:1	2:1	1:1
化合物 22	フェンプロビモルフ	7:1	2:1	1:1
化合物 22	フェンピラザミン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	酢酸トリフェニルスズ、塩化トリフェニルスズまたは トリフェニルスズヒドロキシドなどのフェンチン塩	3:1	1:1	1:3

【 0 4 5 4 】

【表 4 5】

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)			
化合物 22	フェルバム	30:1	10:1	4:1	
化合物 22	フェリムゾン	7:1	2:1	1:2	
化合物 22	フルアジナム	3:1	1:1	1:2	
化合物 22	フルジオキソニル	2:1	1:1	1:4	
化合物 22	フルメトベル(flumetover)	3:1	1:1	1:2	
化合物 22	フルモルフ	3:1	1:1	1:3	10
化合物 22	フルオピコリド	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	フルオピラム(fluopyram)	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	フルオロイミド	37:1	14:1	5:1	
化合物 22	フルオキサストロピン	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	フルキンコナゾール	1:1	1:2	1:4	
化合物 22	フルシラゾール	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	フルスルファミド	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	フルチアニル	1:1	1:2	1:6	20
化合物 22	フルトラニル	4:1	1:1	1:2	
化合物 22	フルトリアホール	1:1	1:2	1:4	
化合物 22	フルキサピロキサド	2:1	1:1	1:3	
化合物 22	ホルベット	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	ホセチル-アルミニウム	30:1	12:1	5:1	
化合物 22	フベリダゾール	11:1	4:1	2:1	
化合物 22	フララキシル	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	フラメトビル	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	グアザチン	15:1	5:1	2:1	30
化合物 22	ヘキサコナゾール	1:1	1:2	1:5	
化合物 22	ヒメキサゾール	75:1	25:1	9:1	
化合物 22	イマザリル	1:1	1:2	1:5	
化合物 22	イミベンコナゾール	1:1	1:2	1:5	
化合物 22	イミノクタジン	15:1	4:1	1:1	
化合物 22	ヨードカルブ	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	イブコナゾール	1:1	1:2	1:5	
化合物 22	イプロベンホス	15:1	5:1	2:1	40
化合物 22	イプロジオン	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	イプロバリカルブ	2:1	1:1	1:3	
化合物 22	イソプロチオラン	45:1	15:1	5:1	
化合物 22	イソピラザム	2:1	1:1	1:3	
化合物 22	イソチアニル	2:1	1:1	1:3	

【 0 4 5 5 】

【表 4 6】

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)			
化合物 22	カスガマイシン	1:2	1:7	1:24	
化合物 22	クレソキシム-メチル	2:1	1:1	1:4	
化合物 22	マンコゼブ	22:1	7:1	3:1	
化合物 22	マンジプロバミド	2:1	1:1	1:4	
化合物 22	マンネブ	22:1	7:1	3:1	
化合物 22	メバニピリム	6:1	2:1	1:1	10
化合物 22	メフロニル	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	メプチルジノカップ	2:1	1:1	1:3	
化合物 22	メタラキシル	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	メタラキシル-M	1:1	1:4	1:12	
化合物 22	メトコナゾール	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	メタスルホカルブ	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	メチラム	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	メトミノストロピン	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	メトラフェノン	2:1	1:1	1:4	20
化合物 22	マイクロブタニル	1:1	1:3	1:8	
化合物 22	ナフチフィン	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	ネオアゾジ(メタンアルノン酸第二鉄)	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	ヌアリモル	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	オクチリノン	15:1	4:1	1:1	
化合物 22	オフレース	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	オリザストロピン	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	オキサジキシル	1:1	1:2	1:6	
化合物 22	オキシリン酸	7:1	2:1	1:2	30
化合物 22	オキシポコナゾール	1:1	1:2	1:5	
化合物 22	オキシカルボキシ	4:1	1:1	1:2	
化合物 22	オキシテトラサイクリン	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	ペフラゾエート	15:1	5:1	2:1	
化合物 22	ベンコナゾール	1:2	1:6	1:15	
化合物 22	ベンシクロン	11:1	4:1	2:1	
化合物 22	ペンチオピラド	2:1	1:1	1:3	
化合物 22	亜リン酸またはその塩	15:1	6:1	2:1	40
化合物 22	フタリド	15:1	6:1	2:1	
化合物 22	ピコキシストロピン	1:1	1:2	1:5	
化合物 22	ピベラリン	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	ポリオキシ	3:1	1:1	1:3	
化合物 22	プロベナゾール	3:1	1:1	1:3	

【 0 4 5 6 】

【表 4 7】

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)		
化合物 22	プロクロラズ	7:1	2:1	1:2
化合物 22	プロシミドン	11:1	4:1	2:1
化合物 22	プロバモカルブまたは塩酸プロバモカルブ	10:1	4:1	2:1
化合物 22	プロピコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	プロピネブ	11:1	4:1	2:1
化合物 22	プロキナジド	1:1	1:3	1:12
化合物 22	プロチオカルブ	3:1	1:1	1:3
化合物 22	プロチオコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	ピラクロストロピン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	ピラメストロピン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	ピラオキシストロピン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	ピラゾホス	15:1	4:1	1:1
化合物 22	ピリベンカルブ	4:1	1:1	1:2
化合物 22	ピリブチカルブ	15:1	4:1	1:1
化合物 22	ピリフェノックス	3:1	1:1	1:3
化合物 22	ピリメタニル	3:1	1:1	1:2
化合物 22	ピリオフェノン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	ピロキロン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	ピロールニトリン	15:1	5:1	2:1
化合物 22	キノメチオネート	15:1	5:1	2:1
化合物 22	キノキシフェン	1:1	1:2	1:6
化合物 22	キントゼン	15:1	5:1	2:1
化合物 22	シルチオフアム	2:1	1:1	1:4
化合物 22	シメコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	スピロキサミン	5:1	2:1	1:2
化合物 22	ストレプトマイシン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	硫黄	75:1	25:1	9:1
化合物 22	テブコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	テブプロキン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	テクロフタラム	15:1	5:1	2:1
化合物 22	テクナゼン	15:1	5:1	2:1
化合物 22	テルピナフィン	15:1	5:1	2:1
化合物 22	テトラコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	チアベンダゾール	11:1	4:1	2:1
化合物 22	チフルザミド	3:1	1:1	1:3
化合物 22	チオフアネート	11:1	4:1	2:1
化合物 22	チオフアネート-メチル	11:1	4:1	2:1

【 0 4 5 7 】

【表 4 8】

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)		
化合物 22	チラム	37:1	14:1	5:1
化合物 22	チアジニル	2:1	1:1	1:3
化合物 22	トルコホス-メチル	37:1	14:1	5:1
化合物 22	トリルフルアニド	15:1	5:1	2:1
化合物 22	トリアジメホン	1:1	1:2	1:5
化合物 22	トリアジメノール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	トリアゾキシド	15:1	5:1	2:1
化合物 22	トリシクラゾール	3:1	1:1	1:3
化合物 22	トリデモルフ	7:1	2:1	1:1
化合物 22	トリフロキシストロピン	2:1	1:1	1:4
化合物 22	トリフルミゾール	3:1	1:1	1:3
化合物 22	トリホリン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	トリモルファミド	7:1	2:1	1:2
化合物 22	トリチコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	ウニコナゾール	1:1	1:2	1:5
化合物 22	バリダマイシン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	バリフェナレート(バリフェナル)	2:1	1:1	1:4
化合物 22	ピンクロノリン	15:1	6:1	2:1
化合物 22	ジネブ	37:1	14:1	5:1
化合物 22	ジラム	37:1	14:1	5:1
化合物 22	ゾキサミド	2:1	1:1	1:4
化合物 22	5-クロロ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン	1:1	1:2	1:6
化合物 22	ペンフルフェン(N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド)	2:1	1:1	1:3
化合物 22	N-[2-[4-[[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(メチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド	2:1	1:1	1:4
化合物 22	N-[2-[4-[[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(エチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド	2:1	1:1	1:4
化合物 22	2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-1-ベンゾピラン-4-オン	1:1	1:3	1:12
化合物 22	3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチル-3-イソキサゾリジニル]ピリジン	3:1	1:1	1:3
化合物 22	4-フルオロフェニル N-[1-[[[1-(4-シアノフェニル)エチル]スルホニル]メチル]プロピル]カルバメート	2:1	1:1	1:4
化合物 22	N-[[[シクロプロピルメトキシ]アミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2,3-ジフルオロフェニル]メチレン]ベンゼンアセトアミド	1:2	1:7	1:24

【 0 4 5 8 】

【表 4 9】

成分 (a)	成分 (b)	比の例示 (*)		
化合物 22	α -[メトキシイミノ]-N-メチル-2-[[[1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ]イミノ]メチル]-ベンゼンアセタミド	3:1	1:1	1:3
化合物 22	N'-[4-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルメタンイミダミド	3:1	1:1	1:3
化合物 22	N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド	3:1	1:1	1:3
化合物 22	2-[[[3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-2-プロペン-1-イリデン]アミノ]オキシ]メチル]- α -(メトキシイミノ)-N-メチルベンゼンアセタミド	3:1	1:1	1:3
化合物 22	ペンチル N-[4-[[[[[1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)フェニル-メチレン]アミノ]オキシ]メチル]-2-チアゾリル]カルバメート	3:1	1:1	1:3
化合物 22	ペンチル N-[6-[[[[[1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)フェニル-メチレン]アミノ]オキシ]メチル]-2-ピリジニル]カルバメート	3:1	1:1	1:3

(*) 重量基準での成分 (a) に対する成分 (b) の比

【 0 4 5 9 】

表 A 2 ~ A 5 4 は、各々、「成分 (a)」行表題より下の記載事項が、それぞれ、以下に示されている成分 (a) 行記載事項で置き換えられていること以外は、上記表 A 1 と同じく構成されている。それ故、例えば、表 A 2 において、「成分 (a)」行表題より下の記載事項はすべて「化合物 1 8」を引用しており、および表 A 2 中の行表題より下の最初の列は、化合物 1 8 とアシベンゾラル - S - メチルとの混合物を特定の開示している。表 A 3 ~ A 5 4 も同様に構成されている。

【 0 4 6 0 】

【表 5 0】

表番号	成分 (a) カラム項目	表番号	成分 (a) カラム項目
A2	化合物 18	A29	化合物 351
A3	化合物 23	A30	化合物 352
A4	化合物 24	A31	化合物 357
A5	化合物 36	A32	化合物 358
A6	化合物 41	A33	化合物 360
A7	化合物 45	A34	化合物 361
A8	化合物 87	A35	化合物 364
A9	化合物 91	A36	化合物 365
A10	化合物 118	A37	化合物 367
A11	化合物 139	A38	化合物 368
A12	化合物 148	A39	化合物 369
A13	化合物 172	A40	化合物 372
A14	化合物 175	A41	化合物 373
A15	化合物 193	A42	化合物 374
A16	化合物 232	A43	化合物 375
A17	化合物 265	A44	化合物 376
A18	化合物 266	A45	化合物 377
A19	化合物 284	A46	化合物 378
A20	化合物 286	A47	化合物 379
A21	化合物 287	A48	化合物 380
A22	化合物 292	A49	化合物 381
A23	化合物 297	A50	化合物 382
A24	化合物 332	A51	化合物 383
A25	化合物 336	A52	化合物 384
A26	化合物 343	A53	化合物 385
A27	化合物 346	A54	化合物 386
A28	化合物 349		

【 0 4 6 1 】

表 B 1 は、本発明の混合物、組成物および方法を例示する成分 (b) 化合物と成分 (a) との特定の組み合わせを列挙する。表 B 1 の第 1 の行は、特定の成分 (b) 化合物を列挙する (例えば、最初の列中の「アシベンゾラル - S - メチル」)。表 B 1 の第 2、第 3 および第 4 の行は、成分 (a) を基準として、野外に生育する作物に対して成分 (b) 化合物が典型的に適用される量の重量比の範囲を列挙する (例えば、重量基準で、成分 (a) を基準としてアシベンゾラル - S - メチルの「 2 : 1 ~ 1 : 1 8 0 」)。それ故、例えば、表 B 1 の最初のラインに特定の開示されているアシベンゾラル - S - メチルと成分 (a) との組み合わせは、典型的には、 2 : 1 ~ 1 : 1 8 0 の質量比で施用される。表 B 1 の残りの列は同様に構成されているべきである。表 B 1 は、それ故、これらの組み合わせについて、比の範囲で表 A 1 ~ A 5 4 中に開示されている特定の比を補っている。

