

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2015-504885

(P2015-504885A)

(43) 公表日 平成27年2月16日(2015.2.16)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 417/14 (2006.01)	C07D 417/14 CSP	4C054
A61P 31/04 (2006.01)	A61P 31/04 171	4C056
A61K 31/454 (2006.01)	A61K 31/454	4C063
C07D 211/62 (2006.01)	C07D 211/62	4C086
C07D 261/04 (2006.01)	C07D 261/04	4H011
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 187 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2014-549445 (P2014-549445)
 (86) (22) 出願日 平成24年12月21日 (2012.12.21)
 (85) 翻訳文提出日 平成26年8月22日 (2014.8.22)
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2012/076585
 (87) 国際公開番号 W02013/098229
 (87) 国際公開日 平成25年7月4日 (2013.7.4)
 (31) 優先権主張番号 11195764.3
 (32) 優先日 平成23年12月27日 (2011.12.27)
 (33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

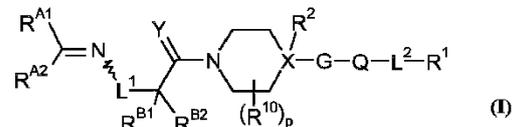
(71) 出願人 512151078
 バイエル・インテレクチュアル・プロパテ
 イー・ゲー・エム・ベー・ハー
 ドイツ国、40789・モンハイム、アル
 フレートーノベルーシュトラッセ・10
 (74) 代理人 100114188
 弁理士 小野 誠
 (74) 代理人 100119253
 弁理士 金山 賢教
 (74) 代理人 100124855
 弁理士 坪倉 道明
 (74) 代理人 100129713
 弁理士 重森 一輝
 (74) 代理人 100137213
 弁理士 安藤 健司

最終頁に続く

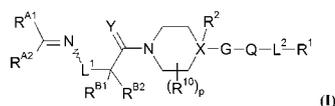
(54) 【発明の名称】 殺菌剤としてのヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体

(57) 【要約】

本発明は、式(I)〔式中、記号R^{A1}、R^{A2}、X、Y、L¹、L²、R^{B1}、R^{B2}、G、Q、p、R¹、R²及びR¹⁰は、本明細書中で示されている意味を有する〕で表されるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体、並びに、式(I)で表される化合物の塩、金属錯体及びN-オキシド、並びに、有害な植物病原性菌類と闘うためのそれらの使用、並びに、式(I)で表される化合物を製造する方法に関する。



【化1】

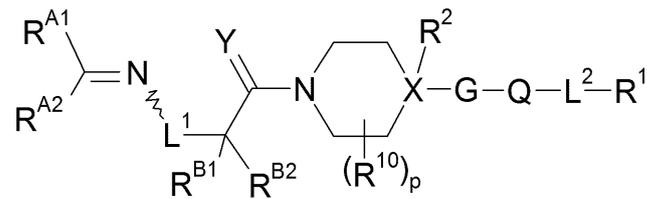


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



(I)

10

〔式中、ラジカルは、それぞれ、以下のように定義される：

R^{A1} は、水素、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ハロアルキルアミノ、ハロジアルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ又はハロアルキルスルホニルアミノであり；

20

R^{A2} は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオであり；又は、

30

R^{A2} は、置換されていないか又は置換されているフェニル、場合によりベンゾ縮合していてもよい置換されている 5 員又は 6 員のヘテロシクリルであり（ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：ヒドロキシル、シアノ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ）；又は、

R^{A1} と R^{A2} は、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素、ケイ素又は硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個、3 個又は 4 個のヘテロ原子を含んでいてもよい 3 ~ 7 員の飽和又は部分的不飽和の環を形成し（ここで、場合により、1 個、2 個又は 3 個の炭素環員は、 $C(=O)$ 及び $C(=S)$ から選択され、並びに、硫黄環員は、 $S(=O)_s$ ($=NR^{A3}$)_f から選択され、並びに、ケイ素環員は、 $SiR^{A4}R^{A5}$ から

40

選択され、ここで、該環は、置換されていないか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{A3} は、水素、シアノ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ハロアルキルアミノ又はフェニルであり；

R^{A4} 及び R^{A5} は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシであり；

s は、0、1 又は 2 であり；及び、

50

f は、0、1又は2であり；及び、

s + f は、0、1又は2であり；

R^{A6} は、炭素環員上のハロゲン、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシ、及び、窒素環員上のシアノ、アルキル又はアルコキシであり；

L^1 は、酸素、硫黄、 $-N(R^{L1})-$ 、 $-C(R^{L2})_2-$ 、 $-OC(R^{L2})_2-$ 、 $-SC(R^{L2})_2-$ 、 $-N(R^{L1})-C(R^{L2})_2-$ であり（ここで、左側の結合は式(I)の窒素原子に結合しており、及び、右側の結合は式(I)の窒素原子に結合している）；

R^{L1} は、水素、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルスルホニル又はハロアルキルスルホニルであり、又は、2つの R^{L1} ラジカルと R^{A2} ラジカルは、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含んでいてもよい5~7員の部分的不飽和の環を形成し（ここで、該環は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{L2} は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；

R^{B1} は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルアミノカルボニルオキシ、ジアルキルアミノカルボニルオキシであり；又は、

R^{B1} は、フェニルラジカル、ナフタレニルラジカル又は5員若しくは6員のヘテロアリアルラジカルであり（ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ）；

R^{B2} は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；又は、

2つの R^{B1} ラジカルと R^{B2} ラジカルは、それらが結合している炭素原子と一緒に、3~6員の飽和環を形成し；

Y は、硫黄又は酸素であり；

X は、炭素又は窒素であり；

R^2 は、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり；

R^{10} は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり；

p は、0、1又は2であり；

G は、5員ヘテロアリアルであり（ここで、該ヘテロアリアルは、Qで置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよい）；

Q は、飽和又は部分的不飽和又は完全不飽和の5員のヘテロシクリルであり（ここで、該ヘテロシクリルは、 L^2-R^1 で置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^5 から選択される）；

R^5 は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、以下のものであり；

Qの5員のヘテロシクリルの炭素に結合している場合：

オキソ、チオキソ、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、 $-CHO$

10

20

30

40

50

、 - C (= O) O H 、 - C (= O) N H ₂ 、 - N R ³ R ⁴ 、 アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、シクロアルキルアミノカルボニル、ハロアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、トリアルキルシリル、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ；

Q の 5 員のヘテロシクリルの窒素に結合している場合：

水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、フェニル、ベンジル、アルキルスルホニル、 - C (= O) H 、 アルコキシカルボニル、又は、アルキルカルボニル；

R ³ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル又はハロアルコキシカルボニルであり；

R ⁴ は、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル又は - L ⁵ R ¹ であり；

L ⁵ は、 - O - 、 - C (= O) - 、 S (= O) _m 又は C H R ^{2 0} であり；

m は、 0 、 1 又は 2 であり；

L ² は、直接結合、 - O - 、 - C (= O) - 、 - S (= O) _m - 、 - C H R ^{2 0} - 又は - N R ^{2 1} - であり；

R ^{2 0} は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；

R ^{2 1} は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル又はハロアルコキシカルボニルであり；

R ¹ は、フェニル、ベンジル、ナフタレニル、場合によりベンゾ縮合していてもよい置換されている 5 員又は 6 員のヘテロアリール（ここで、該ヘテロアリールは、置換基 Z ⁴ で少なくとも 1 回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、Z ⁴ から選択され、及び、場合により、Z ¹ から選択される）であり；又は、

R ¹ は、 5 ~ 8 員の非芳香族（飽和又は部分的不飽和）の炭素環、 5 員、 6 員若しくは 7 員の非芳香族ヘテロシクリルラジカル又は 8 ~ 11 員の炭素環式若しくはヘテロ環式の二環式環であり（ここで、これらは、それぞれ、置換基 Z ⁴ で少なくとも 1 回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、Z ⁴ から選択され、及び、場合により、オキソ、チオキソ又は Z ¹ から選択される）；

Z ¹ は、以下のものであり；

R ¹ の炭素に結合している場合：

水素、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、アミノ、シアノ、アルキル、アルケニ

ル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルキルシクロアルキル、アルコキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、トリアルキルシリル、及び、シクロアルキルアミノ、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、シクロアルコキシアルキル、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルチオ、シクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアミノ、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルキルカルボニル、シクロアルキルスルホニル、又は、 $-L^3Z^3$ ；

10

R¹の窒素に結合している場合：

アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、又は、アルコキシ；

L³は、直接結合、 $-C(=O)-$ 、硫黄、酸素、 $-NR^{21}-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-S(=O)_m-$ 、 $-CHR^{20}-$ 、 $-CHR^{20}-CHR^{20}-$ 、 $-CR^{20}=CR^{20}-$ 、 $-OCHR^{20}-$ 、 $-CHR^{20}O-$ であり；

Z³は、フェニルラジカル、ナフタレニルラジカル又は5員若しくは6員のヘテロアリールラジカルであり（ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される；

20

炭素上の置換基：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、トリシリルアルキル、又は、フェニル；

窒素上の置換基：水素、 $-C(=O)H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NR^{13}R^{14}$ 、フェニル、又は、ベンジル；

30

R¹³及びR¹⁴は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

Z⁴は、 $-SH$ 、 $-C(=O)H$ 、ハロアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルカルボニルアルコキシ、シクロアルキルアミノカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、C₄-C₆-アルキルカルボニル、C₅-C₆-アルコキシ、C₅-C₆-ハロアルコキシ、C₅-C₆-アルキルチオ、C₅-C₆-ハロアルキルチオ、C₅-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₅-C₆-ハロアルキルスルホニル、 $-NHCN$ 、 $-SO_2$ 、 $NHCN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=S)NR^{13}R^{14}$ 、 $-C$

40

50

(=O)NHCN、シアノアルキル、アルケニルカルボニルオキシ、アルコキシアルキルチオ、ハロアルケニルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルアルキル、アルコキシアルキニル、アルキニルチオ、ハロシクロアルキルカルボニルオキシ、アルケニルアミノ、アルキニルアミノ、ハロアルキルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノ、アルコキシアミノ、ハロアルコキシアミノ、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルキルカルボニル(アルキル)アミノ、ハロアルキルカルボニル(アルキル)アミノ、アルコキシカルボニル(アルキル)アミノ、 $-NR^{13}SO_2Z^3$ 、アルケニルチオ、ハロアルコキシカルボニル、アルコキシアルキルカルボニル、 $-SF_5$ 、ハロアルコキシカルボニルアミノ、 $-NHC(=O)H$ 、ジ(ハロアルキル)アミノアルキル、ハロシクロアルケニルオキシアルキル、アルコキシ(アルキル)アミノカルボニル、ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、アルコキシカルボニルアルコキシ、アルキルアミノチオカルボニルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノアルキル、 $-C(=NOR^7)R^8$ 、アルキルチオカルボニル、シクロアルケニルオキシアルキル、アルコキシアルコキシカルボニル、ジアルキルアミノチオカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノカルボニル、ハロアルコキシハロアルコキシ、ハロシクロアルコキシアルキル、 $-N=C(R^9)_2$ 、ジアルキルアミノカルボニルアミノ、アルコキシアルケニル、アルコキシハロアルコキシ、アルキルチオカルボニルオキシ、ハロアルコキシアルコキシ、 $-OSO_2Z^3$ 、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、アルコキシハロアルキル、ジ(ハロアルキル)アミノ、 $-SO_2NR^3R^4$ 、 $-O(C=S)NR^{13}R^{14}$ 、 $-O(C=S)SR^9$ 、ジアルコキシアルキル、アルキルアミノカルボニルアミノ、ハロアルコキシハロアルキル、アルキルアミノカルボニルアルキルアミノ、トリアルキルシリルアルキニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、トリアルキルシリルアルキニル、シアノ(アルコキシ)アルキル、ジアルキルチオアルキル、 $-O(C=O)H$ 、 $-SCN$ 、アルコキシスルホニル、シクロアルキルスルフィニル、ハロシクロアルコキシカルボニル、アルキルシクロアルキルカルボニル、ハロシクロアルキルカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、シアノアルコキシカルボニル、アルキルチオアルコキシカルボニル、アルキニルカルボニルオキシ、ハロアルキニルカルボニルオキシ、シアノカルボニルオキシ、シアノアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルスルホニルオキシ、シクロアルキルアルキルスルホニルオキシ、ハロシクロアルキルスルホニルオキシ、アルケニルスルホニルオキシ、アルキニルスルホニルオキシ、シアノアルキルスルホニルオキシ、ハロアルケニルスルホニルオキシ、ハロアルキニルスルホニルオキシ、アルキニルシクロアルキルオキシ、シアノアルケニルオキシ、シアノアルキニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルケニルオキシカルボニルオキシ、アルキニルオキシカルボニルオキシ、 $-OC(=O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{11}R^{12}$ 又は $-L^4Z^3$ であり；又は、

Z^4 は、1又は2の置換基を含んでいるアルキルであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

シアノ、アルコキシカルボニル、 $-C(=N-R^9)R^8$ 、 $-C(=N-NR^{13}R^{14})R^8$ 、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、ジアルキルカルボニルアミノ、アルキルカルボニルオキシ、 $-C(=O)H$ 、ベンジルオキシ、ベンゾイルオキシ、 $-C(=O)OH$ 、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、ハロシクロアルコキシ、アルコキシアミノ、アルケニルチオ、アルキニルチオ、シクロアルキルチオ、ハロアルコキシアミノ、ハロアルキルチオ、アルケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、シクロアルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、ハロアルケニルカルボニルオキシ、 $-SCN$ 、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルカルボニル(アルキル)アミノ、アルコキシカルボニル(アルキル)アミノ、アルキルアミノカル

ボニルアミノ、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルコキシカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニル(アルキル)アミノ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、アルキルチオカルボニルオキシ、シアノアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、ベンジルオキシアルコキシ、アルコキシハロアルコキシ、アルコキシアルキルチオ、アルコキシアルキルスルフィニル、アルコキシアルキルスルホニル、アルコキシアルキルカルボニルオキシ、シクロアルコキシアルコキシ、ハロアルコキシアルコキシ、ハロアルコキシハロアルコキシ、アルコキシカルボニルアルコキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、アルキルチオアルコキシ、ジアルキルアミノカルボニルアミノ、アルコキシアルコキシアルコキシ、トリアルキルシリルオキシ、トリアルキルシリルアルキニルオキシ、アルキニルシクロアルキルオキシ、シクロアルキルアルキニルオキシ、アルコキシカルボニルアルキニルオキシ、アリールアルキニルオキシ、アルキルアミノカルボニルアルキニルオキシ、ジアルキルアミノカルボニルアルキニルオキシ、アルケニルカルボニルオキシ、アルキニルカルボニルオキシ、ハロアルキニルカルボニルオキシ、シアノアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルスルホニルオキシ、シクロアルキルアルキルスルホニルオキシ、ハロシクロアルキルスルホニルオキシ、アルケニルスルホニルオキシ、アルキニルスルホニルオキシ、シアノアルキルスルホニルオキシ、ハロアルケニルスルホニルオキシ、ハロアルキニルスルホニルオキシ、ジアルキルアミノカルボニルオキシ、ハロアルキルアミノカルボニルオキシ、N-アルキル-N-ハロアルキルアミノカルボニルオキシ、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキニルオキシカルボニル、シアノアルキルオキシカルボニル、アルケニルオキシスルホニル、アルキニルオキシスルホニル);又は、

Z⁴は、1又は2の置換基を含んでいるアルケニルであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される:

トリアルキルシリル、シクロアルキル、シクロプロピリデニル、アルコキシ、トリアルキルシリルオキシ、アルキルカルボニルオキシ);又は、

Z⁴は、1又は2の置換基を含んでいるアルキニルであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される:

シクロアルキル、シクロプロピリデニル);又は、

Z⁴は、1又は2の置換基を含んでいるアルコキシであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される:

アルコキシカルボニル、シクロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、-O(C=O)H、アルキルチオ、ヒドロキシアルキル、トリアルキルシリル、シクロアルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、ベンジルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルスルホニル、シアノ);又は、

Z⁴は、1又は2の置換基を含んでいるアルケニルオキシであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される:

シクロアルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、シクロアルコキシ、シクロハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、ハロアルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキニルオキシカルボニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、シクロハロアルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、ハロアルケニルカルボニル、アルキニルカルボニル、ハロアルキニルカルボニル);又は、

Z⁴は、1又は2の置換基を含んでいるアルキニルオキシであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される:

シクロアルキル、アルコキシカルボニル、-Z³、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル);

L⁴は、-C(=O)O-、-C(=O)NR^{1 3}-、-OC(=O)-、-NR^{1 3}C(=O)-、-OCH₂C-C-又は-OCH₂CH=CH-であり;

10

20

30

40

50

R⁷ は、水素、アルキル、ハロアルキル、ベンジル又は Z³ であり；

R⁸ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、ハロアルキルシクロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

R⁹ は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

R¹¹ は、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、シアノアルキル、ホルミル、ハロアルキル、フェニル、アルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキルカルボニル、ハロシクロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノチオカルボニルであり；

R¹² は、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、シアノアルキル、ホルミル、水素、ハロアルキル、フェニル、アルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキルカルボニル、ハロシクロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノチオカルボニルである；

で表される化合物、並びに、式 (I) で表される化合物の塩、金属錯体及び N - オキシド。

【請求項 2】

前記ラジカルが、それぞれ、以下のように定義されることを特徴とする、請求項 1 に記載の化合物、並びに、式 (I) で表される化合物の塩、金属錯体及び N - オキシド；

R^{A1} は、水素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₂ - C₄ - ハロアルケニル、C₂ - C₄ - ハロアルキニル、C₂ - C₄ - アルコキシアルキル、C₂ - C₄ - アルキルチオアルキル、C₁ - C₃ - アルキルカルボニル、C₁ - C₃ - ハロアルキルカルボニル、C₁ - C₃ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₂ - C₄ - アルケニルオキシ、C₂ - C₄ - ハロアルケニルオキシ、C₂ - C₄ - アルキニルオキシ、C₂ - C₄ - ハロアルキニルオキシ、C₂ - C₄ - アルコキシアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、C₂ - C₄ - ジアルキルアミノ、C₁ - C₄ - ハロアルキルアミノ、C₂ - C₄ - ハロジアルキルアミノ、C₃ - C₆ - シクロアルキルであり、及び、さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、プロパン - 2 - イル、t - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル又はシクロプロピルであり；

R^{A2} は、水素、C₁ - C₃ - アルキル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₁ - C₃ - アルコキシであり；又は、