【 0 4 6 2 】

【表 5 1】

表 B1

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
アシベンゾラル-S-メチル	2:1 ~ 1:180	1:1 ~ 1:60	1:1 ~ 1:18
アルジモルフ	30:1 ~ 1:3	10:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:1
アメトクトラジン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
アミスルプロム	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
アニラジン	90:1 ~ 2:1	30:1 ~ 4:1	22:1 ~ 4:1
アザコナゾール	7:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
アゾキシストロビン	9:1 ~ 1:12	3:1 ~ 1:4	3:1 ~ 1:3
ベナラキシル	4:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
ベナラキシル-M	4:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:8

【 0 4 6 3 】

【表 5 2】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
ベノダニル	18:1 ~ 1:6	6:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
ベノミル	45:1 ~ 1:4	15:1 ~ 1:1	11:1 ~ 1:1
ベンチアバリカルブまたは ベンチアバリカルブ-イソプロピル	2:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:12
ベトキサジン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ピナバクリル	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ピフェニル	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ピテルタノール	15:1 ~ 1:5	5:1 ~ 1:2	3:1 ~ 1:2
ピキサフェン	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
プラストサイジン-S	3:1 ~ 1:90	1:1 ~ 1:30	1:4 ~ 1:30
ボスカリド	18:1 ~ 1:6	6:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
プロムコナゾール	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ブピリメート	3:1 ~ 1:90	1:1 ~ 1:30	1:3 ~ 1:30
カプタホール	90:1 ~ 1:4	30:1 ~ 1:2	15:1 ~ 2:1
キャプタン	90:1 ~ 1:4	30:1 ~ 1:2	15:1 ~ 2:1
カルベンダジム	45:1 ~ 1:4	15:1 ~ 1:2	11:1 ~ 2:1
カルボキシシ	18:1 ~ 1:6	6:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
カプロバミド	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
クロロネブ	300:1 ~ 2:1	100:1 ~ 4:1	100:1 ~ 14:1
クロロタロニル	90:1 ~ 1:4	30:1 ~ 1:2	15:1 ~ 2:1
クロソリネート	45:1 ~ 1:2	15:1 ~ 2:1	11:1 ~ 2:1
クロトリマゾール	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ボルドー液(三塩基性硫酸銅)、オキシ塩化銅、 硫酸銅および水酸化銅などの銅塩	450:1 ~ 1:1	150:1 ~ 4:1	45:1 ~ 5:1
シアノファミド	4:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
シフルフェナミド	1:1 ~ 1:90	1:2 ~ 1:30	1:2 ~ 1:24
シモキサニル	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:5
シプロコナゾール	4:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
シプロジニル	22:1 ~ 1:9	7:1 ~ 1:3	4:1 ~ 1:2
ジクロフルアニド	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ジクロシメット	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ジクロメジン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ジクロラン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1

【 0 4 6 4 】

【表 5 3】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
ジエトフェンカルブ	22:1 ~ 1:9	7:1 ~ 1:3	7:1 ~ 1:2
ジフェノコナゾール	4:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:12
ジフルメトリン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ジメチリモール	3:1 ~ 1:90	1:1 ~ 1:30	1:3 ~ 1:30
ジメトモルフ	9:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:2	3:1 ~ 1:2
ジモキシストロビン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
ジニコナゾール	3:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:8
ジニコナゾール M	3:1 ~ 1:90	1:1 ~ 1:30	1:1 ~ 1:12
ジノカップ	7:1 ~ 1:9	2:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
ジチアノン	15:1 ~ 1:4	5:1 ~ 1:2	5:1 ~ 1:2
ドデモルフ	30:1 ~ 1:3	10:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:1
ドジン	30:1 ~ 1:2	10:1 ~ 2:1	10:1 ~ 2:1
エディフェンホス	30:1 ~ 1:9	10:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
エネストロビン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
エポキシコナゾール	3:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:7
エタボキサム	7:1 ~ 1:9	2:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
エチリモール	30:1 ~ 1:3	10:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:1
エトリジアゾール	30:1 ~ 1:9	10:1 ~ 1:3	7:1 ~ 1:2
ファモキサドン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
フェンアミドン	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
フェナリモル	3:1 ~ 1:90	1:1 ~ 1:30	1:2 ~ 1:24
フェンブコナゾール	3:1 ~ 1:30	1:1 ~ 1:10	1:1 ~ 1:10
フェンフラム	18:1 ~ 1:6	6:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
フェンヘキサミド	30:1 ~ 1:2	10:1 ~ 2:1	10:1 ~ 2:1
フェノキサニル	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 1:1
フェンピクロニル	75:1 ~ 1:9	25:1 ~ 1:3	15:1 ~ 2:1
フェンプロピジン	30:1 ~ 1:3	10:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:1
フェンプロピモルフ	30:1 ~ 1:3	10:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:1
フェンピラザミン	100:1 ~ 1:100	10:1 ~ 1:10	3:1 ~ 1:3
酢酸塩、塩化物または水酸化物などの フェンチン塩	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
フェルバム	300:1 ~ 1:2	100:1 ~ 2:1	30:1 ~ 4:1
フェリムゾン	30:1 ~ 1:5	10:1 ~ 1:2	7:1 ~ 1:2
フルアジナム	22:1 ~ 1:5	7:1 ~ 1:2	3:1 ~ 1:2
フルジオキシニル	7:1 ~ 1:12	2:1 ~ 1:4	2:1 ~ 1:4

【 0 4 6 5 】

【表 5 4】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
フルメトベル(flumetover)	9:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:2	3:1 ~ 1:2
フルモルフ	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
フルオピコリド	3:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
フルオピラム(fluopyram)	15:1 ~ 1:90	5:1 ~ 1:30	3:1 ~ 1:3
フルオロミド	150:1 ~ 2:1	50:1 ~ 4:1	37:1 ~ 5:1
フルオキサストロピン	4:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
フルキンコナゾール	4:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:4	1:1 ~ 1:4
フルシラゾール	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
フルスルフアミド	90:1 ~ 1:2	30:1 ~ 2:1	15:1 ~ 2:1
フルチアニル	7:1 ~ 1:36	2:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:6
フルトラニル	18:1 ~ 1:6	6:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
フルトリアホール	4:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:4	1:1 ~ 1:4
フルキサピロキサド	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
ホルベット	90:1 ~ 1:4	30:1 ~ 1:2	15:1 ~ 2:1
ホセチルーアルミニウム	225:1 ~ 2:1	75:1 ~ 5:1	30:1 ~ 5:1
フベリダゾール	45:1 ~ 1:4	15:1 ~ 1:2	11:1 ~ 2:1
フララキシル	15:1 ~ 1:45	5:1 ~ 1:15	1:1 ~ 1:6
フラメトビル	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
グアザチンまたはイミノクタジン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ヘキサコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
ヒメキサゾール	225:1 ~ 2:1	75:1 ~ 4:1	75:1 ~ 9:1
イマザリル	7:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:5
イミベンコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
ヨードカルブ	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
イブコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
イプロベンホス	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
イプロジオン	120:1 ~ 1:2	40:1 ~ 2:1	15:1 ~ 2:1
イプロバリカルブ	9:1 ~ 1:9	3:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
イソプロチオラン	150:1 ~ 2:1	50:1 ~ 4:1	45:1 ~ 5:1
イソピラザム	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
イソチアニル	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
カスガマイシン	7:1 ~ 1:90	2:1 ~ 1:30	1:2 ~ 1:24
クレソキシム-メチル	7:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
マンコゼブ	180:1 ~ 1:3	60:1 ~ 2:1	22:1 ~ 3:1
マンジプロバミド	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4

【表 5 5】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
マンネブ	180:1 ~ 1:3	60:1 ~ 2:1	22:1 ~ 3:1
メバニピリム	18:1 ~ 1:3	6:1 ~ 1:1	6:1 ~ 1:1
メプロニル	7:1 ~ 1:36	2:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:6
メプチルジノカブ	7:1 ~ 1:9	2:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
メタラキシル	15:1 ~ 1:45	5:1 ~ 1:15	1:1 ~ 1:6
メタラキシル-M	7:1 ~ 1:90	2:1 ~ 1:30	1:1 ~ 1:12
メトコナゾール	3:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
メタスルホカルブ	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 1:1
メチラム	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 1:1
メトミノストロピン	9:1 ~ 1:12	3:1 ~ 1:4	3:1 ~ 1:3
メトラフェノン	6:1 ~ 1:12	2:1 ~ 1:4	2:1 ~ 1:4
ミクロブタニル	5:1 ~ 1:26	1:1 ~ 1:9	1:1 ~ 1:8
ナフチフィン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ネオアゾジン(メタンアルソニック第二鉄)	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ヌアリモル	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
オクチリノン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 1:1
オプレーズ	15:1 ~ 1:45	5:1 ~ 1:15	1:1 ~ 1:6
オリザストロピン	9:1 ~ 1:12	3:1 ~ 1:4	3:1 ~ 1:3
オキサジキシル	15:1 ~ 1:45	5:1 ~ 1:15	1:1 ~ 1:6
オキシリン酸	30:1 ~ 1:9	10:1 ~ 1:3	7:1 ~ 1:2
オキシポコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
オキシカルボキシシン	18:1 ~ 1:6	6:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
オキシテトラサイクリン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ペフラゾエート	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ペンコナゾール	1:1 ~ 1:45	1:2 ~ 1:15	1:2 ~ 1:15
ペンシクロン	150:1 ~ 1:2	50:1 ~ 2:1	11:1 ~ 2:1
ベンチオピラド	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
亜リン酸およびその塩	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
フタリド	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
ピコキシストロピン	7:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:5
ピベラリン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ポリオキシシン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
プロベナゾール	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
プロクロラズ	22:1 ~ 1:4	7:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:2

10

20

30

40

【 0 4 6 7 】

【表 5 6】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
プロバモカルブまたは塩酸プロバモカルブ	30:1 ~ 1:2	10:1 ~ 2:1	10:1 ~ 2:1
プロピコナゾール	4:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:5
プロピネブ	45:1 ~ 1:2	15:1 ~ 2:1	11:1 ~ 2:1
プロキナジド	3:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:12
プロチオカルブ	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
プロチオコナゾール	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:5
ピラクロストロピン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
ピラメストロピン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
ピラオキシストロピン	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
ピラゾホス	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 1:1
ピリベンカルブ	15:1 ~ 1:6	5:1 ~ 1:2	4:1 ~ 1:2
ピリフェノックス	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ピリメタニル	30:1 ~ 1:6	10:1 ~ 1:2	3:1 ~ 1:2
ピリオフェノン	6:1 ~ 1:12	2:1 ~ 1:4	2:1 ~ 1:4
ピロキロン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
ピロールニトリン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
キンメチオネート	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
キノキシフェン	4:1 ~ 1:18	1:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:6
キントゼン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
シルチオファミ	7:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
シメコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
スピロキサミン	22:1 ~ 1:4	7:1 ~ 1:2	5:1 ~ 1:2
ストレプトマイシン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
硫黄	300:1 ~ 3:1	100:1 ~ 9:1	75:1 ~ 9:1
テブコナゾール	7:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	1:1 ~ 1:5
テブフロキン	100:1 ~ 1:100	10:1 ~ 1:10	3:1 ~ 1:3
テクロフタラム	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
テクナゼン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
テルピナフィン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
テトラコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
チアベンダゾール	45:1 ~ 1:4	15:1 ~ 1:2	11:1 ~ 2:1
チフルザミド	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
チオファネート	45:1 ~ 1:3	15:1 ~ 2:1	11:1 ~ 2:1
チオファネート-メチル	45:1 ~ 1:3	15:1 ~ 2:1	11:1 ~ 2:1