R^{A2} は、置換されていないか又は置換されているフェニル、場合によりベンゾ縮合していてもよい置換されている 5 員又は 6 員のヘテロシクリルであり（ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：ヒドロキシル、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ）；又は、

R^{A1} と R^{A2} は、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個、3 個又は 4 個のヘテロ原子を含んでもよい 3 ~ 6 員の飽和又は部分的不飽和の環を形成し（ここで、1 個の炭素環員は、場合により、C (= O) 及び C (= S) から選択され、ここで、該環は、置換基を含んでもよいか又は 1、2 若しくは 3 の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、R^{A6} から選択される）；

R^{A6} は、炭素環員上のハロゲン、シアノ、C₁ - C₂ - アルキル、C₁ - C₂ - ハロ

10

20

30

40

50

アルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ又は $C_1 - C_2$ - ハロアルコキシ、及び、窒素環員上のシアノ、 $C_1 - C_2$ - アルキル又は $C_1 - C_2$ - アルコキシであり；

L^1 は、酸素、硫黄、 $-N(R^{L1})-$ であり；

R^{L1} は、水素、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $-C(=O)CH_3$ 、 $-C(=O)CF_3$ 、 $C(=O)OCH_3$ であり、又は、2つの R^{L1} ラジカルと R^{A2} ラジカルは、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含んでいてもよい5~7員の部分的不飽和の環を形成し（ここで、該環は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{B1} は、水素、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_2 - C_3$ - アルケニル、 $C_2 - C_3$ - アルキニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_3$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_3$ - ハロアルキニル、 $C_2 - C_3$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_3$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_2$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルカルボニルオキシであり；又は、

R^{B1} は、フェニルラジカル、ナフタレニルラジカル又は5員若しくは6員のヘテロアリアルラジカルであり（ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

水素、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルコキシ）；

R^{B2} は、水素又は $C_1 - C_2$ - アルキルであり；

Y は、硫黄又は酸素であり；

X は、炭素又は窒素であり；

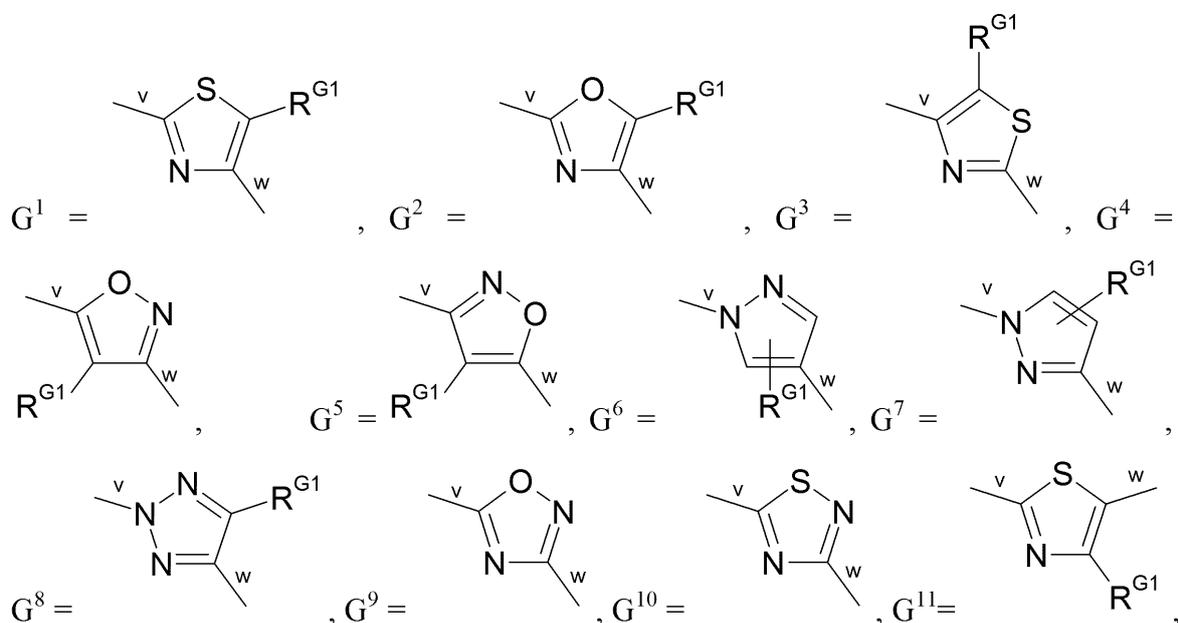
R^2 は、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり；

R^{10} は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり；

p は、0又は1であり；

G は、

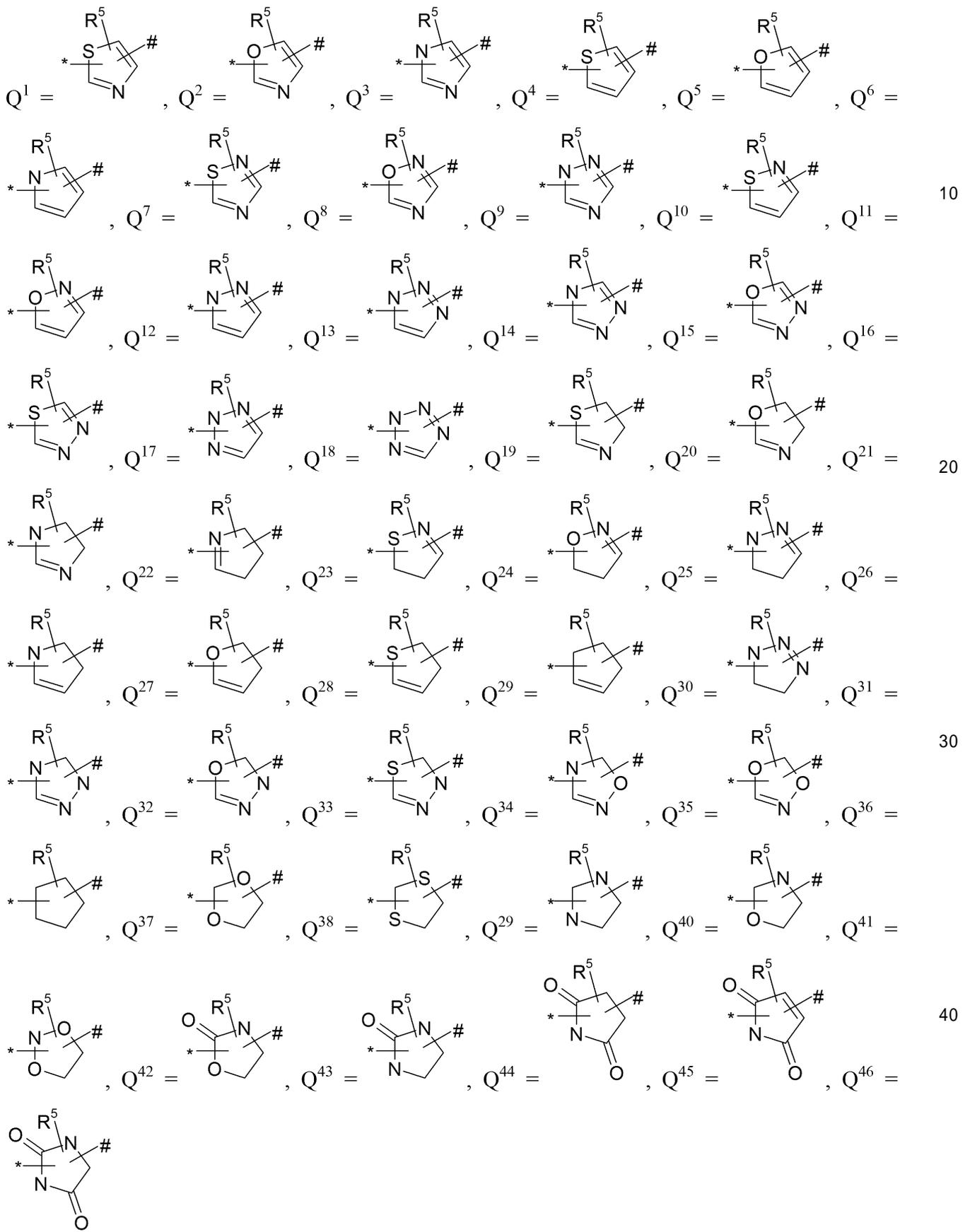
【化2】



であり；

R^{G1} は、水素、 $C_1 - C_3$ - アルキル又はハロゲンであり；

Q は、
【化 3】



R⁵ は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、以下のものであり：
Q の 5 員のヘテロシクリルの炭素に結合している場合：

水素、ハロゲン、シアノ、 $-NR^3R^4$ 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルキルチオ- C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ、 C_3-C_8 -ハロシクロアルコキシ、 C_3-C_8 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_2-C_6 -アルケニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロアルケニルオキシ、 C_2-C_6 -アルキニルオキシ、 C_2-C_6 -ハロアルキニルオキシ、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニルオキシ、 C_3-C_8 -シクロアルキルカルボニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_8 -シクロアルキルチオ、トリ(C_1-C_4 -アルキル)シリル；

Qの5員のヘテロシクリルの窒素に結合している場合：

水素、 $-C(=O)H$ 、 C_1-C_3 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル、又は、ベンジル；

R^3 は、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルキルカルボニル、 C_1-C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_1-C_4 -アルコキシカルボニル又は C_1-C_4 -ハロアルコキシカルボニルであり；

R^4 は、 C_1-C_3 -アルキル又は $-L^5R^1$ であり；

L^5 は、 $-C(=O)-$ 又は $S(=O)_2$ であり；

m は、0又は2であり；

L^2 は、直接結合、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-CHR^{20}$ - 又は $-NR^{21}$ - であり；

R^{20} は、水素、 C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -ハロアルキルであり；

R^{21} は、水素、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルカルボニル、 C_1-C_6 -アルコキシカルボニル又は C_1-C_6 -ハロアルコキシカルボニルであり；

R^1 は、 C_5-C_6 -シクロアルケニル又は C_3-C_8 -シクロアルキルであり（ここで、該 C_5-C_6 -シクロアルケニル又は C_3-C_8 -シクロアルキルは、いずれの場合にも、 Z^4 置換基で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^{1-1} からも選択される）；又は、

R^1 は、フェニルであり（ここで、該フェニルは、 Z^4 置換基で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^{1-2} からも選択される）；又は、

R^1 は、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン1-イル、デカリン2-イル、1H-インデン-1-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、インダン-3-イル、インダン-4-イル又はインダン-5-イルであり（ここで、これらは、それぞれ、置換基 Z^4 で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して

10

20

30

40

50

、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^{1-3} から選択される)；

R^1 は、ベンゾ縮合した置換されている5員又は6員のヘテロアリアルであり(ここで、該ヘテロアリアルは、少なくとも1の Z^4 置換基で置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、炭素上の該置換基は、それぞれ独立して、 Z^{1-5} から選択され、及び、窒素上の該置換基は、それぞれ独立して、 Z^2 から選択される)；又は、

R^1 は、 $C_5 - C_{15}$ -ヘテロシクリルであり(ここで、該ヘテロシクリルは、炭素上において、 Z^4 置換基で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、炭素上の該置換基は、それぞれ独立して、 Z^{1-6} から選択され、及び、窒素上の置換基は、それぞれ独立して、 Z^2 から

10

選択される)；
 Z^{1-1} は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ又は $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオであり；

Z^{1-2} は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニル、トリ($C_1 - C_4$ -アルキル)シリル又は $-L^3Z^3$ であり；

20

Z^{1-3} 及び Z^{1-5} は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル又は $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルホニルであり；

30

Z^{1-4} は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルケニル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルケニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルコキシ、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル又は $C_3 - C_8$ -シクロアルキルスルホニルであり；

40

Z^{1-6} は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロ

50

アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ又はフェニルであり；

Z^2 は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、フェニル、ベンジル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルカルボニル又は $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニルであり；

L^3 は、直接結合、 $-CH_2-$ 、硫黄、酸素又は $-(S=O)_2-$ であり；

Z^3 は、フェニルラジカル、ナフタレニル又は5員若しくは6員のヘテロアリーールラジカルであり（ここで、これらは、最大で2の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルキニル、 $C_2 - C_4$ - アルコキシアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、又は、 $C_1 - C_4$ - アルキルアミノ、ジ($C_1 - C_4$ - アルキル)アミノ；

窒素上の置換基：水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル、フェニル、ベンジル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、又は、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニル；

R^{13} 及び R^{14} は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

Z^4 は、 $-SH$ 、 $-C(=O)H$ 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_4 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_5 - C_6$ - アルコキシ、 $C_5 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_5 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_5 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_5 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_5 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニルアミノ、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=S)NR^{13}R^{14}$ 、シアノ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルチオ、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロア

10

20

30

40

50

ルキルカルボニルオキシ、 $C_2 - C_6$ - アルケニルアミノ、 $C_2 - C_6$ - アルキニルアミノ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルアミノ、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシアミノ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニル ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノ、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノ、 $-NR^{13}SO_2Z^3$ 、 $C_2 - C_6$ - アルケニルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキルカルボニル、 $-SF_5$ 、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシカルボニルアミノ、 $-NHC(=O)H$ 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ ($C_1 - C_4$ - アルキル) アミノカルボニル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル - $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $-C(=NOR^7)R^8$ 、 $-N=C(R^9)_2$ 、ジ ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノカルボニルアミノ、ジ ($C_1 - C_6$ - アルキル) アミノスルホニル、ジ ($C_1 - C_6$ - ハロアルキル) アミノ、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノスルホニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノカルボニルアミノ、トリ ($C_1 - C_4$ - アルキル) シリルオキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニルオキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルオキシ、トリ ($C_1 - C_4$ - アルキル) シリル - $C_2 - C_4$ - アルキニルオキシ、トリ ($C_1 - C_4$ - アルキル) シリル - $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニルカルボニルオキシ、シアノ - $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキルスルホニルオキシ、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキルスルホニルオキシ、 $C_2 - C_4$ - アルケニルスルホニルオキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルアミノカルボニルオキシ、 $C_2 - C_4$ - アルキニル - $C_3 - C_8$ - シクロアルキルオキシ、シアノカルボニルオキシ、シアノ - $C_2 - C_4$ - アルケニルオキシ、 $-OC(=O)NR^{13}R^{14}$ 、 $?NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{11}R^{12}$ 、 $-O(C=O)H$ 、 $-SCN$ 、 $C_1 - C_3$ - アルコキシスルホニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキルスルフィニル、シアノ ($C_1 - C_3$ - アルコキシ) - $C_1 - C_3$ - アルキル又は $-L^4Z^3$ であり；又は、

Z^4 は $C_1 - C_3$ - アルキルであり (ここで、該アルキルは、1 又は 2 の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

シアノ、 $-C(=O)H$ 、 $C_2 - C_4$ - アルケニルオキシ、 $C_2 - C_4$ - アルキニルオキシ、 $C_2 - C_4$ - アルケニルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルキニルチオ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルチオ、 $C_2 - C_4$ - アルケニルスルフィニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_2 - C_4$ - アルケニルスルホニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルアミノカルボニルオキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_3$ - アルキルアミノカルボニルアミノ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルカルボニルアミノ、 $C_1 - C_3$ - アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ、 $C_1 - C_3$ - アルキルチオカルボニルオキシ、シアノ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニル - $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_2 - C_4$ - アルキルチオ - $C_1 - C_3$ - アルコキシ、ジ ($C_1 - C_3$ - アルキル) アミノカルボニルアミノ、トリ ($C_1 - C_4$ - アルキル) シリルオキシ)；又は、

Z^4 は、 $C_1 - C_3$ - アルコキシであり (ここで、該アルコキシは、1 又は 2 の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

シアノ、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_3$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニルオキシ、 $-O(C=O)H$ 、 $C_1 - C_3$ - アルキルチオ、ヒドロキシル - $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ - アルコ

キシ - C₁ - C₃ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルキルスルホニル) ; 又は、

Z⁴ は、C₂ - C₄ - アルケニルオキシであり (ここで、該アルケニルオキシは、1 又は 2 の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

C₃ - C₈ - シクロアルキル、ヒドロキシル、C₁ - C₃ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₃ - アルキルカルボニル) ; 又は、

Z⁴ は、C₂ - C₄ - アルキニルオキシであり (ここで、該アルキニルオキシは、1 又は 2 の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

C₃ - C₈ - シクロアルキル、- Z³) ;

L⁴ は、- C(=O)O-、- C(=O)NH-、- OC(=O)-、?NH C(=O)- 又は - OCH₂C-C- であり ;

R⁷ は、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、ベンジル又は Z³ であり ;

R⁸ は、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルキル - C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - ハロアルキル - C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、ベンジル又はフェニルであり ;

R⁹ は、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり ;

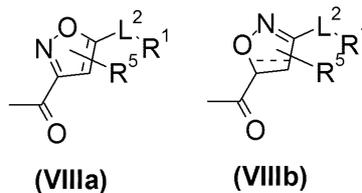
R¹¹ は、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル、シアノ - C₁ - C₃ - アルキル、ホルミル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、ベンジル、フェニル、C₁ - C₃ - アルキルカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルコキシカルボニル、C₁ - C₃ - アルコキシカルボニル、C₃ - C₄ - アルケニルオキシカルボニル、C₃ - C₄ - アルキニルオキシカルボニル、C₁ - C₃ - ハロアルキルカルボニル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルコキシカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルキルカルボニル、ジ(C₁ - C₃ - アルキル)アミノカルボニルであり ;

R¹² は、水素、C₃ - C₄ - アルケニル、C₃ - C₄ - アルキニル、シアノ - C₁ - C₃ - アルキル、ホルミル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、フェニル、C₁ - C₃ - アルキルカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルコキシカルボニル、C₁ - C₃ - アルコキシカルボニル、C₃ - C₄ - アルケニルオキシカルボニル、C₃ - C₄ - アルキニルオキシカルボニル、C₁ - C₃ - ハロアルキルカルボニル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキルカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルコキシカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルキルカルボニル、ジ(C₁ - C₃ - アルキル)アミノカルボニルである。

【請求項 3】

式(VIIIa)及び式(VIIIb)

【化 3】



〔式中、記号 L²、R¹ 及び R⁵ は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシド。

【請求項 4】

式(VIIa)及び式(VIIb)

10

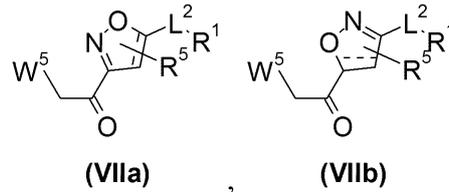
20

30

40

50

【化 4】



〔式中、記号 W^5 、 L^2 、 R^1 及び R^5 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有する〕