【 0 4 6 8 】

【表 5 7】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
チラム	150:1 ~ 1:2	50:1 ~ 2:1	37:1 ~ 5:1
チアジニル	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
トルコホス-メチル	150:1 ~ 1:2	50:1 ~ 2:1	37:1 ~ 5:1
トリルフルアニド	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
トリアジメホン	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
トリアジメノール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
トリアゾキシド	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	15:1 ~ 2:1
トリシクテゾール	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
トリデモルフ	30:1 ~ 1:3	10:1 ~ 1:1	7:1 ~ 1:1
トリフロキシストロピン	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
トリフルミゾール	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
トリホリン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3
トリモルファミド	45:1 ~ 1:9	15:1 ~ 1:3	7:1 ~ 1:2
トリチコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
ウニコナゾール	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:5
バリダマイシン	150:1 ~ 1:36	50:1 ~ 1:12	3:1 ~ 1:3
バリフェナレート(バリフェナル)	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
ピンクロゾリン	120:1 ~ 1:2	40:1 ~ 2:1	15:1 ~ 2:1
ジネブ	150:1 ~ 1:2	50:1 ~ 2:1	37:1 ~ 5:1
ジラム	150:1 ~ 1:2	50:1 ~ 2:1	37:1 ~ 5:1
ゾキサミド	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
5-クロロ-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン	15:1 ~ 1:36	5:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:6
ベンフルフェン(N-[2-(1,3-ジメチルブチル)フェニル]-5-フルオロ-1,3-ジメチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド)	12:1 ~ 1:9	4:1 ~ 1:3	2:1 ~ 1:3
N-[2-[4-[[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(メチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
N-[2-[4-[[3-(4-クロロフェニル)-2-プロピン-1-イル]オキシ]-3-メトキシフェニル]エチル]-3-メチル-2-[(エチルスルホニル)アミノ]ブタンアミド	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
2-プトキシ-6-ヨード-3-プロピル-4H-1-ベンゾピラン-4-オン	3:1 ~ 1:36	1:1 ~ 1:12	1:1 ~ 1:12
3-[5-(4-クロロフェニル)-2,3-ジメチル-3-イソキサゾリジニル]ピリジン	15:1 ~ 1:9	5:1 ~ 1:3	3:1 ~ 1:3

【表 5 8】

成分 (b)	典型的な 重量比	より典型的な 重量比	最も典型的な 重量比
4-フルオロフェニル N-[1-[[[1-(4-シアノフェニル)エチル]スルホニル]メチル]プロピル]カルバメート	6:1 ~ 1:18	2:1 ~ 1:6	2:1 ~ 1:4
N-[[[シクロプロピルメトキシ]アミノ][6-(ジフルオロメトキシ)-2,3-ジフルオロフェニル]メチレン]ベンゼン-アセトアミド	1:1 ~ 1:90	1:2 ~ 1:30	1:2 ~ 1:24
α -[メトキシイミノ]-N-メチル-2-[[[1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エトキシ]イミノ]-メチル]-ベンゼンアセタミド	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
N'-[4-[4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)フェノキシ]-2,5-ジメチルフェニル]-N-エチル-N-メチルメタンイミダミド	15:1 ~ 1:18	5:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
N-(4-クロロ-2-ニトロフェニル)-N-エチル-4-メチルベンゼンスルホンアミド	15:1 ~ 1:18	5:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
2-[[[3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-2-プロペン-1-イリデン]アミノ]オキシ]メチル]- α -(メトキシイミノ)-N-メチルベンゼンアセタミド	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
ベンチル N-[4-[[[[[1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル]フェニルメチレン]アミノ]オキシ]メチル]-2-チアゾリル]カルバメート	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3
ベンチル N-[6-[[[[[1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル]フェニルメチレン]アミノ]オキシ]メチル]-2-ピリジニル]カルバメート	9:1 ~ 1:18	3:1 ~ 1:6	3:1 ~ 1:3

10

20

【0470】

既述のとおり、本発明は、成分 (a) および (b) を含む組成物において、成分 (b) が、(b1) ~ (b46) から選択される2つの群の各々からの少なくとも1種の殺菌・殺カビ剤を含む実施形態を含む。表 C 1 ~ C 5 4 は、特定の混合物 (化合物番号は索引表 A 中の化合物を参照している) を列挙して、成分 (b) が、(b1) ~ (b46) から選択される2つの群の各々からの少なくとも1種の殺菌・殺カビ剤を含む実施形態を例示している。表 C 1 において、行表題「成分 (a)」および「成分 (b)」の下の各列は、化合物 2 2 である成分 (a) と、少なくとも2種の成分 (b) 殺菌・殺カビ剤との混合物を特定的に開示している。表題の項目「比の例示」は開示の混合物に対するシーケンスにおける成分 (a) 对各成分 (b) 殺菌・殺カビ剤の3種の特定の重量比を開示している。例えば、最初の列は、化合物 2 2 とシプロコナゾールおよびアゾキシストロピンとの混合物を開示しており、1:1:1、2:1:1 または 3:1:1 の化合物 2 2 対シプロコナゾール対アゾキシストロピンの重量比を列挙している。

30

40

【0471】

【表 5 9】

表 C1

成分 (a)	成分(b)	比の例示 (*)
化合物 22	シプロコナゾール アゾキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール クレソキシム-メチル	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール ピコキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール ピラクロストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール トリフロキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール ビキサフェン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール ボスカリド	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール シフルフェナミド	1:2:1 2:2:1 3:2:1
化合物 22	シプロコナゾール フルオピラム	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール イソピラザム	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール メトラフェノン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール ベンチオピラド	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール プロキナジド	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール キノキシフェン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	シプロコナゾール セダキサン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	シプロコナゾール ピコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1
化合物 22	シプロコナゾール トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール アゾキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール クレソキシム-メチル	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール ピコキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール ピラクロストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール トリフロキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール ビキサフェン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール ボスカリド	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール シフルフェナミド	1:2:1 2:2:1 3:2:1
化合物 22	ジフェンコナゾール フルオピラム	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール イソピラザム	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール メトラフェノン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール ベンチオピラド	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール プロキナジド	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール キノキシフェン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	ジフェンコナゾール セダキサン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	ジフェンコナゾール ピコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1

10

20

30

40

【表 6 0】

成分 (a)	成分(b)	比の例示 (*)		
化合物 22	ジフェンコナゾール トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール アゾキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール クレソキシム-メチル	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール ビコキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール ビラクロストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール トリフロキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール ビキサフェン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール ボスカリド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール シフルフェナミド	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 22	エボキシコナゾール フルオピラム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール イソピラザム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール メトラフェノン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール ベンチオピラド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール プロキナジド	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール キノキシフェン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール セダキサン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	エボキシコナゾール ビコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	エボキシコナゾール トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	メトコナゾール アゾキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール クレソキシム-メチル	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール ビコキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール ビラクロストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール トリフロキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール ビキサフェン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール ボスカリド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール シフルフェナミド	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 22	メトコナゾール フルオピラム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール イソピラザム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール メトラフェノン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール ベンチオピラド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール プロキナジド	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール キノキシフェン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	メトコナゾール セダキサン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	メトコナゾール ビコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	メトコナゾール トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	ミクロブタニル アゾキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1

【表 6 1】

成分 (a)	成分(b)	比の例示 (*)		
化合物 22	マイクロブタニル クレソキシム-メチル	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	マイクロブタニル ビコキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	マイクロブタニル ビラクロストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	マイクロブタニル トリフロキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	マイクロブタニル ビキサフェン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル ボスカリド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル シフルフェナミド	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 22	マイクロブタニル フルオピラム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル イソピラザム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル メトラフェノン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル ベンチオピラド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル プロキナジド	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	マイクロブタニル キノキシフェン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	マイクロブタニル セダキサン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	マイクロブタニル ビコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	マイクロブタニル トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール アゾキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール クレソキシム-メチル	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール ビコキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール ビラクロストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール トリフロキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール ビキサフェン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール ボスカリド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール シフルフェナミド	1:2:1	2:2:1	3:2:1
化合物 22	プロチオコナゾール フルオピラム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール イソピラザム	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール メトラフェノン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール ベンチオピラド	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール プロキナジド	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール キノキシフェン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール セダキサン	1:1:2	2:1:2	3:1:2
化合物 22	プロチオコナゾール ビコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	プロチオコナゾール トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
化合物 22	テブコナゾール アゾキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	テブコナゾール クレソキシム-メチル	1:1:1	2:1:1	3:1:1
化合物 22	テブコナゾール ビコキシストロピン	1:1:1	2:1:1	3:1:1

【 0 4 7 4 】

【表 6 2】

成分 (a)	成分(b)	比の例示(*)
化合物 22	テブコナゾール ピラクロストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	テブコナゾール トリフロキシストロピン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	テブコナゾール ビキサフェン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール ボスカリド	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール シフルフェナミド	1:2:1 2:2:1 3:2:1
化合物 22	テブコナゾール フルオピラム	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール イソピラザム	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール メトラフェノン	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール ベンチオピラド	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール プロキナジド	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	テブコナゾール キノキシフェン	1:1:1 2:1:1 3:1:1
化合物 22	テブコナゾール セダキサシ	1:1:2 2:1:2 3:1:2
化合物 22	テブコナゾール ピコキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1
化合物 22	テブコナゾール トリフロキシストロピン プロキナジド	1:1:1:1 2:1:1:1 3:1:1:1

(*) 重量基準でのシーケンスにおける成分(b)に対する成分(a)の比

【 0 4 7 5 】

表 C 2 ~ C 5 4 は、各々、「成分 (a) 」行表題より下の記載事項が、それぞれ、以下に示されている成分 (a) 行記載事項で置き換えられていること以外は上記表 C 1 と同じく構成されている。それ故、例えば、表 C 2 において、「成分 (a) 」行表題より下の記載事項はすべて「化合物 1 8 」を引用しており、表 C 2 中の行表題の下の最初の列は、化合物 1 8 と、シプロコナゾールおよびアゾキシストロピンとの混合物、および、化合物 1 8 : シプロコナゾール : アゾキシストロピンの 1 : 1 : 1、2 : 1 : 1 および 3 : 1 : 1 の例示的な重量比を特定的に開示している。表 C 3 ~ C 5 4 も同様に構成されている。

【 0 4 7 6 】

10

20

30

【表 6 3】

表番号	成分 (a) カラム項目	表番号	成分 (a) カラム項目	
C2	化合物 18	C29	化合物 351	
C3	化合物 23	C30	化合物 352	
C4	化合物 24	C31	化合物 357	
C5	化合物 36	C32	化合物 358	
C6	化合物 41	C33	化合物 360	
C7	化合物 45	C34	化合物 361	10
C8	化合物 87	C35	化合物 364	
C9	化合物 91	C36	化合物 365	
C10	化合物 118	C37	化合物 367	
C11	化合物 139	C38	化合物 368	
C12	化合物 148	C39	化合物 369	
C13	化合物 172	C40	化合物 372	
C14	化合物 175	C41	化合物 373	
C15	化合物 193	C42	化合物 374	20
C16	化合物 232	C43	化合物 375	
C17	化合物 265	C44	化合物 376	
C18	化合物 266	C45	化合物 377	
C19	化合物 284	C46	化合物 378	
C20	化合物 286	C47	化合物 379	
C21	化合物 287	C48	化合物 380	
C22	化合物 292	C49	化合物 381	
C23	化合物 297	C50	化合物 382	
C24	化合物 332	C51	化合物 383	30
C25	化合物 336	C52	化合物 384	
C26	化合物 343	C53	化合物 385	
C27	化合物 346	C54	化合物 386	
C28	化合物 349			

【0477】

発明の概要において記載されているとおり、本発明の一態様は、式1の化合物、そのN-オキシドまたは塩と、少なくとも1種の有害無脊椎生物防除化合物または薬剤（例えば、殺虫剤、殺ダニ剤）とを含む組成物（すなわち、混合物または組み合わせ）である。注目すべきは、成分（a）と、少なくとも1種（すなわち、1種以上）の有害無脊椎生物防除化合物または薬剤とを含み、次いで、その後、成分（b）と組み合わせられて、成分（a）および（b）および1種以上の有害無脊椎生物防除化合物または薬剤を含む組成物を提供することが可能である組成物である。あるいは、最初に成分（b）と混合することなく、成分（a）と少なくとも1種の有害無脊椎生物防除剤とを含む生物学的に有効量の組成物を、（直接的に、または、植物もしくは植物種子の環境を通して）植物または植物種子に適用されて、植物または植物種子を真菌性病原体によって引き起こされる病害および有害無脊椎生物により引き起こされる被害から保護することが可能である。

【0478】

1種以上の有害無脊椎生物防除化合物が用いられる実施形態について、これらの化合物

40

50

(合計)対成分(a)化合物の重量比は、典型的には、約1:3000~約3000:1である。注目すべきは、約1:300~約300:1(例えば、約1:30~約30:1の比)の重量比である。当業者は、単純な実験を通して、所望の範囲の生物活性のために必要な活性成分の生物学的に有効な量を容易に判定することが可能である。