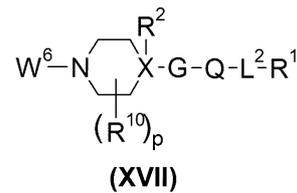
で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシド。

10

【請求項 5】

式 (XVII)

【化 5】



〔式中、記号 W^6 、 R^{10} 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定

20

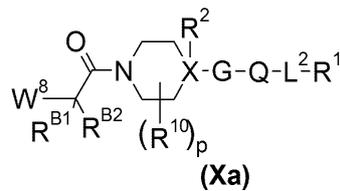
されている一般的な定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシド。

【請求項 6】

式 (Xa)

【化 6】



30

〔式中、記号 W^8 、 R^{L1} 、 R^{L2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、

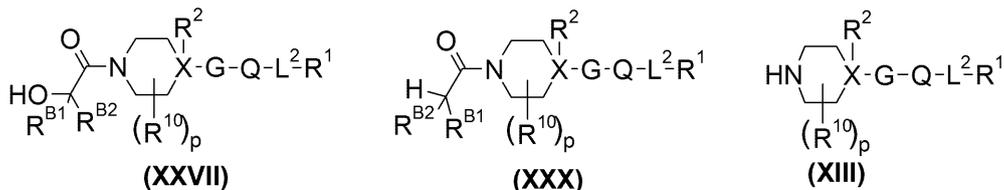
それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシド。

【請求項 7】

式 (XXVII)、式 (XXX) 及び式 (XIII)

【化 7】



40

〔式中、記号 W^8 、 R^{L1} 、 R^{L2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、

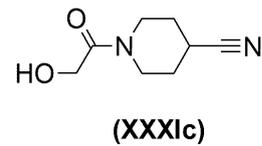
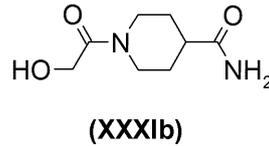
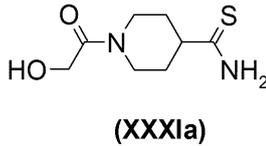
それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシド。

【請求項 8】

式 (XXXIa)、式 (XXXIb) 及び式 (XXXIc)

【化 8】



で表される化合物。

【請求項 9】

望ましくない微生物を防除する方法であって、請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) で表される化合物を有害な植物病原性菌類及び / 又はそれらの生息環境に施用することを特徴とする、前記方法。

10

【請求項 10】

微生物が菌類又は細菌類であることを特徴とする、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

望ましくない微生物を防除するための組成物であって、請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物を含んでいることを特徴とする、前記組成物。

【請求項 12】

望ましくない微生物を防除するための、請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) で表されるピス (ジフルオロメチル) ピラゾール誘導体の使用。

20

【請求項 13】

微生物が、シュードモナス科 (Pseudomonadaceae)、リゾビウム科 (Rhizobiaceae)、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae)、コリネバクテリウム科 (Corynebacteriaceae) 及びストレプトミセス科 (Streptomycetaceae) であることを特徴とする、請求項 12 に記載の使用。

【請求項 14】

請求項 1 若しくは 2 に記載の化合物又は請求項 11 に記載の組成物を使用することによって植物病原性菌類を防除する方法であって、前記化合物又は組成物を種子、植物若しくは植物の部分、果実又は植物がそこで生育している土壤に施用する、前記方法。

30

【請求項 15】

請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) で表される少なくとも 1 種類の化合物で処理された、種子。

【請求項 16】

トランスジェニック植物を処理するための、請求項 1 又は 2 に記載の式 (I) で表される化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、ヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体、それらの農薬的に活性な塩、それらの使用、並びに、植物の内部及び / 若しくは表面上又は植物の種子の内部及び / 若しくは表面上に存在する有害な植物病原性菌類を防除するための方法及び組成物、そのような組成物を調製する方法、並びに、処理された種子、並びに、農業において、園芸において、森林において、動物の衛生において、材料物質 (materials) の保護において、家庭内及び衛生の分野において、有害な植物病原性菌類を防除するためのそれらの使用に関する。本発明は、さらに、ヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体を調製するための調製方法にも関する。

40

【背景技術】

【0002】

ヘテロ環で置換されている特定のチアゾール類を殺菌性作物保護組成物として使用する

50

ことができることは、既に知られている（以下のものを参照されたい：WO 07/014290、WO 08/013925、WO 08/013622、WO 08/091594、WO 08/091580、WO 09/055514、WO 09/094407、WO 09/094445、WO 09/132785、WO 10/037479、WO 10/065579、WO 11/076510、WO 11/018415、WO 11/018401、WO 11/076699、WO 11/146182、WO 12/055837、WO 12/025557、WO 12/082580）。しかしながら、特に、比較的低施用量においては、上記化合物の殺菌効力は、必ずしも充分なものとは限らない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【特許文献1】国際特許出願公開第07/014290号

【特許文献2】国際特許出願公開第08/013925号

【特許文献3】国際特許出願公開第08/013622号

【特許文献4】国際特許出願公開第08/091594号

【特許文献5】国際特許出願公開第08/091580号

【特許文献6】国際特許出願公開第09/055514号

【特許文献7】国際特許出願公開第09/094407号

【特許文献8】国際特許出願公開第09/094445号

【特許文献9】国際特許出願公開第09/132785号

【特許文献10】国際特許出願公開第10/037479号

【特許文献11】国際特許出願公開第10/065579号

【特許文献12】国際特許出願公開第11/076510号

【特許文献13】国際特許出願公開第11/018415号

【特許文献14】国際特許出願公開第11/018401号

【特許文献15】国際特許出願公開第11/076699号

【特許文献16】国際特許出願公開第11/146182号

【特許文献17】国際特許出願公開第12/055837号

【特許文献18】国際特許出願公開第12/025557号

【特許文献19】国際特許出願公開第12/082580号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

現代の作物保護剤に求められる生態学的及び経済的な要求、例えば、活性スペクトル、毒性、選択性、施用量、残留物の形成及び望ましい製造方法などに関する要求は、継続的に増大しており、また、さらに、例えば抵抗性に関する問題も存在し得るので、少なくとも一部の領域において既知作物保護組成物よりも有利な点を有している新規作物保護組成物（特に、殺菌剤）を開発することは、絶えず求められている。

【課題を解決するための手段】

【0005】

驚くべきことに、本発明のヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体が、上記目標の少なくとも幾つかの面を達成し、そして、作物保護組成物として、特に、殺菌剤として、使用するのに適しているということが分かった。

【0006】

本発明は、式（I）

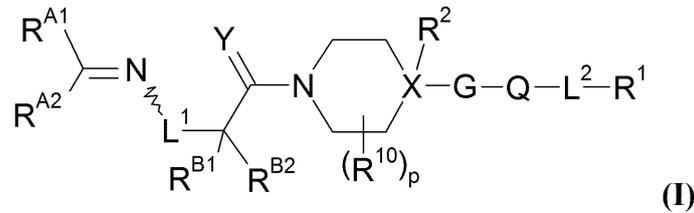
10

20

30

40

【化 1】



【 0 0 0 7 】

〔式中、ラジカルは、それぞれ、以下のように定義される：

R^{A1} は、水素、ハロゲン、シアノ、アミノ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ハロアルキルアミノ、ハロジアルキルアミノ、シクロアルキルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、アルキルスルホニルアミノ又はハロアルキルスルホニルアミノであり；

R^{A2} は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオであり；又は、

R^{A2} は、置換されていないか又は置換されているフェニル、場合によりベンゾ縮合していてもよい置換されている 5 員又は 6 員のヘテロシクリルであり（ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：ヒドロキシル、シアノ、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ）；又は、

R^{A1} と R^{A2} は、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素、ケイ素又は硫黄からなる群から選択される 1 個、2 個、3 個又は 4 個のヘテロ原子を含んでもよい 3 ~ 7 員の飽和又は部分的不飽和の環を形成し（ここで、場合により、1 個、2 個又は 3 個の炭素環員は、 $C(=O)$ 及び $C(=S)$ から選択され、並びに、硫黄環員は、 $S(=O)_s$ ($=NR^{A3}$)_f から選択され、並びに、ケイ素環員は、 $SiR^{A4}R^{A5}$ から選択され、ここで、該環は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{A3} は、水素、シアノ、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ハロアルキルアミノ又はフェニルであり；

R^{A4} 及び R^{A5} は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシであり；

s は、0、1 又は 2 であり；及び、

f は、0、1 又は 2 であり；及び、

$s + f$ は、0、1 又は 2 であり；

10

20

30

40

50

R^{A6} は、炭素環員上のハロゲン、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ又はハロアルコキシ、及び、窒素環員上のシアノ、アルキル又はアルコキシであり；

L^1 は、酸素、硫黄、 $-N(R^{L1})-$ 、 $-C(R^{L2})_2-$ 、 $-OC(R^{L2})_2-$ 、 $-SC(R^{L2})_2-$ 、 $-N(R^{L1})-C(R^{L2})_2-$ であり（ここで、左側の結合は式 (I) の窒素原子に結合しており、及び、右側の結合は式 (I) の窒素原子に結合している）；

R^{L1} は、水素、シアノ、アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルスルホニル又はハロアルキルスルホニルであり、又は、2つの R^{L1} ラジカルと R^{A2} ラジカルは、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含んでいてもよい5~7員の部分的不飽和の環を形成し（ここで、該環は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{L2} は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；

R^{B1} は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、アルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルアミノカルボニルオキシ、ジアルキルアミノカルボニルオキシであり；又は、

R^{B1} は、フェニルラジカル、ナフタレニルラジカル又は5員若しくは6員のヘテロアリアルラジカルであり（ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ）；

R^{B2} は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；又は、

2つの R^{B1} ラジカルと R^{B2} ラジカルは、それらが結合している炭素原子と一緒に、3~6員の飽和環を形成し；

Y は、硫黄又は酸素であり；

X は、炭素又は窒素であり；

R^2 は、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり；

R^{10} は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、水素、アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり；

p は、0、1又は2であり；

G は、5員ヘテロアリアルであり（ここで、該ヘテロアリアルは、Qで置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよい）；

Q は、飽和又は部分的不飽和又は完全不飽和の5員のヘテロシクリルであり（ここで、該ヘテロシクリルは、 L^2-R^1 で置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^5 から選択される）；

R^5 は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、以下のものであり；

Qの5員のヘテロシクリルの炭素に結合している場合：

オキソ、チオキソ、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-NR^3R^4$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロ

10

20

30

40

50

アルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、シクロアルキルアミノカルボニル、ハロアルコキシアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、アルケニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、シクロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、トリアルキルシリル、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ；

Qの5員のヘテロシクリルの窒素に結合している場合：

水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、フェニル、ベンジル、アルキルスルホニル、 $-C(=O)H$ 、アルコキシカルボニル、又は、アルキルカルボニル；

R^3 は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル又はハロアルコキシカルボニルであり；

R^4 は、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル又は $-L^5R^1$ であり；

L^5 は、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $S(=O)_m$ 又は CHR^{20} であり；

m は、0、1又は2であり；

L^2 は、直接結合、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_m-$ 、 $-CHR^{20}-$ 又は $-NR^{21}-$ であり；

R^{20} は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；

R^{21} は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル又はハロアルコキシカルボニルであり；

R^1 は、フェニル、ベンジル、ナフタレニル、場合によりベンゾ縮合していてもよい置換されている5員又は6員のヘテロアリアルであり（ここで、これらは、置換基 Z^4 で少なくとも1回置換されることができ、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^1 からも選択される）；又は、

R^1 は、5～8員の非芳香族（飽和又は部分的不飽和）の炭素環、5員、6員若しくは7員の非芳香族ヘテロシクリルラジカル又は8～11員の炭素環式若しくはヘテロ環式の二環式環であり（ここで、これらは、それぞれ、置換基 Z^4 で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、オキソ、チオキソ又は Z^1 からも選択される）；

Z^1 は、以下のものであり；

R^1 の炭素に結合している場合：

水素、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、シアノ、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシアルキル、アルキルシクロアルキル

10

20

30

40

50

、アルコキシ、アルキルシクロアルキルアルキル、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、ハロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルシクロアルキル、アルキルカルボニルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、トリアルキルシリル、及び、シクロアルキルアミノ、シクロアルケニル、ハロシクロアルケニル、シクロアルコキシアルキル、ハロシクロアルコキシ、シクロアルキルチオ、シクロアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアミノ、ハロシクロアルキルアルキル、シクロアルキルカルボニル、シクロアルキルスルホニル、又は、 $-L^3Z^3$ ；

10

R¹の窒素に結合している場合：

アルキル、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、又は、アルコキシ；

L³は、直接結合、 $-C(=O)-$ 、硫黄、酸素、 $-NR^{21}-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-S(=O)_m-$ 、 $-CHR^{20}-$ 、 $-CHR^{20}-CHR^{20}-$ 、 $-CR^{20}=CR^{20}-$ 、 $-OCHR^{20}-$ 、 $-CHR^{20}O-$ であり；

Z³は、フェニルラジカル、ナフタレニルラジカル又は5員若しくは6員のヘテロアールラジカルであり（ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

炭素上の置換基：ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、 $-SH$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルコキシアルキル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、トリシリルアルキル、又は、フェニル；

20

窒素上の置換基：水素、 $-C(=O)H$ 、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、シクロアルキル、ハロシクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、アルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、シクロアルキルスルホニル、フェニルスルホニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、 $-C(=O)NR^{13}R^{14}$ 、フェニル、又は、ベンジル；

30

R¹³及びR¹⁴は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

Z⁴は、 $-SH$ 、 $-C(=O)H$ 、ハロアルコキシアルキル、アルキルチオアルキル、アルキルスルフィニルアルキル、アルキルアミノアルキル、ハロアルキルアミノアルキル、シクロアルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルキルスルホニルアルキル、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、アルコキシアルコキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、アルキルスルホニルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、アルコキシアルコキシアルキル、アルキルカルボニルアルコキシ、シクロアルキルアミノカルボニル、シクロアルキルアルコキシカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、C₄-C₆-アルキルカルボニル、C₅-C₆-アルコキシ、C₅-C₆-ハロアルコキシ、C₅-C₆-アルキルチオ、C₅-C₆-ハロアルキルチオ、C₅-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₅-C₆-ハロアルキルスルホニル、 $-NHCN$ 、 $-SO_2NHCN$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=S)NR^{13}R^{14}$ 、 $-C(=O)NHCN$ 、シアノアルキル、アルケニルカルボニルオキシ、アルコキシアルキルチオ、ハロアルケニルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルアルキル、アルコキシア

40

50

ルキニル、アルキニルチオ、ハロシクロアルキルカルボニルオキシ、アルケニルアミノ、
 アルキニルアミノ、ハロアルキルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノ、アルコキシア
 ミノ、ハロアルコキシアミノ、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミ
 ノ、アルコキシカルボニルアミノ、アルキルカルボニル(アルキル)アミノ、ハロアルキ
 ルカルボニル(アルキル)アミノ、アルコキシカルボニル(アルキル)アミノ、 $-NR^{13}SO_2Z^3$ 、アルケニルチオ、ハロアルコキシカルボニル、アルコキシアルキルカルボ
 ニル、 $-SF_5$ 、ハロアルコキシカルボニルアミノ、 $-NHC(=O)H$ 、ジ(ハロアル
 キル)アミノアルキル、ハロシクロアルケニルオキシアルキル、アルコキシ(アルキル)
 アミノカルボニル、ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、アルコキシカルボニルアル
 コキシ、アルキルアミノチオカルボニルアミノ、シクロアルキルアルキルアミノアルキ
 ル、 $-C(=NOR^7)R^8$ 、アルキルチオカルボニル、シクロアルケニルオキシアルキ
 ル、アルコキシアルコキシカルボニル、ジアルキルアミノチオカルボニルアミノ、アルキ
 ルスルホニルアミノカルボニル、ハロアルコキシハロアルコキシ、ハロシクロアルコキシ
 アルキル、 $-N=C(R^9)_2$ 、ジアルキルアミノカルボニルアミノ、アルコキシアルケ
 ニル、アルコキシハロアルコキシ、アルキルチオカルボニルオキシ、ハロアルコキシアル
 コキシ、 $-OSO_2Z^3$ 、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルスルホニルオキシ、
 アルコキシハロアルキル、ジ(ハロアルキル)アミノ、 $-SO_2NR^3R^4$ 、 $-O(C=S)NR^{13}R^{14}$ 、 $-O(C=S)SR^9$ 、ジアルコキシアルキル、アルキルアミノカル
 ボニルアミノ、ハロアルコキシハロアルキル、アルキルアミノカルボニルアルキルアミ
 ノ、トリアルキルシリルアルキニルオキシ、トリアルキルシリルオキシ、トリアルキルシ
 リルアルキニル、シアノ(アルコキシ)アルキル、ジアルキルチオアルキル、 $-O(C=O)H$ 、 $-SCN$ 、アルコキシスルホニル、シクロアルキルスルフィニル、ハロシクロアル
 コキシカルボニル、アルキルシクロアルキルカルボニル、ハロシクロアルキルカルボニ
 ル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、シアノアルコキシカル
 ボニル、アルキルチオアルコキシカルボニル、アルキニルカルボニルオキシ、ハロアルキ
 ニルカルボニルオキシ、シアノカルボニルオキシ、シアノアルキルカルボニルオキシ、シ
 クロアルキルスルホニルオキシ、シクロアルキルアルキルスルホニルオキシ、ハロシクロ
 アルキルスルホニルオキシ、アルケニルスルホニルオキシ、アルキニルスルホニルオキシ
 、シアノアルキルスルホニルオキシ、ハロアルケニルスルホニルオキシ、ハロアルキニル
 スルホニルオキシ、アルキニルシクロアルキルオキシ、シアノアルケニルオキシ、シアノ
 アルキニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アルケニルオキシカルボニルオキシ、
 アルキニルオキシカルボニルオキシ、アルコキシアルキルカルボニルオキシ、 $-OC(=O)NR^{13}R^{14}$ 、 $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-NR^{11}R^{12}$ 、 $-C(=O)NR^{11}R^{12}$ 、 $-SO_2NR^{11}R^{12}$ 又は $-L^4Z^3$ であり；又は、
 Z^4 は、1又は2の置換基を含んでいるアルキルであり(ここで、該置換基は、それぞ
 れ独立して、以下のリストから選択される：
 シアノ、アルコキシカルボニル、 $-C(=N-R^9)R^8$ 、 $-C(=N-NR^{13}R^{14})R^8$ 、アルキルカルボニルアミノ、ハロアルキルカルボニルアミノ、ジアルキルカルボ
 ニルアミノ、アルキルカルボニルオキシ、 $-C(=O)H$ 、ベンジルオキシ、ベンゾイル
 オキシ、 $-C(=O)OH$ 、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルケニルオキシ
 シ、ハロアルキニルオキシ、ハロシクロアルコキシ、アルコキシアミノ、アルケニルチオ
 、アルキニルチオ、シクロアルキルチオ、ハロアルコキシアミノ、ハロアルキルチオ、アル
 ケニルスルフィニル、アルキニルスルフィニル、シクロアルキルスルフィニル、ハロアル
 キルスルフィニル、アルケニルスルホニル、アルキニルスルホニル、シクロアルキルス
 ルホニル、ハロアルキルスルホニル、アルコキシカルボニルオキシ、アルキルカルボニル
 オキシ、シクロアルキルカルボニルオキシ、ハロアルキルカルボニルオキシ、ハロアルケ
 ニルカルボニルオキシ、 $-SCN$ 、アルキルアミノカルボニルオキシ、アルキルカルボニ
 ル(アルキル)アミノ、アルコキシカルボニル(アルキル)アミノ、アルキルアミノカル
 ボニルアミノ、アルキルスルホニルオキシ、ハロアルコキシカルボニルアミノ、ハロアル
 キルカルボニル(アルキル)アミノ、ハロアルキルスルホニルオキシ、アルキルスルホニ