【0479】

注目すべきは、成分(a)化合物に追加して、単独で、または、殺菌・殺カビ成分(b)との組み合わせで、アバメクチン、アセフェート、アセタミプリド、アセトプロール、アルジカルブ、アミドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス-メチル、ピフェントリン、ピフェナゼート、ピストリフルロン、プロプロフェジン、カルボフラン、カルタップ、キノメチオネート、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロラントラニリプロール、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クロロベンジレート、クロマフェノジド、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シフルメトフェン、シフルトリン、シフルトリン、シハロトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、シヘキサチン、シベルメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジコホル、ディルドリン、ジエノクロル、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトキサゾール、フェナミホス、フェナザキン、酸化フェンブタズ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、フェンバレレート、フィプロニル、フロニカミド、フルベンジアミド、フルシトリネート、フルバリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、ホノホス、ハロフェノジド、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾクス、ヒドラメチルノン、イミシアホス、イミダクロプリド、インドキサカルブ、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メベルフルトリン、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノクロトホス、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオン-メチル、ベルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロバルギット、プロトリフェンプト、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピリジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフロル、スルプロホス、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テルブホス、テトラクロルピンホス、テトラメチルフルトリン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルムロン、パチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp.)アイザワイ(*aizawai*)、パチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp.)クルスターキ(*kurstaki*)、核多核体ウイルス、パチルスチューリングゲンシス(*Bacillus thuringiensis*)の被包性デルタエンドトキシン、バキュロウイルス、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウイルス、および、昆虫病原性菌からなる群から選択される少なくとも1種の有害無脊椎生物防除化合物または薬剤を含む本発明の組成物である。

【0480】

一定の事例においては、式1の化合物またはそのN-オキシドもしくは塩(すなわち、成分(a))と、単独で、または、殺菌・殺カビ成分(b)との混合物で、他の生体活性(特に有害無脊椎生物防除)化合物または薬剤(すなわち、活性成分)との組み合わせは、相加的効果を超越する効果(すなわち、相乗的効果)をもたらすことが可能である。効果的な有害生物の防除を確保しつつ、環境中に放出される活性成分の量を低減することが常に望ましい。有害無脊椎生物の相乗作用が農業経済学的に十分なレベルの真菌性防除をもたらす施用量で生じる場合、このような組み合わせは、作物生産費用の削減および環境的負荷の低減に有利であることが可能である。

10

20

30

40

50

【 0 4 8 1 】

表 D 1 は、本発明によるこれらの活性成分を含む混合物および組成物、ならびに、これらを用いる方法を例示する、有害無脊椎生物防除剤と、成分 (a) 化合物としての化合物 2 2 (索引表 A 中に識別されている) との特定の組み合わせを列挙する。表 D 1 の第 2 行は、特定の有害無脊椎生物防除剤 (例えば、最初の列においては「アバメクチン」) を列挙する。表 D 1 の第 3 行は、有害無脊椎生物防除剤の作用機構 (公知であれば) または化学的区分を列挙する。表 D 1 の第 4 行は、化合物 2 2 単独、または、殺菌・殺力ビ成分 (b) との組み合わせを基準として、有害無脊椎生物防除剤が典型的に適用される量に対する重量比の範囲の実施形態を列挙する (例えば、重量基準で化合物 2 2 に対してアバメクチンの「 5 0 : 1 ~ 1 : 5 0 」) 。それ故、例えば、表 D 1 の最初のラインに特定的に開示されている、化合物 2 2 とアバメクチンと組み合わせ、典型的には、 5 0 : 1 ~ 1 : 5 0 の質量比で施用される。表 D 1 の残りの列は同様に構成されているべきである。

10

【 0 4 8 2 】

【表 6 4】

表 D1

成分 (a)	有害無脊椎生物 防除剤	作用機構または 化学的区分	典型的な 重量比
化合物 22	アバメクチン	大環式ラクトン	50:1 ~ 1:50
化合物 22	アセタミプリド	ネオニコチノイド	150:1 ~ 1:200
化合物 22	アミトラズ	オクトパミン受容体リガンド	200:1 ~ 1:100
化合物 22	アベルメクチン	大環式ラクトン	50:1 ~ 1:50
化合物 22	アザジラクチン	エクジソンアゴニスト	100:1 ~ 1:120
化合物 22	β-シフルトリン	ナトリウムチャネル修飾因子	150:1 ~ 1:200
化合物 22	ピフェントリン	ナトリウムチャネル修飾因子	100:1 ~ 1:10
化合物 22	プロプロフェジン	キチン合成抑制剤	500:1 ~ 1:50
化合物 22	カルタップ	ネライストキシン類似体	100:1 ~ 1:200
化合物 22	クロラントラニリプロール	リアノジン受容体リガンド	100:1 ~ 1:120
化合物 22	クロルフェナビル	ミトコンドリア電子送達抑制剤	300:1 ~ 1:200
化合物 22	クロルピリホス	コリンエステラーゼ阻害剤	500:1 ~ 1:200
化合物 22	クロチアニジン	ネオニコチノイド	100:1 ~ 1:400
化合物 22	シアントラニリプロール	リアノジン受容体リガンド	100:1 ~ 1:120
化合物 22	シフルトリン	ナトリウムチャネル修飾因子	150:1 ~ 1:200
化合物 22	シハロトリン	ナトリウムチャネル修飾因子	150:1 ~ 1:200
化合物 22	シベルメトリン	ナトリウムチャネル修飾因子	150:1 ~ 1:200
化合物 22	シロマジン	キチン合成抑制剤	400:1 ~ 1:50
化合物 22	デルタメトリン	ナトリウムチャネル修飾因子	50:1 ~ 1:400
化合物 22	ディルドリン	シクロジエン殺虫剤	200:1 ~ 1:100
化合物 22	ジノテフラン	ネオニコチノイド	150:1 ~ 1:200
化合物 22	ジオフェノラン	脱皮阻害剤	150:1 ~ 1:200
化合物 22	エマメクチン	大環式ラクトン	50:1 ~ 1:10
化合物 22	エンドスルファン	シクロジエン殺虫剤	200:1 ~ 1:100

20

30

40

【 0 4 8 3 】

【表 6 5】

成分 (a)	有害無脊椎生物 防除剤	作用機構または 化学的区分	典型的な 重量比
化合物 22	エスフェンバレレート	ナトリウムチャンネル修飾因子	100:1 ~ 1:400
化合物 22	エチプロール	GABA-調節塩素イオンチャンネル遮断剤	200:1 ~ 1:100
化合物 22	フェノチオカルブ		150:1 ~ 1:200
化合物 22	フェノキシカルブ	幼虫ホルモン模倣物	500:1 ~ 1:100
化合物 22	フェンバレレート	ナトリウムチャンネル修飾因子	150:1 ~ 1:200
化合物 22	フィプロニル	GABA-調節塩素イオンチャンネル遮断剤	150:1 ~ 1:100
化合物 22	フロニカミド		200:1 ~ 1:100
化合物 22	フルベンジアミド	リアノジン受容体リガンド	100:1 ~ 1:120
化合物 22	フルフェノクスロン	キチン合成抑制剤	200:1 ~ 1:100
化合物 22	ヘキサフルムロン	キチン合成抑制剤	300:1 ~ 1:50
化合物 22	ヒドラメチルノン	ミトコンドリア電子送達抑制剤	150:1 ~ 1:250
化合物 22	イミダクロプリド	ネオニコチノイド	1000:1 ~ 1:1000
化合物 22	インドキサカルブ	ナトリウムチャンネル修飾因子	200:1 ~ 1:50
化合物 22	ラムダ-シハロトリン	ナトリウムチャンネル修飾因子	50:1 ~ 1:250
化合物 22	ルフェヌロン	キチン合成抑制剤	500:1 ~ 1:250
化合物 22	メベルフルトリン	ナトリウムチャンネル修飾因子	100:1 ~ 1:400
化合物 22	メタフルミノン		200:1 ~ 1:200
化合物 22	メソミル	コリンエステラーゼ阻害剤	500:1 ~ 1:100
化合物 22	メトブレン	幼虫ホルモン模倣物	500:1 ~ 1:100
化合物 22	メトキシフェノジド	エクシソニアゴニスト	50:1 ~ 1:50
化合物 22	ニテンピラム	ネオニコチノイド	150:1 ~ 1:200
化合物 22	ニチアジン	ネオニコチノイド	150:1 ~ 1:200
化合物 22	ノバルロン	キチン合成抑制剤	500:1 ~ 1:150
化合物 22	オキサミル	コリンエステラーゼ阻害剤	200:1 ~ 1:200
化合物 22	ピメトロジン		200:1 ~ 1:100
化合物 22	ピレトリン	ナトリウムチャンネル修飾因子	100:1 ~ 1:10
化合物 22	ピリダベン	ミトコンドリア電子送達抑制剤	200:1 ~ 1:100
化合物 22	ピリダリル		200:1 ~ 1:100
化合物 22	ピリプロキシフェン	幼虫ホルモン模倣物	500:1 ~ 1:100
化合物 22	リアノジン	リアノジン受容体リガンド	100:1 ~ 1:120
化合物 22	スピネトラム	大環式ラクトン	150:1 ~ 1:100

10

20

30

40

【 0 4 8 4 】

【表 6 6】

成分 (a)	有害無脊椎生物 防除剤	作用機構または 化学的区分	典型的な 重量比
化合物 22	スピノサド	大環式ラクトン	500:1 ~ 1:10
化合物 22	スピロジクロフェン	脂質生合成抑制剤	200:1 ~ 1:200
化合物 22	スピロメシフェン	脂質生合成抑制剤	200:1 ~ 1:200
化合物 22	スルホキサフロル		200:1 ~ 1:200
化合物 22	テブフェノジド	エクジソンアゴニスト	500:1 ~ 1:250
化合物 22	テトラメチルフルトリン	ナトリウムチャンネル修飾因子	100:1 ~ 1:400
化合物 22	チアクロプリド	ネオニコチノイド	100:1 ~ 1:200
化合物 22	チアマトキサム	ネオニコチノイド	1250:1 ~ 1:1000
化合物 22	チオジカルブ	コリンエステラーゼ阻害剤	500:1 ~ 1:400
化合物 22	チオスルタップ-ナトリウム		150:1 ~ 1:100
化合物 22	トラロメトリン	ナトリウムチャンネル修飾因子	150:1 ~ 1:200
化合物 22	トリアザメート	コリンエステラーゼ阻害剤	250:1 ~ 1:100
化合物 22	トリフルムロン	キチン合成抑制剤	200:1 ~ 1:100
化合物 22	パチルスチューリンゲンシス	生物学的薬剤	50:1 ~ 1:10
化合物 22	パチルスチューリンゲンシス デルタエンドトキシン	生物学的薬剤	50:1 ~ 1:10
化合物 22	NPV (例えば、Gemstar)	生物学的薬剤	50:1 ~ 1:10

10

20

【0485】

表 D 2 ~ D 5 4 は、「成分 (a)」行表題より下の記載事項が、それぞれ、以下に示されている成分 (a) 行記載事項で置き換えられていること以外、各々、上記表 D 1 と同じく構成されている。それ故、例えば、表 D 2 において、「成分 (a)」行表題より下の記載事項はすべて「化合物 1 8」を引用しており、および表 D 2 中の行表題の下の最初の列は、化合物 1 8 とアバメクチンとの混合物を特定の開示している。表 D 3 ~ D 5 4 も同様に構成されている。

30

【0486】

【表 6 7】

表番号	成分 (a) カラム項目	表番号	成分 (a) カラム項目	
D2	化合物 18	D29	化合物 351	
D3	化合物 23	D30	化合物 352	
D4	化合物 24	D31	化合物 357	
D5	化合物 36	D32	化合物 358	
D6	化合物 41	D33	化合物 360	
D7	化合物 45	D34	化合物 361	10
D8	化合物 87	D35	化合物 364	
D9	化合物 91	D35	化合物 365	
D10	化合物 118	D37	化合物 367	
D11	化合物 139	D38	化合物 368	
D12	化合物 148	D39	化合物 369	
D13	化合物 172	D40	化合物 372	
D14	化合物 175	D41	化合物 373	
D15	化合物 193	D42	化合物 374	
D16	化合物 232	D43	化合物 375	20
D17	化合物 265	D44	化合物 376	
D18	化合物 266	D45	化合物 377	
D19	化合物 284	D46	化合物 378	
D20	化合物 286	D47	化合物 379	
D21	化合物 287	D48	化合物 380	
D22	化合物 292	D49	化合物 381	
D23	化合物 297	D50	化合物 382	
D24	化合物 332	D51	化合物 383	30
D25	化合物 336	D52	化合物 384	
D26	化合物 343	D53	化合物 385	
D27	化合物 346	D54	化合物 386	
D28	化合物 349			

【 0 4 8 7 】

式 1 の化合物（および、その N - オキシドおよび塩）と混合される有害無脊椎生物防除剤（例えば、殺虫剤および殺ダニ剤）の一実施形態としては、ピフェントリン、シベルメトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、シフルトリン、 β - シフルトリン、デルタメトリン、ジメフルトリン、エスフェンバレレート、フェンバレレート、インドキサカルブ、メトフルトリン、プロフルトリン、ピレトリンおよびトラロメトリンなどのナトリウムチャンネル修飾因子；クオルピリホス、メソミル、オキサミル、チオジカルブおよびトリアザメートなどのコリンエステラーゼ阻害剤；アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロプリドおよびチアメトキサムなどのネオニコチノイド；スピネトラム、スピノサド、アバメクチン、アベルメクチンおよびエマメクチンなどの殺虫性大環式ラクトン；エンドスルファン、エチプロールおよびフィプロニルなどの GABA（ γ - アミノ酪酸） - 調節塩素イオンチャンネル遮断剤；プロロフェジン、シロマジン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノピフルムロンおよびトリフルムロンなどのキチン合成抑制剤；ジオフェノラン、フェノキシカルブ、メトプレンおよびピリプロキシフェンなどの幼虫ホルモン

模倣物；アミトラスなどのオクトパミン受容体リガンド；アザジラクチン、メトキシフェノジドおよびテブフェノジドなどのエクジソンアゴニスト；リアノジンなどのリアノジン受容体リガンド、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびフルベンジアミドなどのアントラニルジアミド；カルタップなどのネライストキシン類似体；クロルフェナピル、ヒドラメチルノンおよびピリダベンなどのミトコンドリア電子送達抑制剤；スピロジクロフェンおよびスピロメシフェンなどの脂質生合成抑制剤；ディルドリンなどのシクロジエン殺虫剤；シフルメトフェン；フェノチオカルブ；フロニカミド；メタフルミゾン；ピラフルプロール；ピリダリル；ピリプロール；ピメトロジン；スピロテトラマト；ならびに、チオスルタップ - ナトリウムが挙げられる。成分 (a) の化合物と混合される生物学的薬剤の一実施形態としては、H z N P V および A f N P V などの核多核体ウイルス；バチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*)、ならびに、Cellcap、MPV および MPV II などのバチルスチューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) の被包性デルタエンドトキシン；ならびに、バキュロウイルス科 (*Baculoviridae*) の構成種、ならびに、食中性真菌を含む天然および遺伝子操作されたウイルス性殺虫剤が挙げられる。注目すべきは、成分 (a) と、上記表 D 1 に列挙されている有害無脊椎生物防除剤から選択される少なくとも 1 種の追加の生体活性化合物または薬剤とを含む組成物である。

10

【0488】

以下の試験は、特定の病原体に対する本発明の化合物の防除効力を実証する。しかしながら、化合物によって得られる病原体防除はこれらの種に限定されない。化合物の説明については索引表 A を参照のこと。以下の略語が以下の索引表において用いられている：Me はメチルであり、Ph はフェニルであり、OMe はメトキシであり、-CN はシアノであり、-NO₂ はニトロである。また、「ピリジン - 2 - イル」は、「2 - ピリジニル」と同義であり、「ピリジン - 3 - イル」は「3 - ピリジニル」と同義であり、および、「ピリミジン - 5 - イル」は「5 - ピリミジニル」と同義である。略記「Ex .」は「実施例」を意味し、化合物がどの実施例において調製されたかを示す数が続いている。「Compound No .」は、化合物番号を意味する。質量分析スペクトル (M . S .) は、大気圧化学イオン化 (A P⁺) を用いた質量分光測定によって観察される、分子への H⁺ (1 の分子量) の添加により形成される最も高い同位体存在度親イオン (M + 1) の分子量として報告されている。

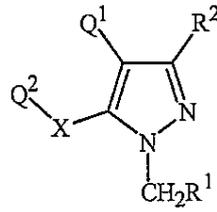
20

30

【0489】

【表 6 8】

索引表 A



Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
1 (Ex 1)	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	3-Cl-Ph	NH	**
2	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	3,5-ジ-OMe-Ph	NH	360
3	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	3-Cl-Ph	NMe	*
4	H	Me	4-Cl-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	334
5	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-ジ-F-Ph	NH	334
6	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-ジ-F-Ph	NMe	348
7	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	369
8	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-Ph	NH	334
9	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-ジ-F-Ph	NH	352
10	H	Me	4-Cl-Ph	2,3,5-トリ-F-Ph	NH	352

10

20

【 0 4 9 0 】

【表 6 9】

Cmpd		R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
No							
11	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	NH	334	
12	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-Ph	NH	334	
13	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	352	
14	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	370	
15	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	347	10
16	H	Me	3,5-ジ-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	359	
17 (Ex 2)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	**	
18	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	370	
19	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	350	
20	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-NO ₂ -Ph	O	380	
21	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	O	365	
22	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	NH	364	
23	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	366	20
24 (Ex 3)	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	**	
25	H	Me	3-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	364	
26	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-NO ₂ -Ph	O	364	
27	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Cl-Ph	O	353	
28	H	Me	4-Cl-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	352	
29	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	364	
30	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-CF ₃ -Ph	O	455	
31	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	380	30
32	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2-Cl-4-NO ₂ -Ph	O	398	
33	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	334	
34	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	6-Cl-ピリジン-3-イル	NH	365	
35	H	Me	3,4-ジ-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	354	
36	H	Me	3,4-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	366	
37	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	3,5-ジ-OMe-Ph	NH	360	
38	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	O	387	
39	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	5-Cl-ピリジン-2-イル	O	354	40
40	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	O	399	
41	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	354	
42	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	366	

【 0 4 9 1 】

【表 70】

Cmpd	No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
	43	H	Me	3-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	344	
	44	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	360	
	45 (Ex 4)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	**	
	46	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	374	
	47	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	5-Cl-ピリジン-2-イル	O	366	10
	48	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3,4-ジ-F-Ph	NH	366	
	49	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	382	
	50	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Me-Ph	NH	344	
	51	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,4-ジ-OMe-Ph	NH	390	
	52	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl-4-NO ₂ -Ph	O	358	
	53	Ph	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-NO ₂ -Ph	O	476	
	54 (Ex 8)	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-NO ₂ -Ph	O	**	20
	55	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	O	343	
	56	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	328	
	57	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,4-ジ-OMe-Ph	NH	392	
	58 (Ex 10)	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-Cl-Ph	O	**	
	59	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,4-ジ-OMe-6-Cl-Ph	NH	424	
	60	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	362	
	61	Me	Me	4-Cl-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	348	
	62	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	398	30
	63	Me	Me	2,6-ジ-F-Ph	3,5-ジ-OMe-Ph	NH	374	
	64	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	O	388	
	65	-CO ₂ Et	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F, 4-NO ₂ -Ph	O	472	
	66	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	5-Me-ピリジン-2-イル	NH	345	
	67	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	5-CN-ピリジン-2-イル	NH	342	
	68	-CO ₂ H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-NO ₂ -Ph	O	444	
	69 (Ex 5)	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	**	40
	70	Me	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	382	
	71	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-(NHC(O)Me)-Ph	O	392	
	72	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	3,4-ジ-OMe-Ph	NH	360	
	73	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	387	

【 0 4 9 2 】

【表 7 1】

Cmpd		R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
No							
74	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	3,4-ジ-OMe-Ph	NH	392	
75	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	386	
76	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	6-Cl-ピリジン-3-イル	NH	331	
77	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-NH ₂ -Ph	O	382	
78	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	384	10
79	H	Me	4-Me-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	332	
80	H	Me	4-Me-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	344	
81	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	5-Cl-2,4-ジ-OMe-Ph	NH	424	
82	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	391	
83	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	396	
84	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-Ph	O	367	
85	H	Me	3,5-ジ-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	386	20
86	H	Me	6-Cl-ピリジン-3-イル	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	361	
87	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	382	
88	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-F-2-Me-Ph	NH	362	
89	H	Me	4-F-2-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	374	
90	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Br-2,6-ジ-F-Ph	O	447	
91	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	377	
92	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	379	
93	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3,4-ジ-OMe-Ph	NH	378	30
94	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	6-OMe-ピリジン-3-イル	NH	349	
95	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	6-OMe-ピリジン-3-イル	NH	361	
96	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	362	
97	H	Me	4-F-2-Me-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	358	
98	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	378	
99	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,5-ジ-F-4-CN-Ph	O	380	
100	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	5-Cl-2,4-ジ-OMe-Ph	NH	412	
101	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	386	40
102	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	398	
103	H	Me	2,6-ジ-F-4-OH-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	352	
104	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	382	

【 0 4 9 3 】

【表 7 2】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
105	H	Me	2,6-ジ-F-4-OS(O) ₂ CF ₃ -Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	484	
106	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	361	
107	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-ピリジン-3-イル	NH	386	
108	H	<i>c</i> -Pr	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	378	10
109	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	NH	355	
110	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-Cl-Ph	NH	***	
111	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	NH	***	
112	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***	
113	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	3-F-4-OMe-Ph	NH	***	
114	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	3,4-ジ-F-Ph	NH	***	
115	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	3-Cl-Ph	NH	***	
116	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-5-CN-Ph	O	360	20
117	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	389	
118	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360	
119	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-NO ₂ -Ph	O	396	
120	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	361	
121	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-NO ₂ -Ph	O	398	
122	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-NO ₂ -Ph	O	380	
123	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	3,4-ジ-Cl-Ph	NH	***	
124	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-Me-Ph	NH	***	30
125	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-Cl-3-F-Ph	NH	***	
126	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-OMe-Ph	NH	***	
127	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-F-3-OMe-Ph	NH	373	
128	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	NH	367	
129	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	***	
130	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	***	
131	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-F-4-NO ₂ -Ph	O	***	40
132	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4,5-トリ-F-Ph	NH	370	
133	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	***	
134	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	***	
135	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-Me-4-NO ₂ -Ph	O	***	

【 0 4 9 4 】

【表 7 3】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
136	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	3-F-Ph	NH	***	
137	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,5-ジ-F-Ph	NH	***	
138	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,4,5-トリ-F-Ph	NH	***	
139	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	376	10
140	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	392	
141	H	Me	2,6-ジ-F-4-OEt-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	380	
142	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	5-Cl-2-F-Ph	NH	***	
143	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	***	
144	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	***	
145	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,3-ジ-F-Ph	NH	***	
146	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,5-ジ-Cl-Ph	NH	***	
147	H	Me	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	2,3-ジ-Cl-Ph	NH	***	20
148	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-ジ-F-4-CN-Ph	O	378	
149	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-CN-Ph	O	360	
150	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-ジ-CN-Ph	O	401	
151	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-OMe-4-NO ₂ -Ph	O	***	
152	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	383	
153	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	429	
154	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	NH	353	
155	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	390	30
156	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-CN-4-NO ₂ -Ph	O	***	
157	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	***	
158	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NEt	410	
159	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NCH ₂ CH=CH ₂	422	
160	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	364	
161	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	364	
162	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	375	
163	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2-Cl-4,5-ジ-CN-Ph	O	403	40
164	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***	
165	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***	
166	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	429	

【 0 4 9 5 】

【表 7 4】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
167	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,3,5-トリ-F-Ph	O	373	
168	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4-ジ-CN-Ph	O	367	
169	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3,4-ジ-CN-Ph	O	369	
170	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	362	10
171	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-トリ-F-Ph	NH	370	
172	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	352	
173	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-ジ-F-Ph	NH	352	
174	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,3,6-トリ-F-Ph	NH	382	
175	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368	
176	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,5-ジ-F-Ph	NH	364	
177	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	352	
178	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	***	20
179	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	NH	***	
180	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***	
181	H	Me	2-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	318	
182	H	Me	2-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	336	
183	H	Me	2-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	348	
184	H	Me	2-F-Ph	4-F-Ph	NH	300	
185	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	379	30
186	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***	
187	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-F-4-Me-Ph	O	***	
188	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Me-Ph	O	363	
189	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	O	354	
190	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	382	
191	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	369	
192	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	377	
193	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368	40
194	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-F-Ph	NH	***	
195	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	***	
196	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	343	
197	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,5-ジ-F-Ph	NH	***	