10

20

30

40

50

ルアミノ、ハロアルキルスルホニルアミノ、アルキルチオカルボニルオキシ、シアノアルコキシ、シクロアルキルアルコキシ、ベンジルオキシアルコキシ、アルコキシハロアルコキシ、アルコキシアルキルチオ、アルコキシアルキルスルフィニル、アルコキシアルキルスルホニル、アルコキシアルキルカルボニルオキシ、シクロアルコキシアルコキシ、ハロアルコキシアルコキシ、ハロアルコキシハロアルコキシ、アルコキシカルボニルアルコキシ、アルキルカルボニルアルコキシ、アルキルチオアルコキシ、ジアルキルアミノカルボニルアミノ、アルコキシアルコキシアルコキシ、トリアルキルシリルオキシ、トリアルキルシリルアルキニルオキシ、アルキニルシクロアルキルオキシ、シクロアルキルアルキニルオキシ、アルコキシカルボニルアルキニルオキシ、アリールアルキニルオキシ、アルキルアミノカルボニルアルキニルオキシ、ジアルキルアミノカルボニルアルキニルオキシ、アルケニルカルボニルオキシ、アルキニルカルボニルオキシ、ハロアルキニルカルボニルオキシ、シアノアルキルカルボニルオキシ、シクロアルキルスルホニルオキシ、シクロアルキルアルキルスルホニルオキシ、ハロシクロアルキルスルホニルオキシ、アルケニルスルホニルオキシ、アルキニルスルホニルオキシ、シアノアルキルスルホニルオキシ、ハロアルケニルスルホニルオキシ、ハロアルキニルスルホニルオキシ、ジアルキルアミノカルボニルオキシ、ハロアルキルアミノカルボニルオキシ、N - アルキル - N - ハロアルキルアミノカルボニルオキシ、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキニルオキシカルボニル、シアノアルキルオキシカルボニル、アルケニルオキシスルホニル、アルキニルオキシスルホニル) ; 又は、

Z⁴ は、1又は2の置換基を含んでいるアルケニルであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

トリアルキルシリル、シクロアルキル、シクロプロピリデニル、アルコキシ、トリアルキルシリルオキシ、アルキルカルボニルオキシ) ; 又は、

Z⁴ は、1又は2の置換基を含んでいるアルキニルであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

シクロアルキル、シクロプロピリデニル) ; 又は、

Z⁴ は、1又は2の置換基を含んでいるアルコキシであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

アルコキシカルボニル、シクロアルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、- O (C = O) H、アルキルチオ、ヒドロキシアルキル、トリアルキルシリル、シクロアルキルスルホニル、ハロアルキルスルホニル、ベンジルオキシ、アルコキシアルコキシ、アルキルスルホニル、シアノ) ; 又は、

Z⁴ は、1又は2の置換基を含んでいるアルケニルオキシであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

シクロアルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、ハロアルコキシ、ハロアルケニルオキシ、ハロアルキニルオキシ、シクロアルコキシ、シクロハロアルコキシ、アルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、ハロアルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキニルオキシカルボニル、アルキルカルボニル、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、シクロハロアルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、ハロアルケニルカルボニル、アルキニルカルボニル、ハロアルキニルカルボニル) ; 又は、

Z⁴ は、1又は2の置換基を含んでいるアルキニルオキシであり(ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される :

シクロアルキル、アルコキシカルボニル、- Z³、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル) ;

L⁴ は、- C (= O) O -、- C (= O) N R^{1 3} -、- O C (= O) -、- N R^{1 3} C (= O) -、- O C H₂ C - C - 又は - O C H₂ C H = C H - であり ;

R⁷ は、水素、アルキル、ハロアルキル、ベンジル又は Z³ であり ;

R⁸ は、水素、アルキル、ハロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキル、

10

20

30

40

50

アルキルシクロアルキル、ハロアルキルシクロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

R⁹ は、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロアルキル、シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり；

R¹¹ は、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、シアノアルキル、ホルミル、ハロアルキル、フェニル、アルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキルカルボニル、ハロシクロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノチオカルボニルであり；

R¹² は、アルケニル、アルキニル、アルコキシアルキル、シアノアルキル、ホルミル、水素、ハロアルキル、フェニル、アルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニル、アルケニルオキシカルボニル、アルキニルオキシカルボニル、ハロアルキルカルボニル、ハロシクロアルキルカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノチオカルボニルである；

で表される化合物、並びに、式 (I) で表される化合物の塩、金属錯体及び N - オキシドを提供する。

【 0 0 0 8 】

本発明は、さらにまた、式 (I) で表される化合物の殺菌剤としての使用も提供する。

【 0 0 0 9 】

本発明の式 (I) で表されるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体並びにその塩、金属錯体及び N - オキシドは、有害な植物病原性菌類を防除するのに非常に適している。上記で記載した本発明の化合物は、特に、強力な殺菌活性を示し、作物保護において、家庭内及び衛生の分野において、並びに、材料物質の保護において、使用することができる。

【 0 0 1 0 】

式 (I) で表される化合物は、純粋な形態で存在し得るか、又は、種々の可能な異性体形態の混合物として、特に、立体異性体 (例えば、E 及び Z、トレオ及びエリトロ) の混合物として、及び、さらに、光学異性体 (例えば、R 異性体及び S 異性体又はアトロプ異性体) の混合物として、及び、適切な場合には、さらに、互変異性体の混合物としても存在し得る。E 異性体と Z 異性体の両方、及び、トレオ異性体とエリトロ異性体の両方、及び、さらに、光学異性体、これら異性体の任意の望ましい混合物、及び、可能な互変異性体が特許請求されている。

【 発明を実施するための形態 】

【 0 0 1 1 】

式 (I) で表される本発明化合物のラジカル定義は、好ましくは、さらに好ましくは、及び、最も好ましくは、以下の定義を有している：

R^{A1} は、好ましくは、水素、シアノ、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₂ - C₄ - ハロアルケニル、C₂ - C₄ - ハロアルキニル、C₂ - C₄ - アルコキシアルキル、C₂ - C₄ - アルキルチオアルキル、C₁ - C₃ - アルキルカルボニル、C₁ - C₃ - ハロアルキルカルボニル、C₁ - C₃ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₂ - C₄ - アルケニルオキシ、C₂ - C₄ - ハロアルケニルオキシ、C₂ - C₄ - アルキニルオキシ、C₂ - C₄ - ハロアルキニルオキシ、C₂ - C₄ - アルコキシアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、C₂ - C₄ - ジアルキルアミノ、C₁ - C₄ - ハロアルキルアミノ、C₂ - C₄ - ハロジアルキルアミノ、C₃ - C₆ - シクロアルキルであり、及び、さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、プロパン - 2 - イル、t - ブチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシカルボニル、エトキ

10

20

30

40

50

シカルボニル又はシクロプロピルであり；

R^{A2} は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシであり；又は、

R^{A2} は、好ましくは、置換されていないか又は置換されているフェニル、場合によりベンゾ縮合していてもよい置換されている5員又は6員のヘテロシクリルであり（ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：ヒドロキシル、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ）；

R^{A2} は、さらに好ましくは、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、イソ-ブチル、1,3-ベンゾジオキサソリル又は置換されていないか若しくは置換されているフェニルであり（ここで、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：ヒドロキシル、シアノ、フッ素、塩素、臭素、メチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ）；

R^{A1} と R^{A2} は、好ましくは、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個、3個又は4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3~6員の飽和又は部分的不飽和の環を形成し（ここで、1個の炭素環員は、場合により、 $C(=O)$ 及び $C(=S)$ から選択され、ここで、該環は、置換基を含んでいなくてもよいか又は1、2若しくは3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{A6} は、好ましくは、炭素環員上のハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ又は $C_1 - C_2$ - ハロアルコキシ、及び、窒素環員上のシアノ、 $C_1 - C_2$ - アルキル又は $C_1 - C_2$ - アルコキシであり；

L^1 は、好ましくは、酸素、硫黄、 $-N(R^{L1})-$ であり；

R^{L1} は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_2$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $-C(=O)CH_3$ 、 $-C(=O)CF_3$ 、 $C(=O)OCH_3$ であり、又は、2つの R^{L1} ラジカルと R^{A2} ラジカルは、それらが結合している炭素原子と一緒に、酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される1個、2個又は3個のヘテロ原子を含んでいてもよい5~7員の部分的不飽和の環を形成し（ここで、該環は、置換されていないか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 R^{A6} から選択される）；

R^{B1} は、好ましくは、水素、シアノ、ヒドロキシル、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_2 - C_3$ - アルケニル、 $C_2 - C_3$ - アルキニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_3$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_3$ - ハロアルキニル、 $C_2 - C_3$ - アルキルカルボニル、 $C_2 - C_3$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_2$ - アルキルカルボニルオキシ、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルカルボニルオキシであり；又は、

R^{B1} は、好ましくは、フェニルラジカル、ナフタレニルラジカル又は5員若しくは6員のヘテロアリールラジカルであり（ここで、これらは、それぞれ、0、1、2又は3の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される）；

水素、フッ素、塩素、臭素、 $C_1 - C_3$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシ、 $C_1 - C_3$ - ハロアルコキシ）；

R^{B2} は、好ましくは、水素又は $C_1 - C_2$ - アルキルであり、及び、さらに好ましくは、水素であり；

Y は、好ましくは、硫黄又は酸素であり、及び、さらに好ましくは、酸素であり；

X は、好ましくは、炭素又は窒素であり、及び、さらに好ましくは、炭素であり；

R^2 は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり、及び、さらに好ましくは、水素、フッ素、メトキシ又はヒドロキシルであり、及び、最も好ましくは、水素であ

10

20

30

40

50

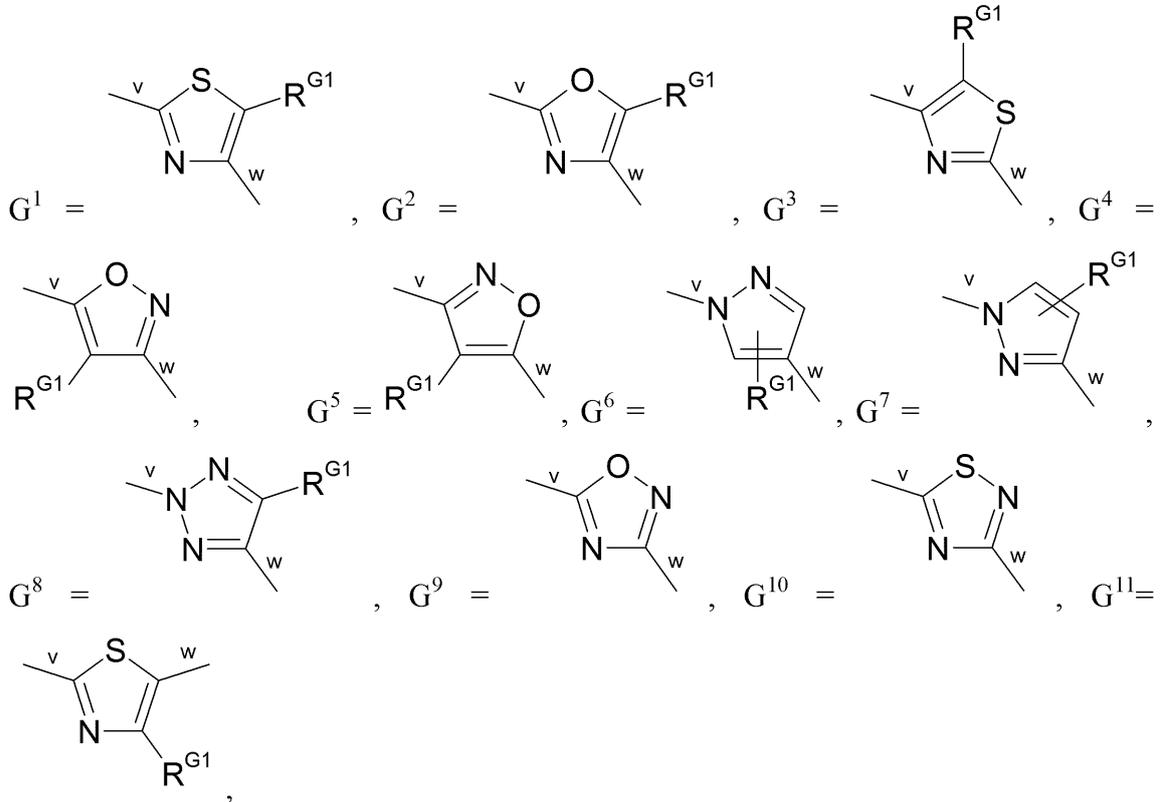
り；

R^{10} は、好ましくは、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_2$ - アルコキシ、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシルであり、及び、さらに好ましくは、水素、フッ素、メトキシ又はヒドロキシルであり；

p は、好ましくは、0 ~ 1 であり、及び、さらに好ましくは、0 であり；

G は、好ましくは、

【化 2】



10

20

30

【0012】

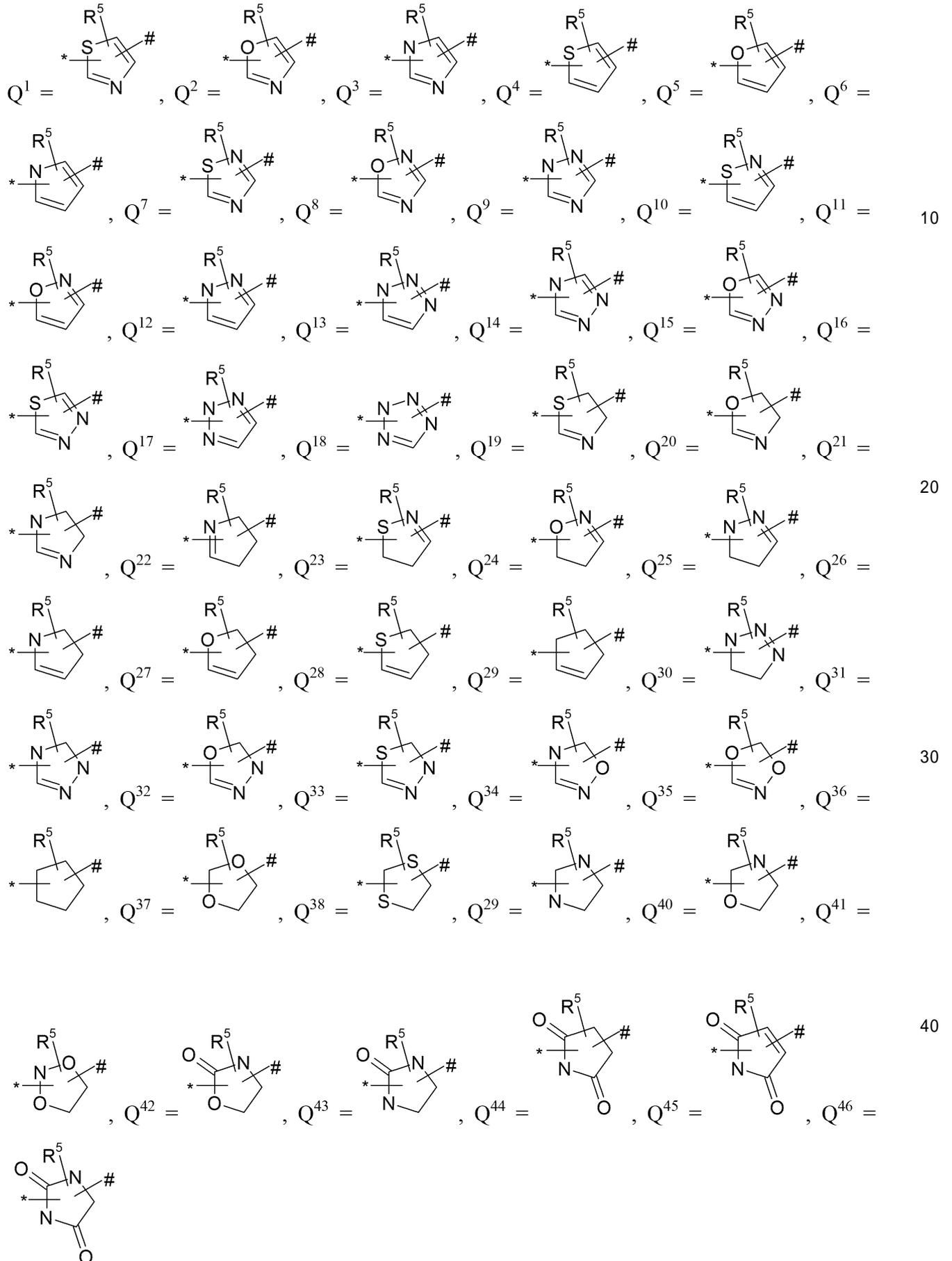
〔ここで、「 v 」によって特定されている結合は直接 X に結合しており、及び、「 w 」によって特定されている結合は直接 Q に結合している〕であり；

G は、さらに好ましくは、 G^1 、 G^2 又は G^3 であり、及び、最も好ましくは、 G^1 であり；

R^{G1} は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_3$ - アルキル又はハロゲンであり、及び、さらに好ましくは、水素であり；

Q は、好ましくは、

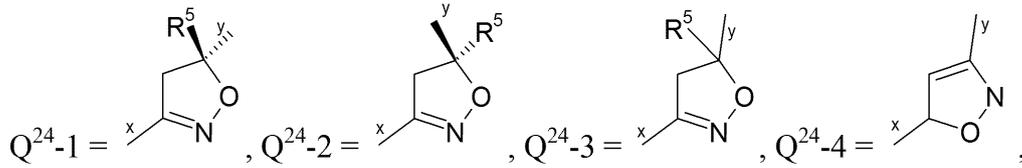
【化 3】



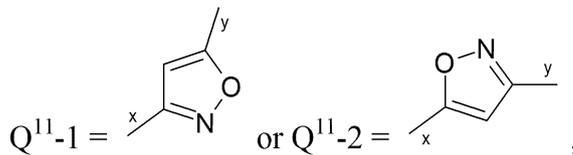
〔ここで、「*」によって特定されている結合は直接G又はL²に結合しており、及び、「#」によって特定されている結合は直接L²又はGに結合している；又は、ここで、「*」によって特定されている結合は直接L²に結合しており、及び、「#」によって特定されている結合は、同時に、直接Gに結合している〕であり；

Qは、さらに好ましくは、

【化4】



10



【0014】

〔ここで、「x」によって特定されている結合は直接Gに結合しており、及び、「y」によって特定されている結合は直接L²に結合している〕であり；

20

R⁵は、好ましくは、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、以下のものであり；

Qの5員のヘテロシクリルの炭素に結合している場合：

水素、ハロゲン、シアノ、-NR³R⁴、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₃-C₈-シクロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルキルチオ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルコキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニルオキシ、C₃-C₈-シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₃-C₈-シクロアルキルチオ、トリ(C₁-C₄-アルキル)シリル；

30

Qの5員のヘテロシクリルの窒素に結合している場合：

40

水素、-C(=O)H、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル、又は、ベンジル；

R⁵は、さらに好ましくは、水素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル又はメトキシメチルであり；又は、

R⁵は、最も好ましくは、水素であり；

R³は、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₄-アルキルカルボニル、C₁-C₄-ハロアルキルカルボニル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル又はC₁-C₄-ハロアルコキシカルボニルであり；

R⁴は、好ましくは、C₁-C₃-アルキル又は-L⁵R¹であり；

50

L^5 は、好ましくは、 $-C(=O)-$ 又は $S(=O)_2$ であり；
 L^2 は、好ましくは、直接結合、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-CHR^2$
 R^2 0 - 又は $-NR^2$ 1 - であり、及び、さらに好ましくは、直接結合、 $-C(=O)-$ 、
 $-CHR^2$ 0 - 又は $-NR^2$ 1 - であり、及び、最も好ましくは、直接結合であり；
 m は、好ましくは、0 又は 2 であり；
 R^2 0 は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルであ
り、及び、さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、トリフルオロメチルであり；
 R^2 1 は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 C
 $_1 - C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ - ア
ルコキシカルボニル又は $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシカルボニルであり、及び、さらに好
ましくは、水素又はメチルであり；
 R^1 は、好ましくは、 $C_5 - C_6$ - シクロアルケニル又は $C_3 - C_8$ - シクロアルキル
であり（ここで、該 $C_5 - C_6$ - シクロアルケニル又は $C_3 - C_8$ - シクロアルキルは、
いずれの場合にも、置換基 Z^4 で少なくとも 1 回置換されており、及び、それ以外は、置
換されていないか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独
立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^1 - 1 から選択される）、及び、さ
らに好ましくは、置換されているシクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロペンチル
、シクロヘキシル又はシクロヘプチルであり（ここで、これらは、それぞれ、1 又は 2 の
置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から少なくとも
1 回選択され、及び、場合により、以下のリストから選択される：メチル、エチル、メト
キシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、エチニル、メチルカルボニルオキシ、エチルカル
ボニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、又は、トリフルオロメチルチオ）；又は、
 R^1 は、好ましくは、フェニルであり（ここで、該フェニルは、置換基 Z^4 で少なくと
も 1 回置換されており、及び、それ以外は、置換されていないか又は置換されて
いてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合
により、 Z^1 - 2 から選択される）、及び、さらに好ましくは、フェニルであり（ここで
、該フェニルは、1、2 又は 3 の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞ
れ独立して、 Z^4 から少なくとも 1 回選択され、及び、場合により、以下のリストから選
択される：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、メチ
ル、エチル、 n - プロピル、1 - メチルエチル、 n - ブチル、1, 1 - ジメチルエチル、
1, 2 - ジメチルエチル、エテニル、エチニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル
、トリクロロメチル、ジクロロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、 n - プロ
ポキシ、1 - メチルエトキシ、1, 1 - ジメチルエトキシ、メチルカルボニル、エチルカル
ボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 n - プロポキシカルボニル、1 -
メチルエトキシカルボニル、1, 1 - ジメチルエトキシカルボニル、1 - メチルカルボ
ニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、メチルスルホニル、又は、 $-L^3R^3$ ）、及び、最
も好ましくは、フェニルであり（ここで、該フェニルは、1、2 又は 3 の置換基を含むこ
とができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：
ホルミル、メトキシメトキシ、2 - メトキシエトキシ、アリルオキシ、2 - フルオロプロ
パ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、2 - クロロプロパ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、3 - ク
ロロプロパ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、2 - プロモプロパ - 2 - エン - 1 - イルオキシ
、2 - メチルプロパ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、3, 3 - ジクロロプロパ - 2 - エン -
1 - イルオキシ、3, 3 - ジクロロ - 2 - フルオロプロパ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、
ブタ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、ブタ - 3 - エン - 2 - イルオキシ、ブタ - 3 - エン -
1 - イルオキシ、3 - クロロブタ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、3 - メチルブタ - 2 - エ
ン - 1 - イルオキシ、4, 4, 4 - トリフルオロブタ - 2 - エン - 1 - イルオキシ、プロ
パ - 2 - イン - 1 - イルオキシ、3 - クロロプロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ、3 - プ
ロモプロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ、ブタ - 2 - イン - 1 - イルオキシ、ペンタ - 2
- イン - 1 - イルオキシ、2 - フルオロ - 2 - メチルプロパノイルオキシ、3, 3, 3 -
トリフルオロプロパノイルオキシ、シクロプロピルカルボニルオキシ、シクロヘキシルカ

10

20

30

40

50

ルボニルオキシ、(1-クロロシクロプロピル)カルボニルオキシ、ブタ-2-エノイルオキシ、アクリロイルオキシ、ベンゾイルオキシ、2-フルオロベンゾイルオキシ、3-フルオロベンゾイルオキシ、4-フルオロベンゾイルオキシ、シアノメトキシ、メチルスルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、シクロプロピルスルホニルオキシ、2-メトキシエトキシメチル、アリルオキシメチル、プロパ-2-イン-1-イルオキシメチル、メチルスルホニルメチル、メチルカルボニルアミノメチル、メチルスルホニルアミノメチル、 $-C(=NOH)H$ 、 $-C(=NOCH_3)H$ 、 $-C(=NOCH_2CH_3)H$ 、 $-C(=NOCH(CH_3)CH_3)H$ 、 $-C(=NOH)CH_3$ 、 $-C(=NOCH_3)CH_3$ 、 $-C(=NOCH_2CH_3)CH_3$ 、 $-C(=NOCH(CH_3)CH_3)CH_3$ 、ジメチルアミノスルホニル、 $C(=O)NH_2$ 、エチルアミノスルホニル、トリメチルシリルエチニル、ジエチルアミノスルホニル、メチルアミノスルホニル、トリメチルシリルオキシ、トリメチルシリルプロパ-2-イン-1-イルオキシ、トリフルオロメチルアミノ、ジメチルアミノカルボニルアミノ、 $-C(=O)OH$ 、1,1-ジメチルエチルカルボニルアミノ、クロロメチルカルボニルアミノ、トリフルオロメチルカルボニルアミノ、1,1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、1-メチルエトキシカルボニルアミノ、トリフルオロメチルカルボニルアミノ、メチルカルボニルアミノ、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニルアミノ、イソ-プロポキシカルボニルアミノ、1-メチルエチルカルボニルアミノ、メチルスルホニルアミノ、又は、フェニルスルホニルアミノ、3-プロモプロパ-2-エン-1-イルオキシ；

及び、さらなる置換基は、場合により、以下のリストから選択される：フッ素、塩素、メチル、トリフルオロメチル、メトキシ)；又は、

R^1 は、好ましくは、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン1-イル、デカリン2-イル、1H-インデン-1-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、インダン-3-イル、インダン-4-イル又はインダン-5-イルであり(ここで、これらは、それぞれ、置換基 Z^4 で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^1-3 からも選択される)；

R^1 は、さらに好ましくは、ナフタレン-1-イル、ナフタレン-2-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-2-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-1-イル、5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル、デカリン1-イル、デカリン2-イル、1H-インデン-1-イル、2,3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル、1H-インデン-2-イル、1H-インデン-3-イル、1H-インデン-4-イル、1H-インデン-5-イル、1H-インデン-6-イル、1H-インデン-7-イル、インダン-1-イル、インダン-2-イル、インダン-3-イル、インダン-4-イル又はインダン-5-イルであり(ここで、これらは、それぞれ、置換基 Z^4 で少なくとも1回置換されることができ、並びに、それ以外は、 Z^4 と場合によりメチル、メトキシ、シアノ、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素からなる群からそれぞれ独立して選択されるさらなる置換基を含むことができ、その際、さらに好ましい変形態様においては、合計で、最大3つの置換基が存在している)；又は、

R^1 は、好ましくは、5員又は6員のヘテロアリアルラジカルであり(ここで、該ヘテロアリアルラジカルは、置換基 Z^4 で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいか又は置換されていてもよく、その際、炭素上の該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から選択され、及び、場合により、 Z^1-4 からも選択され、

窒素上の該置換基は、それぞれ独立して、 Z^2 から選択される) ;

R^1 は、さらに好ましくは、フラン - 2 - イル、フラン - 3 - イル、チオフェン - 2 - イル、チオフェン - 3 - イル、イソオキサゾール - 3 - イル、イソオキサゾール - 4 - イル、イソオキサゾール - 5 - イル、ピロール - 1 - イル、ピロール - 2 - イル、ピロール - 3 - イル、オキサゾール - 2 - イル、オキサゾール - 4 - イル、オキサゾール - 5 - イル、チアゾール - 2 - イル、チアゾール - 4 - イル、チアゾール - 5 - イル、イソチアゾール - 3 - イル、イソチアゾール - 4 - イル、イソチアゾール - 5 - イル、ピラゾール - 1 - イル、ピラゾール - 3 - イル、ピラゾール - 4 - イル、イミダゾール - 1 - イル、イミダゾール - 2 - イル、イミダゾール - 4 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル、1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 4 - イル、ピリジン - 2 - イル、ピリジン - 3 - イル、ピリジン - 4 - イル、ピリダジン - 3 - イル、ピリダジン - 4 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピリミジン - 5 - イル又はピラジン - 2 - イルであり(ここで、これらは、それぞれ、1又は2の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、 Z^4 から少なくとも1回選択され、及び、場合により、以下のリストから選択される :

炭素上の置換基 : フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、メチル、エチル、*n* - プロピル、1 - メチルエチル、*n* - ブチル、1, 1 - ジメチルエチル、1, 2 - ジメチルエチル、エテニル、エチニル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、ジクロロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、*n* - プロポキシ、1 - メチルエトキシ、1, 1 - ジメチルエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n* - プロポキシカルボニル、1 - メチルエトキシカルボニル、1, 1 - ジメチルエトキシカルボニル、メチルカルボニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、又は、メチルスルホニル ;

窒素上の置換基 : メチル、エチル、*n* - プロピル、 $-C(=O)H$ 、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル、又は、2 - プロピニル) ; 又は、

R^1 は、好ましくは、ベンゾ縮合した置換されている5員又は6員のヘテロアリアルであり(ここで、該ヘテロアリアルは、少なくとも1の置換基 Z^4 で置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、炭素上の該置換基は、それぞれ独立して、 $Z^1 - 5$ から選択され、及び、窒素上の該置換基は、それぞれ独立して、 Z^2 から選択される)、及び、さらに好ましくは、インドール - 1 - イル、インドール - 2 - イル、インドール - 3 - イル、インドール - 4 - イル、インドール - 5 - イル、インドール - 6 - イル、インドール - 7 - イル、ベンゾイミダゾール - 1 - イル、ベンゾイミダゾール - 2 - イル、ベンゾイミダゾール - 4 - イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、インダゾール - 1 - イル、インダゾール - 3 - イル、インダゾール - 4 - イル、インダゾール - 5 - イル、インダゾール - 6 - イル、インダゾール - 7 - イル、インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 7 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 4 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 7 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 4 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル、1

, 3 - ベンゾオキサゾール - 7 - イル、キノリン - 2 - イル、キノリン - 3 - イル、キノリン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イル又はイソキノリン - 8 - イルであり（ここで、これらは、それぞれ、最大で2の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：炭素上の置換基：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、メトキシ；窒素上の置換基：メチル、エチル、n - プロピル、- C (= O) H、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル、又は、2 - プロピニル）；又は

10

R¹ は、好ましくは、C₅ - C₁₅ - ヘテロシクリルであり（ここで、該ヘテロシクリルは、炭素上において、置換基 Z⁴ で少なくとも1回置換されており、及び、それ以外は、置換されていなくてもよいが又は置換されていてもよく、その際、該置換基は、場合により炭素上では、それぞれ独立して、Z¹ - ⁶ から選択され、及び、窒素上の置換基は、それぞれ独立して、Z² から選択される）；

R¹ は、さらに好ましくは、ピペリジン - 1 - イル、ピペリジン - 2 - イル、ピペリジン - 3 - イル、ピペリジン - 4 - イル、ピペラジン - 1 - イル、ピペラジン - 2 - イル、ピペラジン - 3 - イル、モルホリン - 1 - イル、モルホリン - 2 - イル、モルホリン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 2 - イル、テトラヒドロピラン - 3 - イル、テトラヒドロピラン - 4 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 1 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 2 - イル、1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノキサリン - 1 - イル、インドリン - 1 - イル、イソインドリン - 2 - イル、デカヒドロキノリン - 1 - イル又はデカヒドロイソキノリン - 2 - イルであり（ここで、これらは、それぞれ、1又は2の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、Z⁴ から少なくとも1回選択され、及び、場合により、以下のリストから選択される：

20

炭素上の置換基：フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、メチル、メトキシ；

窒素上の置換基：メチル、エチル、n - プロピル、- C (= O) H、メチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、クロロメチルカルボニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、フェニルスルホニル、フェニル、又は、2 - プロピニル；

30

Z¹ - ¹ は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、ヒドロキシル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ又はC₁ - C₆ - ハロアルキルチオであり；

Z¹ - ² は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルケニル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₃ - C₈ - シクロアルコキシ、C₃ - C₈ - ハロシクロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₆ - ハロアルキルスルホニル、C₃ - C₈ - シクロアルキルスルホニル、トリ (C₁ - C₄ - アルキル) シリル又は - L³ Z³ であり；

40

Z¹ - ³ 及び Z¹ - ⁵ は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、

50

C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルチオ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル又はC₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニルであり；

Z¹⁻⁴ は、水素、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルケニル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルケニル、C₁ - C₆ - アルコキシ - C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₃ - C₈ - シクロアルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₃ - C₈ - シクロアルコキシ、C₃ - C₈ - ハロシクロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ、C₃ - C₆ - シクロアルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルスルホニル、C₁ - C₆ - ハロアルキルスルホニル又はC₃ - C₈ - シクロアルキルスルホニルであり；

Z¹⁻⁶ は、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、シアノ、ハロゲン、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - ハロアルコキシ、C₁ - C₆ - アルキルチオ、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニルオキシ、C₁ - C₆ - ハロアルキルチオ又はフェニルであり；

Z² は、同一であるか又は異なっており、そして、独立して、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、フェニル、ベンジル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、- C(=O)H、C₁ - C₃ - ハロアルキルカルボニル又はC₁ - C₃ - アルキルカルボニルであり；

L³ は、好ましくは、直接結合、- CH₂ -、硫黄、酸素又は - (S=O)₂ - であり、及び、さらに好ましくは、直接結合であり；

Z³ は、好ましくは、フェニルラジカル、ナフタレニル又は5員若しくは6員のヘテロアリアルラジカルであり（ここで、これらは、最大で2の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、- SH、C₁ - C₄ - アルキル、C₂ - C₄ - アルケニル、C₂ - C₄ - アルキニル、C₁ - C₄ - ハロアルキル、C₂ - C₄ - ハロアルケニル、C₂ - C₄ - ハロアルキニル、C₂ - C₄ - アルコキシアルキル、C₁ - C₆ - アルキルカルボニル、C₁ - C₆ - ハロアルキルカルボニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₂ - C₆ - アルケニルオキシ、C₂ - C₆ - アルキニルオキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、又は、C₁ - C₄ - アルキルアミノ、ジ(C₁ - C₄ - アルキル)アミノ；

窒素上の置換基：水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、フェニル、ベンジル、C₁ - C₄ - ハロアルキルスルホニル、C₁ - C₆ - アルコキシカルボニル、C₁ - C₆ - ハロアルコキシカルボニル、フェニルスルホニル、C₁ - C₄ - アルキルスルホニル、

10

20

30

40

50

- C(=O)H、又は、C₁-C₃-アルキルカルボニル)；及び、

Z³は、さらに好ましくは、フェニルラジカルであり(ここで、該フェニルラジカルは、最大で2の置換基を含むことができ、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される)；

塩素、臭素、ヨウ素、フッ素、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、アミノ、-SH、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、エテニル、プロペン-2-イル、エチニル、プロピン-2-イル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メトキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、1-メチルエトキシカルボニル、1,1-ジメチルエトキシカルボニル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、1,1-ジメチルエトキシ、トリフルオロメトキシ、エテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、エチニルオキシ、2-プロピニルオキシ、メチルチオ、エチルチオ、トリフルオロメチルチオ、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルチオニル、1-メチルエチルチオ、トリフルオロメチルスルホニル、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、1-メチルエチルアミノ、1,1-ジメチルエチルアミノ、又は、ジメチルアミノ)；又は、

Z³は、さらに好ましくは、ナフタレニルであり；

R¹³及びR¹⁴は、好ましくは、同一であるか又は異なっており、そして、それぞれ独立して、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、ベンジル又はフェニルであり、及び、さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、n-ブチル又は1,1-ジメチルエチルであり；