【 0 4 9 6 】

【表 7 5】

Cmpd		R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	MS	
No								
198	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,3-ジ-F-Ph	NH	***		
199	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	4-F-2-OMe-Ph	NH	***		
200	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	3-OMe-Ph	NH	***		
201	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***		
202	H	Me	2,3-ジ-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	336	10	
203	H	Me	2,3-ジ-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	354		
204	H	Me	2,3-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	366		
205	H	Me	2,3-ジ-F-Ph	4-F-Ph	NH	318		
206	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	365		
207	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***		
208	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	2,4-ジ-F-Ph	CHOH	381		
209	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3,4-ジ-Me-Ph	O	***	20	
210	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3,4-ジ-Me-Ph	O	***		
211	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***		
212	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	***		
213	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-OMe-Ph	O	349		
214	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,3-ジ-F-Ph	NH	***		
215	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***		
216	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***		
217	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***	30	
218	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***		
219	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-Me-Ph	O	333		
220	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-Me-Ph	O	345		
221	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-OMe-Ph	O	361		
222	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-CN-Ph	O	344		
223	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-CN-Ph	O	356		
224	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***		
225	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***	40	
226	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,5-ジ-F-Ph	NH	***		
227	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***		
228	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***		

【 0 4 9 7 】

【表 7 6】

Cmpd		R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
No								
229	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4,5-トリ-F-Ph	NH	***		
230	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	336		
231	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,3-ジ-Cl-Ph	NH	***		
232	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	423		
233	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,5-ジ-F-4-CN-Ph	O	423	10	
234	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-3-CN-Ph	NH	359		
235	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	375		
236	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	384		
237	H	Me	2-CF ₃ -Ph	4-F-Ph	NH	350		
238	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	368		
239	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	386		
240	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	398	20	
241	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-Cl-ピリジン-2-イル	NH	353		
242	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***		
243	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	NH	***		
244	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***		
245	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,5-ジ-Cl-Ph	NH	***		
246	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	***		
247	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	***		
248	H	Me	2-Br-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	398	30	
249	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***		
250	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***		
251	H	Me	2-CF ₃ -Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	401		
252	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	387		
253	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	402		
254	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	4-F-Ph	NH	368		
255	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	368		
256	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	***	40	
257	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	***		
258	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***		
259	H	Me	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***		

【 0 4 9 8 】

【表 7 7】

Cmpd		R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
No								
260	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-F-5-CF ₃ -ピリジン-2-イル	O	449		
261	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-Cl-5-CF ₃ -ピリジン-2-イル	O	465		
262	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	404		
263	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2,6-ジ-F-4-OMe-Ph	NH	416		
264	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	NH	387	10	
265	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	413		
266	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	415		
267	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	399		
268	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-ピリミジン-5-イル	NH	***		
269	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Me-ピリミジン-5-イル	NH	***		
270	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	ピリミジン-5-イル	NH	***		
271	H	Me	2-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***	20	
272	H	Me	2-Br-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
273	H	Me	2,3-ジ-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
274	H	Me	2,3-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
275	H	Me	2,5-ジ-Cl-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
276	H	Me	2-Cl-5-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
277	H	Me	2-Cl-5-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
278	H	Me	2-F-5-OMe-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***		
279	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	NH	353	30	
280	H	Me	2-CF ₃ -Ph	3,5-ジ-F-ピリジン-2-イル	NH	369		
281	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***		
282	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	NH	397		
283	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	NH	386		
284	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	406		
285	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	422		
286	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	NH	386		
287	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	386	40	
288	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	346		
289	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***		
290	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	***		

【 0 4 9 9 】

【表 7 8】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
291	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	***
292	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	431
293	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NMe	***
294	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NEt	***
295	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	430
296	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-OMe-Ph	NH	413
297	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	370
298	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	386
299	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	NH	383
300	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NH	***
301	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	***
302	H	Me	2,3-ジ-Cl-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	368
303	H	Me	2,3-ジ-Cl-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	400
304	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NS(O) ₂ Me	***
305	H	Me	2-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***
306	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***
307	H	Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***
308	H	Me	2-Cl-ピリジン-3-イル	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***
309	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NCH ₂ OMe	***
310	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	372
311	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	388
312	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	398
313	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	458
314	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	414
315	H	Me	2-Cl-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	334
316	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-F-Ph	NH	448
317	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	392
318	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	433
319	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	418
320	H	Me	2-Cl-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	368
321	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	369

10

20

30

40

【 0 5 0 0 】

【表 7 9】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S	
322	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	380	
323	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-OMe-Ph	NH	459	
324	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	425	
325	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OEt-Ph	NH	394	
326	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	NCH ₂ CN	409	10
327	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	2,4-ジ-Cl-Ph	NH	***	
328	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	3,5-ジ-Cl-ピリジン-2-イル	NH	369	
329	H	Me	2,5-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	O	***	
330	H	Me	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-CN-Ph	NH	395	
331	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	359	
332	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	393	
333	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***	20
334	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***	
335	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	359	
336	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	NH	393	
337	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	4-F-Ph	NH	***	
338	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	375	
339	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	***	
340	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	***	
341	H	Me	2,6-ジ-Cl-Ph	2,6-ジ-Cl-4-F-Ph	NH	***	30
342	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360	
343	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	369	
344	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-NO ₂ -Ph	NH	380	
345	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-5-NO ₂ -Ph	NH	380	
346	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	398	
347	H	Me	4-Cl-2-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360	
348	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Br-6-Cl-4-F-Ph	NH	432	
349	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	NH	370	40
350	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	CHOH	349	
351 (Ex 6)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	CHOH	**	
352	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	CHOH	383	

【 0 5 0 1 】

【表 80】

Cmpd		R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	MS	
No								
353	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	***		
354	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***		
355	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***		
356	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-トリ-F-Ph	CHOH	385		
357	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	NH	370		10
358	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	360		
359	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	376		
360	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	NH	432		
361	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344		
362	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	394		
363	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2,6-ジ-Cl-4-F-Ph	NH	***		
364	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-F-Ph	NH	416		
365	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-F-Ph	NH	432		20
366	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	414		
367	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-Cl-6-F-Ph	NH	402		
368	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-F-Ph	NH			
369	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-F-Ph	NH			
370 (Ex 7)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	C(=O)	**		
371 (Ex 9)	H	Me	2,4,6-トリ-F-Ph	2,6-ジ-F-4-NH ₂ -Ph	O	**		
372	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Br-4-CN-Ph	O			30
373	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O			
374	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4-ジ-Cl-6-F-Ph	NH	386		
375	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2,6-ジ-Cl-4-F-Ph	NH			
376	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Br-4,6-ジ-F-Ph	NH	416		
377	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-ジ-F-Ph	NH	432		
378	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-F-Ph	NH			
379	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	2-Br-4,6-ジ-F-Ph	NH			
380	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Br-4,6-ジ-F-Ph	NH			40
381	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-ジ-F-4-Cl-Ph	CHOH	402		
382	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH			
383	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2,6-ジ-F-4-Cl-Ph	NH			

【0502】

【表 8 1】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	MS	
384	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	CHOH		
385	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	CHOH		
386	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	CHOH		
387	H	Me	2-Cl-4-OH-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	350	
388	H	Me	2-Cl-4-OCH ₂ CN-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	389	10
389	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Br-4-F-Ph	NH	396	
390	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-Cl-Ph	NH	448	
391	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	2-Cl-4,6-ジ-F-Ph	NH	***	
392	H	Me	2,4-ジ-Cl-Ph	4-Cl-2,6-ジ-F-Ph	NH	***	
393	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OEt-Ph	NH	360	
394	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	O	369	
395	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344	
396	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352	20
397	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4-ジ-Cl-6-F-Ph	NH	386	
398	H	Me	2,6-ジ-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352	
399	H	Me	2,6-ジ-F-4- (OCH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂)-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	445	
400	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-ジ-F-Ph	NH	334	
401	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-ジ-F-Ph	NH	386	
402	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-F-Ph	NH	474	
403	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-Cl-Ph	NH	464	30
404	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-ジ-F-Ph	NH	386	
405	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4,6-トリ-Cl-Ph	NH	404	
406	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2-Br-4,6-ジ-F-Ph	NH	416	
407	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	414	
408	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-ジ-Cl-Ph	NH	508	
409	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	458	
410	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-Cl-Ph	NH	420	40
411	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-ジ-F-Ph	NH	432	
412	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	430	
413	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	474	

【 0 5 0 3 】

【表 8 2】

Cmpd No	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
414	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-トリ-Cl-Ph	NH	464
415	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-F-2-I-Ph	NH	444
416	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	2,4,6-トリ-Me-Ph	NH	342
417	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-ジ-F-Ph	NH	386
418	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-ジ-F-Ph	NH	386
419	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	CHOAc	409
420	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	ピリジン-2-イル	CHOH	332
421	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	CHOH	384
422	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-トリ-F-Ph	CHOH	385
423	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	CHOH	374
424	H	Me	2,4-ジ-F-Ph	4-Cl-2-F-6-I-Ph	NH	478
425	H	Me	2-Cl-4- (OCH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe)- Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	421
426	H	Me	2-Cl-4- (OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe)-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	422
427	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	NH	366
428	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-ジ-F-Ph	CHOH	382

* 索引表 B に見出される ¹H NMR データ** 合成例に見出される AP⁺ データまたは ¹H NMR データ

*** 索引表 C に見出される MP データ

【 0 5 0 4 】

【表 8 3】

索引表 B

Cmpd No	¹ H NMR データ(他に記載がない限り CDCl ₃ 溶液) ^a
3	δ 7.11 (m, 1H), 6.99 (m, 1H), 6.75–6.85 (m, 3H), 6.58 (m, 1H), 6.40 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 3.07 (s, 3H), 2.21 (s, 3H)

^a ¹H NMR データはテトラメチルシランの低磁場側に ppm である。カップリングは、(s)-一重項および (m)-多重項により示されている。

【 0 5 0 5 】

10

20

30

40

【表 8 4】

索引表 C

<u>Cmpd No</u>	<u>融点^b</u>	<u>Cmpd No</u>	<u>融点</u>	<u>Cmpd No</u>	<u>融点</u>
110	85-87	197	115-117	271	132-135
111	165-167	198	106-108	272	132-134

【 0 5 0 6 】

【表 8 5】

Cmpd No	融点 ^b	Cmpd No	融点	Cmpd No	融点	
112	80-82	199	134-136	273	152-153	
113	135-137	200	139-141	274	141-143	
114	147-149	201	109-111	275	168-171	
115	168-170	207	57-59	276	115-117	
123	171-173	209	92-96	277	131-134	
124	135-137	210	73-77	278	112-114	10
125	138-140	211	110-114	281	49-52	
126	142-144	212	130-134	289	148-150	
129	127-130	214	105-107	290	181-183	
130	129-131	215	90-92	291	146-149	
131	129-133	216	152-154	293	116-118	
133	160-162	217	72-76	294	113-115	
134	228-230	218	112-117	300	178-180	
135	112-117	224	132-135	301	168-170	
136	152-154	225	123-126	304	186-191	20
137	165-167	226	139-141	305	101-105	
138	171-173	227	99-102	306	134-138	
142	186-188	228	133-135	307	161-166	
143	93-95	229	144-146	308	142-145	
144	176-178	231	108-110	309	118-123	
145	142-144	242	91-93	327	118-120	
146	145-147	243	82-84	329	98-100	
147	60-62	244	95-97	333	177-179	
151	150-158	245	73-75	334	117-119	30
156	107-114	246	182-184	337	186-188	
157	96-101	247	156-158	339	135-136	
164	106-110	249	83-87	340	137-139	
165	111-113	250	126-129	341	151-153	
178	110-112	256	171-173	353	169-171	
179	105-107	257	172-174	354	111-113	
180	130-132	258	121-124	355	90-92	
186	78-84	259	97-100	363	229-231	40
187	107-113	268	178-180	391	181-183	
194	133-135	269	80-85	392	155-157	
195	98-100	270	172-176			

^b融点データは℃

【 0 5 0 7 】

本発明の生物学的実施例

試験 A ~ J 用の試験懸濁液を調製するための一般的なプロトコル：試験化合物を先ず最終体積の 3 % に等しい量でアセトン中に溶解させ、次いで、250 ppm の界面活性剤 T r e m (登録商標) 0 1 4 (多価アルコールエステル) を含有するアセトンおよび精製水

(体積基準で50/50混合物)中に、所望の濃度(ppm)で懸濁させた。次いで、得られた試験懸濁液を試験A~Jにおいて用いた。試験植物への200ppmの試験懸濁液の流出点までの吹付けは、500g/haに等しかった。他に示されていない限りにおいて、格付値は、200ppm試験懸濁液を用いたことを示す。(格付値に続くアスタリスク「*」は、40ppm試験懸濁液を用いたことを示す。)

【0508】

試験A

ブドウ実生に、プラズモパラ ビチコーラ (*Plasmopara viticola*) (ブドウべと病の病因)の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で20で24時間培養した。短い乾燥期間の後、ブドウの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧し、次いで、20のグロースチャンバーに4日間移し、その後、試験ユニットを20の飽和雰囲気中に24時間戻した。取り出し、視覚的な病害の格付けを行った。

10

【0509】

試験B

トマトの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、ボトリチス シネレア (*Botrytis cinerea*) (トマトボトリチスの病因)の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で20で48時間培養し、次いで、24のグロースチャンバーにさらに3日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

【0510】

試験C

トマトの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、アルタナリア ソラニ (*Alternaria solani*) (トマト夏疫病の病因)の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で27で48時間培養し、次いで、20のグロースチャンバーに5日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

20

【0511】

試験D

トマトの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、フィトフトラ インフェスタンス (*Phytophthora infestans*) (トマト疫病の病因)の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で20で24時間培養し、次いで、20のグロースチャンバーに5日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

30

【0512】

試験E

コヌカグサ (*Agrostis* sp.)の実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、リゾクトニア ソラニ (*Rhizoctonia solani*) (芝生ブラウンパッチの病因)のふすまと菌糸体とのスラリーを播種し、飽和雰囲気中で27で48時間培養し、次いで、27のグロースチャンバーに3日間移し、その後、病害の格付けを行った。

【0513】

試験F

コムギの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、セプトリア ノドルム (*Septoria nodorum*) (セプトリア (*Septoria*) ぶ枯病の病因)の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で24で48時間培養し、次いで、20のグロースチャンバーに6日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

40

【0514】

試験G

コムギの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、セプトリア トリティシ (*Septoria tritici*) (コムギ葉枯病の病因)の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で24で48時間培養した。次いで、実生を、20のグロースチャンバーにさらに19日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

【0515】

50

試験 H

コムギ実生に、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*) (コムギ葉さび病の病因) の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で 20℃ で 24 時間培養し、次いで、20℃ のグロースチャンパーに 2 日間移した。この期間の終了後に、流出点まで試験懸濁液を噴霧し、次いで、実生を 20℃ のグロースチャンパーに 6 日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

【0516】

試験 I

コムギの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*) (コムギ葉さび病の病因) の孢子懸濁液を播種し、飽和雰囲気中で 20℃ で 24 時間培養し、次いで、20℃ のグロースチャンパーに 7 日間移し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

【0517】

試験 J

コムギの実生に流出点まで試験懸濁液を噴霧した。次の日に、実生に、うどん粉病菌 (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*) (コムギうどんこ病の病因) の芽胞粉剤を播種し、および、20℃ のグロースチャンパー中で 8 日間培養し、その後、視覚的な病害の格付けを行った。

【0518】

試験 A ~ J に対する結果が表 A に示されている。この表において、100 の格付けは 100% 病害防除を示し、および、0 の格付けは、病害防除がないことを示す (対照と比して)。ダッシュ (-) は、試験結果がないことを示す。

【0519】

10

20

【表 8 6】

表 A

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
1	0	99	0	0	47	0	99	-	0	98	
2	8	1	0	0	0	0	0	-	0	0	
3	6	0	25	9	0	0	13	-	0	99	
4	29	87	46	0	0	0	98	-	53	97	
5	36	0	25	0	0	0	0	-	0	0	10
6	65	10	23	0	0	0	0	-	0	93	
7	29	99	0	0	63	0	100	-	74	92	
8	55	99	54	0	99	0	100	-	97	99	
9	-	99	0	0	55	0	100	-	98	97	
10	-	47	0	0	0	0	0	-	0	0	
11	-	99	99	0	99	0	100	-	99	100	
12	-	99	93	0	99	0	100	-	99	100	
13	-	99	100	0	98	64	100	-	100	99	20
14	-	98	0	-	-	0	99	-	99	98	
15	-	99	67	-	-	73	99	-	98	99	
16	-	60	0	-	-	0	47	48	28	0	
17	-	100	100	-	-	93	97	96	100	100	
18	-	99	100	-	-	99	95	99	100	100	
19	-	100	85	-	-	0	96	0	92	98	
20	-	100	99	-	-	100	100	79	100	99	
21	-	98	100	-	-	97	-	-	100	99	
22	-	90	85	-	-	90	94	9	94	100	30
23	-	98	100	-	-	99	93	92	100	100	
24	-	98	100	-	-	0	94	9	97	100	
25	-	100	0	-	-	0	100	0	94	79	
26	-	99	83	-	-	0	100	0	99	100	
27	-	99	88	-	-	0	95	0	25	87	
28	-	99	0	-	-	0	96	7	91	0	
29	-	94	0	-	-	0	98	0	46	0	
30	-	7	0	-	-	0	41	0	79	0	
31	-	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*	40
32	-	99	0	-	-	0	96	0	99	97	
33	-	0	0	-	-	0	95	0	18	0	

【 0 5 2 0 】

【表 8 7】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
34	-	100*	97*	-	-	0*	96*	0*	76*	0*	
35	-	100	0	-	-	0	95	0	97	100	
36	-	100	0	-	-	0	96	0	96	98	
37	0	0	0	0	0	0	3	-	0	0	
38	-	99	9	-	-	0	97	0	99	99	
39	-	100	99	-	-	0	99	99	99	99	10
40	-	99	0	-	-	0	94	92	99	99	
41	-	100	99	-	-	90	94	0	100	99	
42	-	100	0	-	-	0	93	0	94	82	
43	-	76	0	-	-	0	97	66	82	99	
44	-	82	0	-	-	0	96	7	9	0	
45	-	100	100	-	-	100	100	7	100	100	
46	-	99	100	-	-	99	100	37	100	99	
47	-	100*	87*	-	-	0*	99*	37*	96*	99*	
48	-	100	78	-	-	0	99	0	98	98	20
49	-	100	17	-	-	35	99	0	89	79	
50	-	99	57	-	-	0	100	0	98	99	
51	-	100	0	-	-	0	100	0	89	78	
52	-	54	0	-	-	0	97	0	92	64	
53	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0	
54	-	96	0	-	-	0	41	0	95	95	
55	-	6	0	-	-	0	98	0	41	73	
56	-	43	0	-	-	0	99	0	28	64	
57	-	98	0	-	-	0	94	85	85	0	30
58	-	98	100	-	-	89	98	82	100	100	
59	-	94	0	-	-	0	88	0	68	0	
60	-	75	0	-	-	0	97	59	79	0	
61	-	97	0	-	-	0	99	0	38	73	
62	-	99	98	-	-	84	98	98	99	99	
63	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0	
64	-	97	80	-	-	0	100	0	95	98	
65	-	0	0	-	-	0	1	0	58	0	
66	-	100	99	-	-	0	100	6	100	99	40
67	-	95	0	-	-	0	99	24	95	86	
68	-	0	0	-	-	0	0	6	0	0	
69	-	100	73	-	-	60	99	91	99	100	
70	-	99	0	-	-	0	99	41	85	98	

【 0 5 2 1 】

【表 8 8】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
71	-	93	0	-	-	0	96	0	91	67	
72	-	0	0	-	-	0	0	59	0	0	
73	-	100	99	-	-	64	100	88	100	99	
74	-	0	0	-	-	0	25	4	0	0	
75	-	100	98	-	-	98	99	95	99	97	
76	-	100	0	-	-	0	98	6	0	0	10
77	-	99	0	-	-	0	95	6	97	0	
78	-	99	82	-	-	0	98	0	89	91	
79	-	99	0	-	-	0	99	0	55	0	
80	-	100	0	-	-	0	99	18	86	89	
81	-	97	0	-	-	0	0	0	27	0	
82	-	100	100	-	-	40	99	0	68	13	
83	-	100	100	-	-	89	99	99	96	94	
84	-	100	100	-	-	78	100	98	100	99	
85	-	0	0	-	-	0	17	0	19	0	20
86	-	0	0	-	-	0	48	0	0	0	
87	-	100	100	-	-	95	98	85	99	100	
88	-	100	100	-	-	99	98	95	99	100	
89	-	99	0	-	-	0	99	0	0	97	
90	-	99	95	-	-	84	100	0	98	100	
91	-	100	99	-	-	95	99	0	100	100	
92	-	100	100	-	-	99	100	41	99	100	
93	-	41	0	-	-	0	77	0	9	0	
94	-	99	70	-	-	29	98	0	9	0	30
95	-	99	16	-	-	0	97	0	0	0	
96	-	99	99	-	-	99	100	9	99	100	
97	-	100	99	-	-	95	100	0	99	99	
98	-	100	17	-	-	69	100	26	99	99	
99	-	100	99	-	-	100	99	40	100	100	
100	-	38	0	-	-	0	48	0	41	0	
101	-	100	99	-	-	100	100	99	99	100	
102	-	100	100	-	-	98	99	0	100	98	40
103	-	100	64	-	-	0	95	0	91	0	
104	-	100	99	-	-	97	99	99	99	100	
105	-	23	0	-	-	0	73	9	0	72	
106	-	100	99	-	-	90	100	82	99	100	
107	-	99*	0*	-	-	0*	99*	8*	24*	0*	

【 0 5 2 2 】

【表 8 9】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
108	-	97	0	-	-	0	98	0	16	97	
109	-	100	99	-	-	97	100	99	100	100	
110	-	99	66	-	-	98	99	0	97	94	
111	-	99	75	-	-	90	99	0	97	99	
112	-	100	98	-	-	99	99	53	100	100	
113	-	99	47	-	-	0	100	8	95	48	10
114	-	99	24	-	-	69	99	8	99	84	
115	-	99	0	-	-	0	100	0	91	0	
116	-	100	94	-	-	73	100	16	97	99	
117	-	99	97	-	-	82	100	11	98	97	
118	-	100	100	-	-	98	100	99	100	99	
119	-	100	0	-	-	0	100	16	99	96	
120	-	100	99	-	-	94	100	0	99	99	
121	-	100	86	-	-	82	99	83	100	97	
122	-	0	0	-	-	0	0	11	0	0	20
123	-	99	0	-	-	40	99	-	80	0	
124	-	100	78	-	-	60	99	-	96	94	
125	-	100	67	-	-	60	99	-	92	0	
126	-	99	96	-	-	60	100	0	94	0	
127	-	70	0	-	-	0	99	0	68	0	
128	-	100	100	-	-	97	99	66	100	100	
129	-	99	0	-	-	0	96	0	0	0	
130	-	97	0	-	-	0	99	0	19	0	
131	-	99	0	-	-	0	98	0	86	94	
132	-	99	0	-	-	0	100	0	94	92	30
133	-	100	100	-	-	60	99	0	100	94	
134	-	99	0	-	-	0	99	0	41	0	
135	-	0	0	-	-	0	97	16	74	95	
136	-	99	71	-	-	86	99	0	99	100	
137	-	96	97	-	-	78	99	8	100	100	
138	-	99	96	-	-	84	99	38	100	98	
139	-	100	86	-	-	100	100	69	99	100	
140	-	99	94	-	-	87	99	0	96	97	
141	-	99	99	-	-	98	100	0	99	100	40
142	-	33	13	-	-	20	99	0	95	90	
143	-	99	99	-	-	100	100	63	100	100	
144	-	99	9	-	-	40	99	0	98	91	