Z⁴は、好ましくは、-SH、-C(=O)H、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオアルキル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルスルホニル-C₁-C₆-アルキル、C₄-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニル、C₃-C₆-シクロアルコキシカルボニル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₃-C₆-シクロアルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₅-C₆-アルコキシ、C₅-C₆-ハロアルコキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニルオキシ、C₃-C₆-シクロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルカルボニル-C₁-C₆-アルコキシ、C₅-C₆-アルキルチオ、C₅-C₆-ハロアルキルチオ、C₅-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₅-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルアミノ、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-C(=S)NR¹³R¹⁴、シアノ-C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニルカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルチオ、C₃-C₈-ハロシクロアルキルカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルケニルアミノ、C₂-C₆-アルキニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルコキシアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシアミノ、C₁-C₆-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルキルカルボニル(C₁-C₆-アルキル)アミノ、C₁-C₆-ハロアルキルカルボニル(C₁-C₆-アルキル)アミノ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル(C₁-C₆-アルキル)アミノ、-NR¹³SO₂Z³、C₂-C₆-アルケニルチオ、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルカルボニル、-SF₅、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニルアミノ、-NHC(=O)H、C₁-C₆-アルコキシ(C₁-C₄-アルキル)アミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルコキシ、-C(=NOR⁷)R⁸、-N=C(R⁹)₂、ジ(C₁-C₆-

10

20

30

40

50

アルキル)アミノカルボニルアミノ、ジ(C₁-C₆-アルキル)アミノスルホニル、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ、C₁-C₆-アルキルアミノスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、トリ(C₁-C₄-アルキル)シリルオキシ、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルキルスルホニルオキシ、トリ(C₁-C₄-アルキル)シリル-C₂-C₄-アルキニルオキシ、トリ(C₁-C₄-アルキル)シリル-C₂-C₄-アルキニル、C₂-C₄-アルキニルカルボニルオキシ、シアノ-C₁-C₃-アルキルカルボニルオキシ、C₃-C₈-シクロアルキルスルホニルオキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルキルスルホニルオキシ、C₂-C₄-アルケニルスルホニルオキシ、C₁-C₃-アルキルアミノカルボニルオキシ、C₂-C₄-アルキニル-C₃-C₈-シクロアルキルオキシ、シアノカルボニルオキシ、シアノ-C₂-C₄-アルケニルオキシ、-OC(=O)NR¹₃R¹₄、-NR¹₁R¹₂、-C(=O)NR¹₁R¹₂、-SO₂NR¹₁R¹₂、-O(C=O)H、-SCN、C₁-C₃-アルコキシスルホニル、C₃-C₈-シクロアルキルスルフィニル、シアノ(C₁-C₃-アルコキシ)-C₁-C₃-アルキル又は-L⁴Z³であり；又は、

Z⁴は、好ましくは、C₁-C₃-アルキルであり(ここで、該アルキルは、1又は2の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

シアノ、-C(=O)H、C₂-C₄-アルケニルオキシ、C₂-C₄-アルキニルオキシ、C₂-C₄-アルケニルチオ、C₂-C₄-アルキニルチオ、C₁-C₃-ハロアルキルチオ、C₂-C₄-アルケニルスルフィニル、C₂-C₄-アルキニルスルフィニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルフィニル、C₂-C₄-アルケニルスルホニル、C₂-C₄-アルキニルスルホニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₃-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₃-ハロアルキルカルボニルオキシ、C₁-C₃-アルキルアミノカルボニルオキシ、C₁-C₃-アルキルカルボニルアミノ、C₁-C₃-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₃-ハロアルキルカルボニルアミノ、C₁-C₃-アルキルスルホニルアミノ、C₁-C₃-ハロアルキルスルホニルアミノ、C₁-C₃-アルキルチオカルボニルオキシ、シアノ-C₁-C₃-アルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキルチオ、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキルスルフィニル、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルキルスルホニル、C₁-C₃-ハロアルコキシ-C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-アルキルカルボニル-C₁-C₃-アルコキシ、C₂-C₄-アルキルチオ-C₁-C₃-アルコキシ、ジ(C₁-C₃-アルキル)アミノカルボニルアミノ、トリ(C₁-C₄-アルキル)シリルオキシ)；又は、

Z⁴は、好ましくは、C₁-C₃-アルコキシであり(ここで、該アルコキシは、1又は2の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

シアノ、C₁-C₃-アルキルカルボニルオキシ、C₁-C₃-アルコキシカルボニル、C₃-C₈-シクロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルカルボニルオキシ、-O(C=O)H、C₁-C₃-アルキルチオ、ヒドロキシル-C₁-C₃-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキルスルホニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₃-アルコキシ-C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-アルキルスルホニル)；又は、

Z⁴は、好ましくは、C₂-C₄-アルケニルオキシであり(ここで、該アルケニルオキシは、1又は2の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

C₃-C₈-シクロアルキル、ヒドロキシル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-アルコキシカルボニル、C₁-C₃-アルキルカルボニル)；又は、

Z⁴は、好ましくは、C₂-C₄-アルキニルオキシであり(ここで、該アルキニルオキシは、1又は2の置換基を含んでおり、その際、該置換基は、それぞれ独立して、以下のリストから選択される：

C₃-C₈-シクロアルキル、-Z³)；

10

20

30

40

50

Z⁴ は、さらに好ましくは、ホルミル、メトキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、ア
 リルオキシ、2-フルオロプロパ-2-エン-1-イルオキシ、2-クロロプロパ-2-
 エン-1-イルオキシ、3-クロロプロパ-2-エン-1-イルオキシ、2-ブロモプロ
 パ-2-エン-1-イルオキシ、2-メチルプロパ-2-エン-1-イルオキシ、3,3
 -ジクロロプロパ-2-エン-1-イルオキシ、3,3-ジクロロ-2-フルオロプロパ
 -2-エン-1-イルオキシ、ブタ-2-エン-1-イルオキシ、ブタ-3-エン-2-
 イルオキシ、ブタ-3-エン-1-イルオキシ、3-クロロブタ-2-エン-1-イルオ
 キシ、3-メチルブタ-2-エン-1-イルオキシ、4,4,4-トリフルオロブタ-2
 -エン-1-イルオキシ、プロパ-2-イン-1-イルオキシ、3-クロロプロパ-2-
 イン-1-イルオキシ、3-ブロモプロパ-2-イン-1-イルオキシ、ブタ-2-イン
 -1-イルオキシ、ペンタ-2-イン-1-イルオキシ、2-フルオロ-2-メチルプロ
 パノイルオキシ、3,3,3-トリフルオロプロパノイルオキシ、シクロプロピルカルボ
 ニルオキシ、シクロヘキシルカルボニルオキシ、(1-クロロシクロプロピル)カルボ
 ニルオキシ、ブタ-2-エノイルオキシ、アクリロイルオキシ、シアノメトキシ、メチルス
 ルホニルオキシ、エチルスルホニルオキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、シク
 ロプロピルスルホニルオキシ、2-メトキシエトキシメチル、アリルオキシメチル、プロ
 パ-2-イン-1-イルオキシメチル、メチルスルホニルメチル、メチルカルボニルアミ
 ノメチル、メチルスルホニルアミノメチル、-C(=NOR⁷)R⁸、ジメチルアミノス
 ルホニル、エチルアミノスルホニル、トリメチルシリルエチニル、ジエチルアミノスルホ
 ニル、メチルアミノスルホニル、トリメチルシリルオキシ、トリメチルシリルプロパ-2
 -イン-1-イルオキシ、トリフルオロメチルアミノ、ジメチルアミノカルボニルアミノ
 、-C(=O)OH、-NHC(=O)H、-C(=O)NH₂、-C(=S)NR¹³
 R¹⁴、1,1-ジメチルエチルカルボニルアミノ、クロロメチルカルボニルアミノ、トリ
 フルオロメチルカルボニルアミノ、1,1-ジメチルエトキシカルボニルアミノ、エチ
 ルカルボニルアミノ、1-メチルエトキシカルボニルアミノ、トリフルオロメチルカルボ
 ニルアミノ、メチルカルボニルアミノ、メトキシカルボニルアミノ、エトキシカルボニル
 アミノ、イソ-プロポキシカルボニルアミノ、1-メチルエチルカルボニルアミノ、メチ
 ルスルホニルアミノ又はフェニルスルホニルアミノ、3-ブロモプロパ-2-エン-1-
 イルオキシ、又は、-L⁴Z³であり；

L⁴ は、好ましくは、-C(=O)O-、-C(=O)NH-、-OC(=O)-、-
 NHC(=O)-又は-OCH₂C-Cであり、及び、さらに好ましくは、-OCH₂
 C-C又は-C(=O)O-であり；

R⁷ は、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、ベン
 ジル又はZ³であり、及び、さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、n-プロピル、
 1-メチルエチル、n-ブチル、1,1-ジメチルエチル又は2-メチルプロピルであり
 ；

R⁸ は、好ましくは、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃
 -C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-
 C₄-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₄-ハロアルキル-C₃-C₈
 -シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロ
 アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、ベンジル又はフェニルであり、及び、さらに好まし
 くは、水素、メチル、エチル、n-プロピル、1-メチルエチル、n-ブチル、1,1-
 ジメチルエチル又は2-メチルプロピルであり；

R⁹ は、好ましくは、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-
 アルキニル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、ベンジル又はフェ
 ニルであり、及び、さらに好ましくは、水素、メチル、エチル、n-プロピル、1-メ
 チルエチル、n-ブチル又は1,1-ジメチルエチルであり；

R¹¹ は、好ましくは、C₃-C₄-アルケニル、C₃-C₄-アルキニル、シアノ-
 C₁-C₃-アルキル、ホルミル、C₁-C₃-ハロアルキル、ベンジル、フェニル、C
 1-C₃-アルキルカルボニル、C₃-C₈-シクロアルコキシカルボニル、C₁-C₃

10

20

30

40

50

- アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_4$ - アルケニルオキシカルボニル、 $C_3 - C_4$ - アルキニルオキシカルボニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキルカルボニル、ジ ($C_1 - C_3$ - アルキル) アミノカルボニルであり；

$R^{1,2}$ は、好ましくは、水素、 $C_3 - C_4$ - アルケニル、 $C_3 - C_4$ - アルキニル、シアノ - $C_1 - C_3$ - アルキル、ホルミル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、フェニル、 $C_1 - C_3$ - アルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルコキシカルボニル、 $C_1 - C_3$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 - C_4$ - アルケニルオキシカルボニル、 $C_3 - C_4$ - アルキニルオキシカルボニル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキルカルボニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルコキシカルボニル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキルカルボニル、ジ ($C_1 - C_3$ - アルキル) アミノカルボニルである。

10

【0015】

本発明に従って使用し得るヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体は、概して、式 (I) によって定義される。上記及び下記において示されている式 (I) のラジカル定義は、式 (I) で表される最終生成物に適用され、さらに、全ての中間体にも等しく適用される (下記「調製方法及び中間体の説明」も参照されたい)。

上記及び下記において、ラジカルについて概して記載されているか又は好ましい範囲において記載されている定義及び説明は、必用に応じて互いに組み合わせることも可能である、即ち、特定の範囲と好ましいものの範囲の間の組合せを包含する。それらは、最終生成物に適用され、同様に、前駆物質及び中間体にも適用される。さらに、個々の定義は適合しないこともあり得る。

20

【0016】

好ましいのは、式 (I) [式中、全てのラジカルは、上記で記載されている好ましい定義を有する] で表される化合物である。

【0017】

特に好ましいのは、式 (I) [式中、全てのラジカルは、上記で記載されているさらに好ましい定義を有する] で表される化合物である。

【0018】

極めて特に好ましいのは、式 (I) [式中、全てのラジカルは、上記で記載されている最も好ましい定義を有する] で表される化合物である。

30

【0019】

好ましいのは、さらにまた、式 (I) [式中、

R^{A1} は、メチル、トリフルオロメチル又はシクロプロピルであり；

R^{A2} は、メチル又はプロパン - 2 - イルであり；

R^{A2} は、1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル、4 - エトキシフェニル、3 - フルオロフェニル、3, 4 - ジメチルフェニル、3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル、3, 4 - ジメチルフェニル又は4 - エトキシフェニルであり；

L^1 は、酸素であり；

R^{B1} 及び R^{B2} は、それぞれ、水素であり；

Y は、酸素であり；

G は、 G^1 であり；

R^{G1} は、水素であり；

Q は、 $Q^{2,4} - 3$ であるか、又は、Q は、 $Q^{1,1} - 1$ であり；

R^5 は、水素であるか、又は、 R^5 は、メチルであり；

L^2 は、直接結合であり；

R^1 は、2, 3 - ジクロロ - 4 - (プロパン - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R^1 は、2, 3 - ジクロロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

40

R^1 は、2, 3 - ジフルオロ - 4 - (プロパン - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルで

50

あり；又は、

R¹ は、2, 3 - ジフルオロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；

又は、

R¹ は、2, 3 - ジフルオロ - 4 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2, 4 - ジクロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 4 - ジクロロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 4 - ジフルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 4 - ジフルオロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 4 - ジフルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジクロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジクロロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジクロロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジクロロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジフルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジフルオロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジフルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジフルオロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジフルオロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 5 - ジフルオロ - 4 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジクロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジクロロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジクロロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジクロロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジフルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジフルオロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジフルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジフルオロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジフルオロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2, 6 - ジフルオロ - 4 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - (アリルオキシ) - 3, 4 - ジクロロフェニルであり；又は、

10

20

30

40

50

R¹ は、2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) - 4 - (トリフルオロメチル) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - クロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - クロロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - クロロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - クロロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - クロロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - クロロ - 4 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - フルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - フルオロ - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - フルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - フルオロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - フルオロ - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - フルオロ - 4 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - ホルミル - 3 - メチルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - ホルミル - 4 - メチルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - ホルミル - 5 - メチルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - ホルミル - 6 - メチルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - ホルミルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - メチル - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - メチル - 3 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - メチル - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - メチル - 4 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3, 4 - ジフルオロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3, 5 - ジフルオロフェニルであり；

又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3, 6 - ジフルオロフェニルであり；

又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3 - クロロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3 - フルオロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 3 - メチルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 4, 5 - ジフルオロフェニルであり；

又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 4, 6 - ジフルオロフェニルであり；

又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 4 - クロロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 4 - フルオロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 4 - メチルフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 5, 6 - ジフルオロフェニルであり；

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 5 - クロロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 5 - フルオロフェニルであり；又は、

R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ) メチル] - 5 - メチルフェニルであり；又は、

10

20

30

40

50

- R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ)メチル] - 6 - クロロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ)メチル] - 6 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ)メチル] - 6 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(ヒドロキシイミノ)メチル] フェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 3, 4 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 3, 5 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 3, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 3 - クロロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 3 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 3 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 4, 5 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 4, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 4 - クロロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 4 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 4 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 5, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 5 - クロロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 5 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 5 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 6 - クロロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 6 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] - 6 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メトキシイミノ)メチル] フェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又は、
R¹ は、2 - [(メチルスルホニル)オキシ] - 4 - (トリフルオロメチル)フェニル
であり；又は、
R¹ は、3, 4 - ジクロロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)フェニルであ
り；又は、
R¹ は、3, 4 - ジクロロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又は、
R¹ は、3, 4 - ジフルオロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)フェニルで
あり；又は、
R¹ は、3, 4 - ジフルオロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；
又は、
R¹ は、3, 4 - ジフルオロ - 2 - ホルミルフェニルであり；又は、
R¹ は、3, 5 - ジクロロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)フェニルであ
り；又は、
R¹ は、3, 5 - ジクロロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又は、
R¹ は、3, 5 - ジクロロ - 4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)フェニルであ
り；又は、
R¹ は、3, 5 - ジクロロ - 4 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又は、
R¹ は、3, 5 - ジフルオロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ)フェニルで

- R¹ は、3 - [(メトキシイミノ)メチル] - 5 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、3 - [(メトキシイミノ)メチル] - 5 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、3 - [(メトキシイミノ)メチル] - 6 - クロロフェニルであり；又は、
R¹ は、3 - [(メトキシイミノ)メチル] - 6 - フルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、3 - [(メトキシイミノ)メチル] - 6 - メチルフェニルであり；又は、
R¹ は、3 - [(メトキシイミノ)メチル] フェニルであり；又は、
R¹ は、3 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又は、
R¹ は、4, 5 - ジクロロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであ
り；又は、
R¹ は、4, 5 - ジクロロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又
は、
R¹ は、4, 5 - ジクロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであ
り；又は、
R¹ は、4, 5 - ジクロロ - 3 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又
は、
R¹ は、4, 5 - ジフルオロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルで
あり；又は、
R¹ は、4, 5 - ジフルオロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；
又は、
R¹ は、4, 5 - ジフルオロ - 2 - ホルミルフェニルであり；又は、
R¹ は、4, 5 - ジフルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルで
あり；又は、
R¹ は、4, 5 - ジフルオロ - 3 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；
又は、
R¹ は、4, 5 - ジフルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、
R¹ は、4, 6 - ジクロロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであ
り；又は、
R¹ は、4, 6 - ジクロロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又
は、
R¹ は、4, 6 - ジクロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであ
り；又は、
R¹ は、4, 6 - ジクロロ - 3 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；又
は、
R¹ は、4, 6 - ジフルオロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルで
あり；又は、
R¹ は、4, 6 - ジフルオロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；
又は、
R¹ は、4, 6 - ジフルオロ - 2 - ホルミルフェニルであり；又は、
R¹ は、4, 6 - ジフルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルで
あり；又は、
R¹ は、4, 6 - ジフルオロ - 3 - [(メチルスルホニル)オキシ] フェニルであり；
又は、
R¹ は、4, 6 - ジフルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2, 3 - ジクロロフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2, 5 - ジクロロフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2, 5 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2, 6 - ジクロロフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2 - クロロフェニルであり；又は、

10

20

30

40

50

- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2 - フルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 2 - メチルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3, 5 - ジクロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3, 5 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3, 6 - ジクロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3 - クロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3 - フルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) - 3 - メチルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (アリルオキシ) フェニルであり；又は、 10
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2, 3 - ジクロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2, 3 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2, 5 - ジクロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2, 5 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2, 6 - ジクロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2 - クロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2 - フルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 2 - メチルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3, 5 - ジクロロフェニルであり；又は、 20
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3, 5 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3, 6 - ジクロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3, 6 - ジフルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3 - クロロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3 - フルオロフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) - 3 - メチルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (シアノメトキシ) フェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - クロロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又 30
- は、
- R¹ は、4 - クロロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ]フェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - クロロ - 2 - ホルミルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - クロロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又 30
- は、
- R¹ は、4 - クロロ - 3 - [(メチルスルホニル)オキシ]フェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - クロロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - フルオロ - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；
- 又は、
- R¹ は、4 - フルオロ - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ]フェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - フルオロ - 2 - ホルミルフェニルであり；又は、 40
- R¹ は、4 - フルオロ - 3 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；
- 又は、
- R¹ は、4 - フルオロ - 3 - [(メチルスルホニル)オキシ]フェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - フルオロ - 3 - ホルミルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - ホルミル - 2 - メチルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - ホルミル - 3 - メチルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - ホルミルフェニルであり；又は、
- R¹ は、4 - メチル - 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニルであり；又 50
- は、
- R¹ は、4 - メチル - 2 - [(メチルスルホニル)オキシ]フェニルであり；又は、