【 0 5 2 3 】

【表 9 0】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
145	-	96	98	-	-	100	100	88	100	100	
146	-	99	0	-	-	0	99	0	97	56	
147	-	99	88	-	-	100	100	0	98	92	
148	-	99	99	-	-	100	100	61	100	99	
149	-	100	98	-	-	100	100	99	100	100	
150	-	19	0	-	-	60	7	0	74	50	10
151	-	99	9	-	-	0	96	0	54	64	
152	-	100	82	-	-	87	99	9	97	99	
153	-	100	0	-	-	73	100	0	96	98	
154	-	99	99	-	-	97	100	41	100	100	
155	-	100	99	-	-	100	100	92	100	99	
156	-	94	0	-	-	0	73	0	41	47	
157	-	0	0	-	-	0	0	0	54	73	
158	-	100	0	-	-	0	99	18	99	98	
159	-	99	0	-	-	0	100	74	99	100	20
160	-	98	99	-	-	0	99	8	100	100	
161	-	98	100	-	-	0	100	95	100	98	
162	-	99	0	-	-	0	99	8	98	94	
163	-	0	9	-	-	0	83	0	88	0	
164	-	49	57	-	-	0	99	15	9	97	
165	-	0	0	-	-	0	52	8	0	99	
166	-	0	0	-	-	0	97	0	68	96	
167	-	75	0	-	-	0	0	0	0	0	
168	-	14	0	-	-	0	33	0	0	0	30
169	-	24	0	-	-	0	85	0	0	0	
170	-	100	99	-	-	99	98	0	100	99	
171	-	100	97	-	-	0	97	68	99	100	
172	-	100	100	-	-	87	100	0	99	100	
173	-	100	86	-	-	0	98	0	83	100	
174	-	100	99	-	-	0	96	0	97	99	
175	-	100	99	-	-	82	96	93	99	100	
176	-	100	71	-	-	0	96	0	68	100	
177	-	100	100	-	-	73	98	0	83	100	40
178	-	100	100	-	-	80	98	0	83	100	
179	-	100	99	-	-	73	95	0	93	100	
180	-	100	99	-	-	0	98	0	68	100	
181	-	94	44	-	-	0	100	0	60	98	

【 0 5 2 4 】

【表 9 1】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J
182	-	97	99	-	-	87	100	0	95	99
183	-	97	100	-	-	67	99	27	94	99
184	-	97	0	-	-	0	99	0	82	98
185	-	0	0	-	-	0	100	0	74	98
186	-	0	0	-	-	0	99	0	54	93
187	-	33	0	-	-	0	20	0	9	13
188	-	87	0	-	-	0	100	0	97	97
189	-	99	100	-	-	80	100	99	99	98
190	-	99	99	-	-	80	100	94	100	99
191	-	98	100	-	-	0	100	0	97	99
192	-	97	100	-	-	73	100	0	99	99
193	-	99	100	-	-	0	100	32	99	100
194	-	97	86	-	-	0	99	0	91	99
195	-	100	97	-	-	60	100	0	98	97
196	-	99	94	-	-	73	100	9	98	98
197	-	97	0	-	-	95	99	0	79	96
198	-	97	68	-	-	0	100	0	94	97
199	-	99	86	-	-	0	99	0	68	98
200	-	82	0	-	-	0	97	0	0	94
201	-	99	97	-	-	20	100	18	97	99
202	-	99	0	-	-	0	99	0	28	99
203	-	99	0	-	-	0	98	0	96	100
204	-	100*	77*	-	-	0*	99*	0*	86*	99*
205	-	100	17	-	-	0	99	0	91	100
206	-	99	99	-	-	84	99	41	99	100
207	-	100	93	-	-	64	100	0	99	100
208	-	100	100	-	-	99	100	0	99	99
209	-	0	0	-	-	0	0	0	0	97
210	-	0	0	-	-	0	100	99	94	99
211	-	77	0	-	-	0	99	0	17	96
212	-	0	17	-	-	-	98	0	-	-
213	-	97	30	-	-	0	85	94	96	100
214	-	98	51	-	-	0	100	9	99	100
215	-	89	0	-	-	0	98	0	94	99
216	-	96	0	-	-	0	76	0	26	99
217	-	75	0	-	-	0	83	40	79	99
218	-	94	0	-	-	0	99	17	92	87

【 0 5 2 5 】

【表 9 2】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
219	-	70	0	-	-	0	0	17	0	0	
220	-	98	97	-	-	40	98	40	99	100	
221	-	98	94	-	-	82	100	17	99	100	
222	-	99	99	-	-	0	100	88	99	100	
223	-	96	9	-	-	99	100	0	100	100	
224	-	99	51	-	-	0	100	17	91	100	10
225	-	65	0	-	-	0	99	0	79	98	
226	-	99	0	-	-	0	96	28	91	100	
227	-	87	0	-	-	0	99	0	74	98	
228	-	99	99	-	-	0	99	0	80	99	
229	-	99	17	-	-	0	99	0	91	98	
230	-	99	99	-	-	0	100	0	97	100	
231	-	98	34	-	-	0	100	0	86	100	
232	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100	
233	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100	20
234	-	99	0	-	-	0	99	0	92	84	
235	-	84	0	-	-	0	17	0	0	79	
236	-	97	0	-	-	0	96	0	68	97	
237	-	99	0	-	-	0	97	0	68	97	
238	-	99	0	-	-	0	0	53	9	43	
239	-	99	95	-	-	0	67	0	68	100	
240	-	100	99	-	-	0	99	0	99	100	
241	-	99	99	-	-	0	100	97	100	100	
242	-	99	37	-	-	0	100	0	91	100	30
243	-	100	64	-	-	0	100	0	97	100	
244	-	82	0	-	-	0	91	0	0	96	
245	-	90	0	-	-	0	97	0	68	93	
246	-	99	51	-	-	0	100	0	80	100	
247	-	100	99	-	-	60	100	0	99	100	
248	-	99	26	-	-	73	100	0	99	100	
249	-	40	0	-	-	0	99	0	96	100	
250	-	98	0	-	-	0	77	0	86	100	40
251	-	99	0	-	-	0	98	0	86	100	
252	-	100	97	-	-	0	100	0	100	100	
253	-	99	0	-	-	0	0	0	0	76	
254	-	100	0	-	-	0	84	0	0	64	
255	-	100	0	-	-	0	0	0	0	39	

【 0 5 2 6 】

【表 9 3】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
256	-	99	99	-	-	96	100	0	99	100	
257	-	100	99	-	-	0	100	0	97	98	
258	-	41	9	-	-	0	89	0	68	90	
259	-	98	9	-	-	0	100	0	86	97	
260	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0	
261	-	0	0	-	-	0	0	0	0	47	10
262	-	99	51	-	-	0	0	0	68	99	
263	-	100	98	-	-	0	100	0	98	100	
264	-	100	98	-	-	0	92	0	99	98	
265	-	100	99	-	-	78	100	90	100	100	
266	-	100	100	-	-	98	100	0	100	100	
267	-	100	79	-	-	60	100	0	96	93	
268	-	95	93	-	-	0	99	0	74	0	
269	-	80	0	-	-	0	67	8	0	0	
270	-	92	86	-	-	0	91	8	0	81	20
271	-	100	99	-	-	99	100	0	99	98	
272	-	100	97	-	-	99	99	0	99	99	
273	-	0	0	-	-	0	72	0	27	43	
274	-	8	0	-	-	0	96	8	0	69	
275	-	97	46	-	-	0	99	8	97	99	
276	-	100	99	-	-	98	100	31	100	100	
277	-	100	0	-	-	0	100	0	96	98	
278	-	99	0	-	-	0	99	0	82	100	
279	-	100	99	-	-	0	100	8	98	100	30
280	-	99	0	-	-	0	96	8	18	87	
281	-	98	44	-	-	0	-	0	94	98	
282	-	99	98	-	-	0	-	0	99	100	
283	-	99	65	-	-	0	-	9	99	100	
284	-	99	99	-	-	100	-	28	100	100	
285	-	98	0	-	-	60	-	9	99	99	
286	-	98*	85*	-	-	60*	-	100*	100*	100*	
288	9	99	52	0	92	0	-	-	74	92	40
289	-	100	0	-	-	0	99	0	96	97	
290	-	100	99	-	-	87	100	0	100	100	
291	-	99	0	-	-	0	98	0	85	43	
292	-	100	99	-	-	96	100	92	100	100	
293	0	97	47	0	99	0	-	-	94	99	

【 0 5 2 7 】

【表 9 4】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
294	0	98	0	0	80	0	-	-	0	84	
296	-	99	0	-	-	0	100	0	99	-	
297	-	100	99	-	-	90	100	0	100	100	
298	-	100	93	-	-	87	100	0	100	100	
299	-	100	95	-	-	51	-	41	100	100	
300	-	100	99	-	-	82	100	9	99	100	10
301	-	99	87	-	-	87	100	0	98	99	
302	-	99*	0*	-	-	0*	99*	0*	18*	97*	
303	-	99	0	-	-	0	98	0	92	71	
304	-	0	0	-	0	0	16	-	0	0	
305	-	99	99	-	-	94	100	0	99	99	
306	-	7	0	-	-	0	93	0	28	64	
307	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0	
308	-	81	0	-	-	0	98	9	100	0	
309	-	97	61	-	92	60	100	-	0	99	20
310	-	100	99	-	-	99	100	0	99	96	
311	-	100	0	-	-	60	100	0	99	91	
313	-	100	97	-	-	51	100	91	100	100	
314	-	100	95	-	-	0	100	94	100	100	
315	-	99	99	-	-	0	100	0	96	100	
316	-	99	0	-	-	0	-	9	99	96	
318	-	99	0	-	-	0	100	0	97	89	
319	-	92	88	-	-	100	100	0	99	95	
320	-	99	67	-	-	0	100	0	99	98	30
321	-	100	99	-	-	78	100	9	99	100	
322	-	100	93	-	-	0	100	99	100	100	
323	-	98	0	-	-	0	98	0	94	-	
324	-	99	83	-	-	0	100	63	99	99	
325	-	100	0	-	-	0	100	0	97	99	
326	8	99	99	0	99	73	100	-	99	94	
327	-	99	0	-	-	0	100	0	96	99	
328	-	100	86	-	-	0	100	0	98	100	
329	-	100	99	-	-	69	100	0	100	100	40
331	-	100	80	-	-	73	100	8	100	97	
333	-	100	0	-	-	0	100	9	74	0	
334	-	100	0	-	-	0	100	0	97	100	
336	-	100	97	-	-	95	100	94	100	99	

【 0 5 2 8 】

【表 9 5】

Cmpd No	試験 A	試験 B	試験 C	試験 D	試験 E	試験 F	試験 G	試験 H	試験 I	試験 J	
337	-	99	0	-	-	0	99	9	41	98	
338	-	100	37	-	-	40	100	8	100	99	
339	-	100	0	-	-	0	100	0	98	100	
340	-	99	0	-	-	0	100	0	91	100	
341	-	99	0	-	-	0	99	0	99	93	
342	-	100	33	-	-	99	100	0	100	100	10
343	-	100	100	-	-	97	100	91	100	100	
344	-	100	40	-	-	87	100	62	100	100	
345	-	0	0	-	-	0	67	0	9	0	
348	-	100	80	-	-	94	100	19	100	100	
350	-	99	9	-	-	0	-	9	96	0	
351	-	100	99	-	-	92	-	96	100	99	
353	-	97	17	-	-	0	99	3	99	99	
354	-	99	0	-	-	0	100	82	98	100	
355	-	99	0	-	-	0	100	3	91	0	20
356	-	100	0	-	-	0	-	100	100	0	
357	-	100	86	-	-	87	100	0	99	100	
358	-	99	0	-	-	0	100	0	97	97	
359	-	100	99	-	-	97	100	0	100	99	
360	-	100	97	-	-	95	100	79	100	100	
361	-	100	90	-	-	0	100	0	100	100	
362	-	100	0	-	-	0	100	0	96	96	
363	-	65	0	-	-	0	99	0	96	43	
364	-	99	97	-	-	88	100	0	99	100	30
365	-	100	99	-	-	64	100	74	100	100	
366	-	100	58	-	-	0	100	9	99	100	
367	-	100	100	-	-	100	-	100	100	100	
369	-	100	66	-	-	0	-	17	100	99	
389	-	100	9	-	-	0	-	68	98	99	
391	-	100	99	-	-	73	-	31	99	99	
403	-	99	0	-	-	0	-	99	100	99	

“Cmpd No” は化合物番号を意味し、索引表 A と同一の化合物番号を指す

フロントページの続き

- (72)発明者 ジェフリー・キース・ロング
アメリカ合衆国デラウェア州19803・ウィルミントン・ブルースロード1210
- (72)発明者 ウォンビョ・ホン
アメリカ合衆国メリーランド州21093・ルーサービル・マールブルクマナードライヴ8506
- (72)発明者 アンドルー・エドモンド・タギ
アメリカ合衆国デラウェア州19711・ニューアーク・トレモントコート21

合議体

審判長 佐藤 健史
審判官 木村 敏康
審判官 瀬良 聡機

(56)参考文献 特開平8-208620(JP,A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)
C07D231/12