で表される化合物、並びに、その農薬的に活性な塩、金属錯体及びN - オキシドである。

【0020】

上記で特定されているラジカルの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることができる。さらに、個々の定義は適合しないこともあり得る。

【0021】

上記で定義した置換基の種類に応じて、式(I)で表される化合物は、酸性特性又は塩基性特性を有していて、無機酸若しくは有機酸との、又は、塩基との、又は、金属イオンとの、塩を形成することが可能であり、場合により、分子内塩又は付加体も形成することが可能である。式(I)で表される化合物が、アミノ基を有しているか、アルキルアミノ基を有しているか又は塩基性特性を誘導する別の基を有している場合、そのような化合物は、酸と反応させて塩を生成させることが可能であり、又は、そのような化合物は、合成によって直接的に塩として得られる。式(I)で表される化合物が、ヒドロキシル基を有しているか、カルボキシル基を有しているか、又は、酸性特性を誘導する別の基を有している場合、そのような化合物は、塩基と反応させて塩を生成させることが可能である。適切な塩基は、例えば、アルカリ金属及びアルカリ土類金属の水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩、特に、ナトリウム、カリウム、マグネシウム及びカルシウムの水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩であり、さらに、アンモニア、 $C_1 - C_4$ -アルキル基を有する第1級アミン、第2級アミン及び第3級アミン、 $C_1 - C_4$ -アルカノールのモノアルカノールアミン、ジアルカノールアミン及びトリアルカノールアミン、コリン及びクロロコリンも適している。

10

20

【0022】

このようにして得ることができる塩も、同様に、殺菌特性を有している。

【0023】

無機酸の例は、ハロゲン化水素酸(例えば、フッ化水素、塩化水素、臭化水素及びヨウ化水素)、硫酸、リン酸及び硝酸、並びに、酸性塩(例えば、 $NaHSO_4$ 及び $KHSO_4$)である。有用な有機酸としては、例えば、ギ酸、炭酸及びアルカン酸(例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸及びプロピオン酸)、並びに、さらに、グリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、ケイ皮酸、シュウ酸、飽和又は一不飽和又は二不飽和の $C_6 - C_{20}$ -脂肪酸、アルキル硫酸モノエステル、アルキルスルホン酸(1~20個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキルラジカルを有しているスルホン酸)、アリールスルホン酸又はアリールジスルホン酸(1又は2のスルホン酸基を有している、フェニル及びナフチルなどの芳香族ラジカル)、アルキルホスホン酸(1~20個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキルラジカルを有しているホスホン酸)、アリールホスホン酸又はアリールジホスホン酸(1又は2のホスホン酸ラジカルを有している、フェニル及びナフチルなどの芳香族ラジカル)などを挙げることができ、ここで、前記アルキルラジカル及びアリールラジカルは、さらなる置換基も有することができる(例えば、p-トルエンスルホン酸、サリチル酸、p-アミノサリチル酸、2-フェノキシ安息香酸、2-アセトキシ安息香酸など)。

30

【0024】

有用な金属イオンは、特に、第2主族の元素(特に、カルシウム及びマグネシウム)のイオン、第3及び第4主族の元素(特に、アルミニウム、スズ及び鉛)のイオン、並びに、さらに、第1~第8遷移族の元素(特に、クロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛など)のイオンである。特に好ましいのは、第4周期の元素の金属イオンである。ここで、該金属は、可能なさまざまな原子価で存在することができる。

40

【0025】

場合により置換されていてもよい基は、1置換又は多置換されることが可能であり、多置換の場合における当該置換基は、同一であっても又は異なってもよい。

【0026】

上記式中に記載されている記号の定義においては、概して以下の置換基を代表する集合語を使用した：

50

ハロゲン： フッ素、塩素、臭素、及び、ヨウ素、並びに、好ましくは、フッ素、塩素、臭素、並びに、さらに好ましくは、フッ素、塩素。

【0027】

アルキル： 1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和ヒドロカルビルラジカル、例えば（限定するものではないが）、C₁-C₆-アルキル、例えば、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、及び、1-エチル-2-メチルプロピル。この定義は、例えばアルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、ハロアルキル又はハロアルキルチオなどのように、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、シクロアルキルアルキル、ヒドロキシアルキルなど）の一部としてのアルキルにも当てはまる。該アルキルが、例えばアルキルシクロアルキルなどにおけるように、複合置換基の末端にある場合、当該複合置換基の最初に存在している部分（例えば、シクロアルキル）は、アルキルによって、1置換され得るか、又は、独立して、同一であるように又は異なるように、多置換され得る。同様のことは、別のラジカル（例えば、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシル、ハロゲン、ホルミルなど）が末端にある複合置換基にも当てはまる。

10

20

【0028】

アルケニル： 2～8個（好ましくは、2～6個）の炭素原子を有し且ついずれかの位置に1つの二重結合を有している直鎖又は分枝鎖の不飽和ヒドロカルビルラジカル、例えば（限定するものではないが）、C₂-C₆-アルケニル、例えば、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル、及び、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル。

30

40

50

この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルケニルなど）の一部としてのアルケニルにも当てはまる。

【0029】

アルキニル： 2～8個（好ましくは、2～6個）の炭素原子を有し且ついずれかの位置に1つの三重結合を有している直鎖又は分枝鎖のヒドロカルビル基、例えば（限定するものではないが）、C₂-C₆-アルキニル、例えば、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1, 1-ジメル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメル-2-ブチニル、1, 1-ジメル-3-ブチニル、1, 2-ジメル-3-ブチニル、2, 2-ジメル-3-ブチニル、3, 3-ジメル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、及び、1-エチル-1-メチル-2-プロピニル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルキニルなど）の一部としてのアルキニルにも当てはまる。

10

【0030】

アルコキシ： 1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和アルコキシラジカル、例えば（限定するものではないが）、C₁-C₆-アルコキシ、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、1-メチルエトキシ、ブトキシ、1-メチル-プロポキシ、2-メチルプロポキシ、1, 1-ジメルエトキシ、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、2, 2-ジメルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1, 1-ジメルプロポキシ、1, 2-ジメルプロポキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1, 1-ジメルブトキシ、1, 2-ジメルブトキシ、1, 3-ジメルブトキシ、2, 2-ジメルブトキシ、2, 3-ジメルブトキシ、3, 3-ジメルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1, 1, 2-トリメチルプロポキシ、1, 2, 2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ及び1-エチル-2-メチルプロポキシ。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルコキシ、アルキニルアルコキシなど）の一部としてのアルコキシにも当てはまる。

20

30

【0031】

アルキルチオ： 1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和アルキルチオラジカル、例えば（限定するものではないが）、C₁-C₆-アルキルチオ、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ、1, 1-ジメルエチルチオ、ペンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、2, 2-ジメルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1, 1-ジメルプロピルチオ、1, 2-ジメルプロピルチオ、1-メチルペンチルチオ、2-メチルペンチルチオ、3-メチルペンチルチオ、4-メチルペンチルチオ、1, 1-ジメルブチルチオ、1, 2-ジメルブチルチオ、1, 3-ジメルブチルチオ、2, 2-ジメルブチルチオ、2, 3-ジメルブチルチオ、3, 3-ジメルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1, 1, 2-トリメチルプロピルチオ、1, 2, 2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオ、及び、1-エチル-2-メチルプロピルチオ。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルキルチオなど）の一部としてのアルキルチオにも当てはまる。

40

50

【0032】

アルコキシカルボニル：カルボニル基（-CO-）を介して当該骨格に結合している、1～6個（好ましくは、1～3個）の炭素原子を有するアルコキシ基（上記で記載したとおり）。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、シクロアルキルアルコキシカルボニルなど）の一部としてのアルコキシカルボニルにも当てはまる。

【0033】

アルキルスルフィニル：1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和アルキルスルフィニルラジカル、例えば（限定するものではないが）、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル、ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル、2-メチルプロピルスルフィニル、1,1-ジメチルエチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1,1-ジメチルプロピルスルフィニル、1,2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1,1-ジメチルブチルスルフィニル、1,2-ジメチルブチルスルフィニル、1,3-ジメチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルブチルスルフィニル、2,3-ジメチルブチルスルフィニル、3,3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニル、及び、1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルキルスルフィニルなど）の一部としてのアルキルスルフィニルにも当てはまる。

10

20

【0034】

アルキルスルホニル：1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖の飽和アルキルスルホニルラジカル、例えば（限定するものではないが）、C₁-C₆-アルキルスルホニル、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、1-メチルエチルスルホニル、ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチルプロピルスルホニル、1,1-ジメチルエチルスルホニル、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1,1-ジメチルプロピルスルホニル、1,2-ジメチルプロピルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1,1-ジメチルブチルスルホニル、1,2-ジメチルブチルスルホニル、1,3-ジメチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルブチルスルホニル、2,3-ジメチルブチルスルホニル、3,3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルホニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル、及び、1-エチル-2-メチルプロピルスルホニル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、アルキルスルホニルアルキルなど）の一部としてのアルキルスルホニルにも当てはまる。

30

40

【0035】

シクロアルキル：3～10個（好ましくは、3～8個、及び、さらに好ましくは、3～6個）の炭素環員を有する単環式飽和ヒドロカルビル基、例えば（限定するものではないが）、シクロプロピル、シクロペンチル、及び、シクロヘキシル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、シクロアルキルアルキルなど）の一部としてのシクロアルキルにも当てはまる。

【0036】

50

シクロアルケニル： 3～10個（好ましくは、3～8個、及び、さらに好ましくは、3～6個）の炭素環員を有する単環式部分的不飽和ヒドロカルビル基、例えば（限定するものではないが）、シクロプロペニル、シクロペンテニル、及び、シクロヘキセニル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、シクロアルケニルアルキルなど）の一部としてのシクロアルケニルにも当てはまる。

【0037】

シクロアルコキシ： 3～10個（好ましくは、3～8個、及び、さらに好ましくは、3～6個）の炭素環員を有する単環式飽和シクロアルキルオキシラジカル、例えば（限定するものではないが）、シクロプロピルオキシ、シクロペンチルオキシ、及び、シクロヘキシルオキシ。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、シクロアルコキシアルキルなど）の一部としてのシクロアルコキシにも当てはまる。

10

【0038】

ハロアルキル： 1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキル基（上記で記載したとおり）において、これらの基内の水素原子の一部又は全部が上記で記載したハロゲン原子で置き換えられ得るもの、例えば（限定するものではないが）、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、例えば、クロロメチル、プロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-プロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、及び、1, 1, 1-トリフルオロプロパ-2-イル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルキルアミノアルキルなど）の一部としてのハロアルキルにも当てはまる。

20

【0039】

ハロアルケニル及びハロアルキニルは、アルキル基の代わりにアルケニル基及びアルキニル基が置換基の一部として存在していることを除いて、ハロアルキルと同様に定義される。

【0040】

ハロアルコキシ： 1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルコキシ基（上記で記載したとおり）において、これらの基内の水素原子の一部又は全部が上記で記載したハロゲン原子で置き換えられ得るもの、例えば（限定するものではないが）、 $C_1 - C_3$ -ハロアルコキシ、例えば、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-プロモエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2, 2, 2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、及び、1, 1, 1-トリフルオロプロパ-2-オキシ。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルコキシアルキルなど）の一部としてのハロアルコキシにも当てはまる。

30

40

【0041】

ハロアルキルチオ： 1～8個（好ましくは、1～6個、及び、さらに好ましくは、1～3個）の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキルチオ基（上記で記載したとおり）において、これらの基内の水素原子の一部又は全部が上記で記載したハロゲン原子で置き換えられ得るもの、例えば（限定するものではないが）、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキルチオ、例えば、クロロメチルチオ、プロモメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、クロロ

50

フルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1 - クロロエチルチオ、1 - ブロモエチルチオ、1 - フルオロエチルチオ、2 - フルオロエチルチオ、2, 2 - ジフルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリフルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチルチオ、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリクロロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオ、及び、1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イルチオ。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ハロアルキルチオアルキルなど）の一部としてのハロアルキルチオにも当てはまる。

【0042】

ヘテロアリアル： 酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される1～4個のヘテロ原子を含んでいる5員又は6員の完全不飽和の単環式環系；該環が2個以上の酸素原子を含んでいる場合、それらは直接的に隣接することはない。

10

【0043】

1～4個の窒素原子を含んでいるか又は1～3個の窒素原子と1個の硫黄若しくは酸素原子を含んでいる5員ヘテロアリアル： 環員として、炭素原子に加えて、1～4個の窒素原子を含み得るか又は1～3個の窒素原子と1個の硫黄若しくは酸素原子を含み得る、5員ヘテロアリアル基、例えば（限定するものではないが）、2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 5 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル、及び、1, 3, 4 - トリアゾール - 2 - イル。

20

【0044】

1～4個の窒素原子を含んでいる窒素結合5員ヘテロアリアル、又は、1～3個の窒素原子を含んでいるベンゾ縮合窒素結合5員ヘテロアリアル： 環員として、炭素原子に加えて、1～4個の窒素原子又は1～3個の窒素原子を含み得る〔ここで、2つの隣接する炭素環員、又は、1つの窒素環員とそれに隣接する1つの炭素環員は、ブタ - 1, 3 - ジエン - 1, 4 - ジイル基（ここで、1個又は2個の炭素原子は窒素原子で置き換えられていてもよい）によって架橋されてもよい〕5員ヘテロアリアル基（ここで、これらの環は、窒素環員のうちの1つを介して当該骨格に結合している）、例えば（限定するものではないが）、1 - ピロリル、1 - ピラゾリル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル、1 - イミダゾリル、1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - イル、及び、1, 3, 4 - トリアゾール - 1 - イル。

30

【0045】

1～4個の窒素原子を含んでいる6員ヘテロアリアル： 環員として、炭素原子に加えて、それぞれ、1～3個及び1～4個の窒素原子を含み得る、6員ヘテロアリアル基、例えば（限定するものではないが）、2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - ピリミジニル、4 - ピリミジニル、5 - ピリミジニル、2 - ピラジニル、1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル、1, 2, 4 - トリアジン - 3 - イル、及び、1, 2, 4, 5 - テトラジン - 3 - イル。

40

【0046】

1～3個の窒素原子を含んでいるか又は1個の窒素原子と1個の酸素原子若しくは硫黄原子を含んでいる、ベンゾ縮合5員ヘテロアリアル： 例えば（限定するものではないが）、インドール - 1 - イル、インドール - 2 - イル、インドール - 3 - イル、インドール - 4 - イル、インドール - 5 - イル、インドール - 6 - イル、インドール - 7 - イル、ベンゾイミダゾール - 1 - イル、ベンゾイミダゾール - 2 - イル、ベンゾイミダゾール - 4

50

-イル、ベンゾイミダゾール - 5 - イル、インダゾール - 1 - イル、インダゾール - 3 - イル、インダゾール - 4 - イル、インダゾール - 5 - イル、インダゾール - 6 - イル、インダゾール - 7 - イル、インダゾール - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 2 - イル、1 - ベンゾフラン - 3 - イル、1 - ベンゾフラン - 4 - イル、1 - ベンゾフラン - 5 - イル、1 - ベンゾフラン - 6 - イル、1 - ベンゾフラン - 7 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 2 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 3 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 4 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 5 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 6 - イル、1 - ベンゾチオフェン - 7 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 4 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 6 - イル、1, 3 - ベンゾチアゾール - 7 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 2 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 4 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 5 - イル、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 6 - イル、及び、1, 3 - ベンゾオキサゾール - 7 - イル。

【0047】

1 ~ 3 個の窒素原子を含んでいるベンゾ縮合 6 員ヘテロアリアル：例えば（限定するものではないが）、キノリン - 2 - イル、キノリン - 3 - イル、キノリン - 4 - イル、キノリン - 5 - イル、キノリン - 6 - イル、キノリン - 7 - イル、キノリン - 8 - イル、イソキノリン - 1 - イル、イソキノリン - 3 - イル、イソキノリン - 4 - イル、イソキノリン - 5 - イル、イソキノリン - 6 - イル、イソキノリン - 7 - イル、及び、イソキノリン - 8 - イル。

【0048】

この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ヘテロアリアルアルキルなど）の一部分としてのヘテロアリアルにも当てはまる。

【0049】

ヘテロシクリル：酸素、窒素及び硫黄からなる群から選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を含んでいる 3 員 ~ 15 員（好ましくは、3 員 ~ 9 員）の飽和又は部分的に不飽和のヘテロ環：炭素環員に加えて、1 ~ 3 個の窒素原子並びに / 又は 1 個の酸素若しくは硫黄原子又は 1 個若しくは 2 個の酸素及び / 若しくは硫黄原子を含んでいる、単環式、二環式又は三環式のヘテロ環〔該環が 2 個以上の酸素原子を含んでいる場合、それらは直接的に隣接することはない〕、例えば（限定するものではないが）、オキシラニル、アジリジニル、2 - テトラヒドロフラニル、3 - テトラヒドロフラニル、2 - テトラヒドロチエニル、3 - テトラヒドロチエニル、2 - ピロリジニル、3 - ピロリジニル、3 - イソオキサゾリジニル、4 - イソオキサゾリジニル、5 - イソオキサゾリジニル、3 - イソチアゾリジニル、4 - イソチアゾリジニル、5 - イソチアゾリジニル、3 - ピラゾリジニル、4 - ピラゾリジニル、5 - ピラゾリジニル、2 - オキサゾリジニル、4 - オキサゾリジニル、5 - オキサゾリジニル、2 - チアゾリジニル、4 - チアゾリジニル、5 - チアゾリジニル、2 - イミダゾリジニル、4 - イミダゾリジニル、1, 2, 4 - オキサジアゾリジン - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾリジン - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾリジン - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾリジン - 5 - イル、1, 2, 4 - トリアゾリジン - 3 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾリジン - 2 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾリジン - 2 - イル、1, 3, 4 - トリアゾリジン - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロフラ - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロフラ - 3 - イル、2, 4 - ジヒドロフラ - 2 - イル、2, 4 - ジヒドロフラ - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロチエン - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロチエン - 3 - イル、2, 4 - ジヒドロチエン - 2 - イル、2, 4 - ジヒドロチエン - 3 - イル、2 - ピロリン - 2 - イル、2 - ピロリン - 3 - イル、3 - ピロリン - 2 - イル、3 - ピロリン - 3 - イル、2 - イソオキサゾリン - 3 - イル、3 - イソオキサゾリン - 3 - イル、4 - イソオキサゾリン - 3 - イル、2 - イソオキサゾリン - 4 - イル、3 - イソオキサゾリン - 4 - イル、4 - イソオキサゾリン - 4 - イル、2 - イソオキサゾリン - 5 - イル、3 - イソオキサゾリン - 5 - イル、4 - イソオキサゾリン - 5 - イル、2 - イソチアゾリン - 3 - イル、3 - イソチアゾリン - 3 - イル、4 - イソチアゾリン - 3 - イル、2 - イソチアゾリン - 4 - イル、3 - イソチアゾリン - 4 - イル、4 - イソチアゾリン - 4 - イル、2 - イ

10

20

30

40

50

ソチアゾリン - 5 - イル、3 - イソチアゾリン - 5 - イル、4 - イソチアゾリン - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、2 - ピペリジニル、3 - ピペリジニル、4 - ピペリジニル、1, 3 - ジオキサン - 5 - イル、2 - テトラヒドロピラニル、4 - テトラヒドロピラニル、2 - テトラヒドロチエニル、3 - ヘキサヒドロピリダジニル、4 - ヘキサヒドロピリダジニル、2 - ヘキサヒドロピリミジニル、4 - ヘキサヒドロピリミジニル、5 - ヘキサヒドロピリミジニル、2 - ピペラジニル、1, 3, 5 - ヘキサヒドロトリアジン - 2 - イル、及び、1, 2, 4 - ヘキサヒドロトリアジン - 3 - イル。この定義は、他で定義されていない限り、複合置換基（例えば、ヘテロシクリルアルキルなど）の一部としてのヘテロシクリルにも当てはまる。

10

20

【0050】

脱離基： S_N1 脱離基又は S_N2 脱離基、例えば、塩素、臭素、ヨウ素、アルキルスルホネート（ $-OSO_2$ - アルキル、例えば、 $-OSO_2CH_3$ 、 $-OSO_2CF_3$ ）、又は、アリールスルホネート（ $-OSO_2$ - アリール、例えば、 $-OSO_2Ph$ 、 $-OSO_2PhMe$ ）。

【0051】

自然法則に反し、従って、当業者が自身の専門知識に基づいて除外するであろう組合せは含まれない。例えば、隣接する3個以上の酸素原子を有する環構造は除外される。

【0052】

調製方法及び中間体についての説明

式(I)で表されるヘテロアリールピペリジン誘導体及びヘテロアリールピペラジン誘導体は、種々の方法で調製することができる。最初に、可能な調製方法について以下に図式的に示す。特に別途示されていない限り、記載されているラジカルは、上記で与えられている意味を有する。

30

【0053】

式(I)で表される化合物を調製するための本発明による調製方法は、場合により、1種類以上の反応補助剤を使用して実施する。

【0054】

有用な反応補助剤は、必用に応じて、無機又は有機の塩基又は酸受容体である。そのようなものとしては、好ましくは、以下のものを挙げることができる：アルカリ金属又はアルカリ土類金属の酢酸塩、アミド、炭酸塩、炭酸水素塩、水素化物、水酸化物又はアルコキシド、例えば、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム又は酢酸カルシウム、リチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミド又はカルシウムアミド、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸カルシウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム又は炭酸水素カルシウム、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム又は水素化カルシウム、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化カルシウム、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、ナトリウム n - プロポキシド、ナトリウムイソプロポキシド、ナトリウム n - ブトキシド、ナトリウムイソブトキシド、ナトリウム s - ブトキシド、ナトリウム t - ブトキシド、カリウムメトキシド、カリウムエトキシド、カリウム n - プロポキシド、カリウムイソプロポキシド、カリウム n - ブトキシド、カリウムイソブトキ

40

50

シド、カリウム s - ブトキシド又はカリウム t - ブトキシド；及び、さらに、塩基性有機窒素化合物、例えば、トリメチルアミン、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、トリブチルアミン、エチルジイソプロピルアミン、N, N - ジメチルシクロヘキシルアミン、ジシクロヘキシルアミン、エチルジシクロヘキシルアミン、N, N - ジメチルアニリン、N, N - ジメチルベンジルアミン、ピリジン、2 - メチルピリジン、3 - メチルピリジン、4 - メチルピリジン、2, 4 - ジメチルピリジン、2, 6 - ジメチルピリジン、3, 4 - ジメチルピリジン、3, 5 - ジメチルピリジン、5 - エチル - 2 - メチルピリジン、4 - ジメチルアミノピリジン、N - メチルピペリジン、1, 4 - ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)、1, 5 - ジアザビシクロ[4.3.0] - ノナ - 5 - エン(DBN)、又は、1, 8 - ジアザビシクロ[5.4.0] - ウンデカ - 7 - エン(DBU)。

10

【0055】

有用な反応補助剤は、必用に応じて、無機又は有機の酸である。そのようなものとしては、好ましくは、無機酸、例えば、フッ化水素、塩化水素、臭化水素及びヨウ化水素、硫酸、リン酸及び硝酸、並びに、酸性塩、例えば、NaHSO₄及びKHSO₄、又は、有機酸、例えば、ギ酸、炭酸及びアルカン酸(例えば、酢酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸及びプロピオン酸)、並びに、さらに、グリコール酸、チオシアン酸、乳酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、ケイ皮酸、シュウ酸、飽和又は一不飽和又は二不飽和のC₆ - C₂₀ - 脂肪酸、アルキル硫酸モノエステル、アルキルスルホン酸(1 ~ 20個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキルラジカルを有しているスルホン酸)、アリールスルホン酸又はアリールジスルホン酸(1又は2のスルホン酸基を有している、フェニル及びナフチルなどの芳香族ラジカル)、アルキルホスホン酸(1 ~ 20個の炭素原子を有する直鎖又は分枝鎖のアルキルラジカルを有しているホスホン酸)、アリールホスホン酸又はアリールジホスホン酸(1又は2のホスホン酸ラジカルを有している、フェニル及びナフチルなどの芳香族ラジカル)などを挙げることができ、ここで、前記アルキルラジカル及びアリールラジカルは、さらなる置換基も有することができる(例えば、p - トルエンスルホン酸、サリチル酸、p - アミノサリチル酸、2 - フェノキシ安息香酸、2 - アセトキシ安息香酸など)。

20

【0056】

本発明による調製方法は、場合により1種類以上の希釈剤を用いて実施する。有用な希釈剤は、実質的に全ての不活性有機溶媒である。そのようなものとしては、好ましくは、以下のものを挙げることができる：脂肪族及び芳香族のハロゲン化されていてもよい炭化水素類、例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、石油エーテル、ベンジン、リグロイン、ベンゼン、トルエン、キシレン、塩化メチレン、塩化エチレン、クロロホルム、四塩化炭素、クロロベンゼン及びo - ジクロロベンゼン、エーテル類、例えば、ジエチルエーテル、ジブチルエーテル、グリコールジメチルエーテル、ジグリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン及びジオキサン、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプロピルケトン及びメチルイソブチルケトン、エステル類、例えば、酢酸メチル及び酢酸エチル、ニトリル類、例えば、アセトニトリル及びプロピオニトリル、アミド類、例えば、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド及びN - メチルピロリドン、並びに、さらに、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホン、ヘキサメチルホスホルアミド、及び、DMPU。

30

40

【0057】

本発明による調製方法においては、その反応温度は、比較的広い範囲内で変えることができる。一般に、その使用温度は、0 ~ 250 であり、好ましくは、10 ~ 185 の温度である。

【0058】

その反応時間は、当該反応の規模及び反応温度の関数として変わるが、一般的には、数分間 ~ 48時間である。

【0059】

50

本発明による調製方法は、一般に、標準圧力下で実施する。しかしながら、高圧下又は減圧下で実施することも可能である。

【0060】

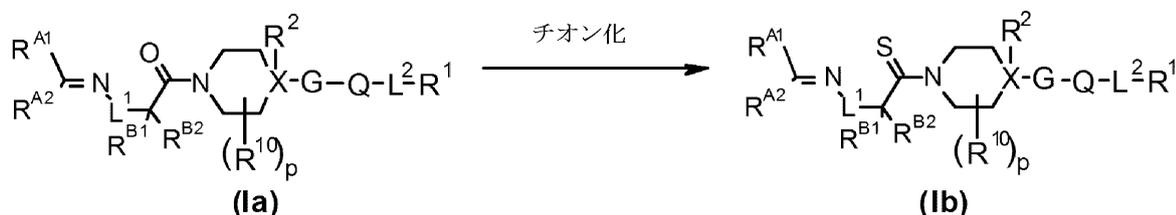
本発明による調製方法を実施するために、それぞれの場合に必要なとされる出発物質は、一般に、ほぼ等モル量で使用する。しかしながら、いずれの場合にも、用いる成分のうちの1種類を比較的大過剰で使用することも可能である。

【0061】

調製方法 A

【化5】

スキーム 1: 調製方法 A



ここで、記号 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{B1} 、 R^{B2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^1 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有する

【0062】

本発明による調製方法 A (スキーム 1) を実施した場合に得られるアミド (Ia) は、文献に記載されている方法を用いて、対応するチオアミド (Ib) に変換することができる (例えば、「Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2009, 19(2), 462-468」)。これは、式 (Ia) で表される化合物を典型的には五硫化リン又は 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 (ローソン試薬) と反応させることを含んでいる (スキーム 77、調製方法 F を参照されたい)。

【0063】

本発明による調製方法 A は、好ましくは、1種類以上の希釈剤を用いて実施する。好ましい溶媒は、トルエン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン及び 1,2-ジメトキシエタンである。

【0064】

反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの1つによって、反応混合物から化合物 (Ib) を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶又はクロマトグラフィーによって精製する。

【0065】

調製方法 B

10

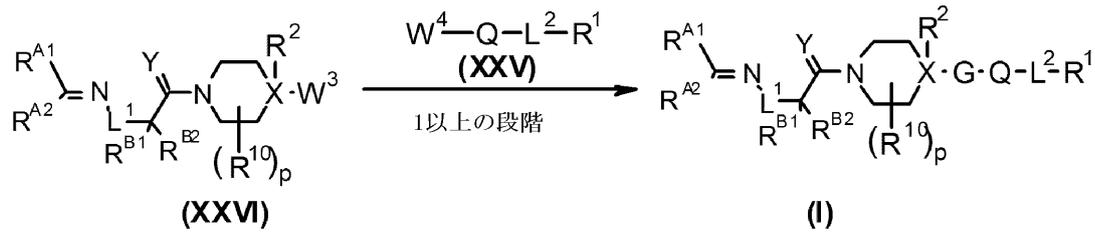
20

30

40

【化7】

スキーム3: 調製方法C



10

ここで、記号 R^{A1}、R^{A2}、R^{B1}、R^{B2}、Y、R¹⁰、p、R²、X、G、Q、L¹、L² 及び R¹ は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、W³ 及び W⁴ は、所望のヘテロ環 G を形成するのに適している官能基である

【0068】

一般に、式 (I) で表される化合物は、適切な官能基 W³ 及び W⁴ (I) を有する対応する化合物 (XXVI) と化合物 (XXV) から調製することが可能である (スキーム3、調製方法Cを参照されたい)。W³ 及び W⁴ に関する可能な官能基は、例えば、アルデヒド類、ケトン類、エステル類、カルボン酸類、アミド類、チオアミド類、ニトリル類、アルコール類、チオール類、ヒドラジン類、オキシム類、アミジン類、アミドオキシム類、オレフィン類、アセチレン類、ハロゲン化物、アルキルハロゲン化物、メタンスルホネート類、トリフルオロメタンスルホネート類、ボロン酸類、ボロネート類などである。それらは、適切な反応条件下で所望の5員ヘテロ環Gを形成することが可能である。ヘテロ環を調製するための文献に記載された多くの方法が存在する(以下のものを参照されたい: WO 2008/013622; 「Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 4-6, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984」; 「Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. Scriven editors, Pergamon Press, New York, 1996」; 「The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York」; 「Rodd's Chemistry of Carbon Compounds, Vol. 2-4, Elsevier, New York」)。

20

30

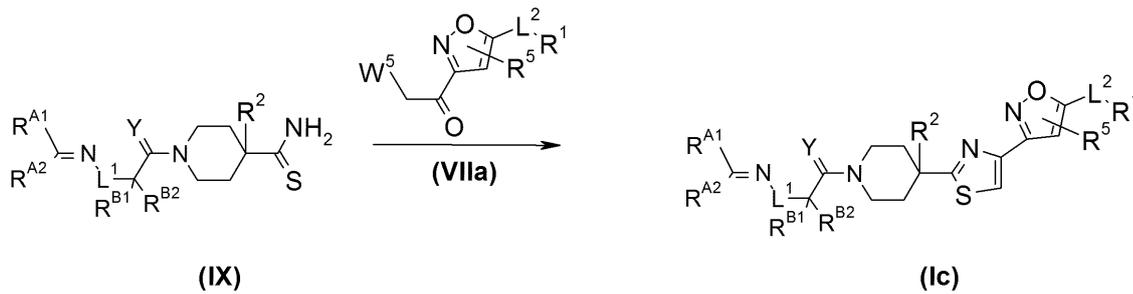
【0069】

調製方法D

40

【化 8】

スキーム 4: 調製方法 D



ここで、記号 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{B1} 、 R^{B2} 、 Y 、 R^5 、 R^2 、 L^1 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 W^5 は、塩素、臭素、ヨウ素、*p*-トルエンスルホニルオキシ、メチルスルホニルオキシである

10

【0070】

式 (Ic) で表される化合物を化合物 (VIIa) を用いて化合物 (IX) から合成する特定の方法及びスキーム 4 (調製方法 D) に示されている。

20

【0071】

チオカルボキサミド (IX) は、文献から知られている方法で、例えば、対応するカルボキサミドを例えばローソン試薬を用いてチオン化 (thionating) することによって得ることができる (WO 2008/013622; 「Org. Synth. Vol. 7, 1990, 372」; WO 2010/065579)。

【0072】

- ハロケトン類又は対応する等価物 (例えば、*p*-トルエンスルホニルオキシ又はメチルスルホニルオキシ) (IX) も、文献から知られている方法によって、例えば、対応するクロロオキシム (XVI) をアルケン (IIa) 若しくはアルキン (IIb) との付加環化に付すことによって (WO 2008/013622)、又は、対応するケトン (VIIa) をハロゲン化することによって (例えば、WO 2011/072207 及び WO 2010/065579)、得ることができる。化合物 (VIIa) は、文献に記載されている調製方法によって調製することができる (例えば、以下のものを参照されたい: WO 2008/091580; WO 2007/014290; WO 2008/091594; 「Journal of Organic Chemistry, 2011, 728-731」; WO 2009/09445; 「European Journal of Organic Chemistry, 2006, 4852-4860」; 「Synthesis, 2005, 3541-3548」)。

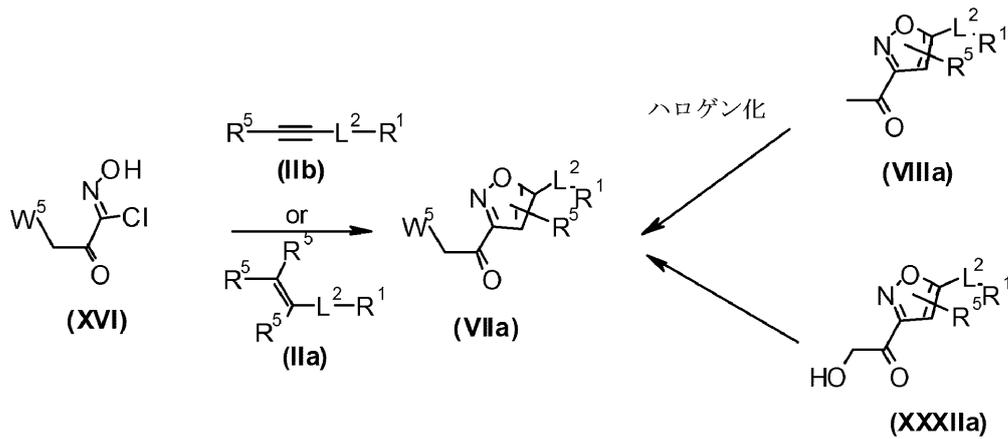
30

【0073】

スキーム 5 :

40

【化9】



10

【0074】

チアゾール (Ic) は、ハンチチアゾール合成によって、チオカルボキサミド (IX) と α -ハロケトン又は対応する等価物 (VIIa) から得られる (例えば、以下のものを参照されたい: 「Comprehensive Heterocyclic Chemistry», Pergamon Press, 1984; vol. 6, pages 235 - 363, 「Comprehensive Heterocyclic Chemistry II», Pergamon Press, 1996; vol. 3, pages 373 - 474」及びそれらの中で引用されている参考文献、並びに、WO 07/014290)。

20

【0075】

調製方法 E は、好ましくは、1種類以上の希釈剤を使用して実施する。調製方法 E の実施においては、不活性有機溶媒 (例えば、N, N - ジメチルホルムアミド及びエタノール) が好ましい選択肢である。

【0076】

適切な場合には、補助的な塩基 (例えば、トリエチルアミン) を使用する。

【0077】

必用に応じて、当該化合物を、再結晶若しくはクロマトグラフィーによって精製する。

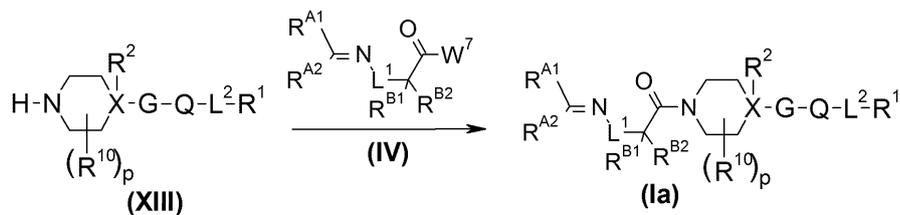
30

【0078】

調製方法 E

【化10】

スキーム 6: 調製方法 E



40

ここで、記号 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{B1} 、 R^{B2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^1 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 W^7 は、OH、F、Cl、Br 又は I である

【0079】

式 (Ia) で表される化合物を化合物 (IV) を用いて対応する化合物 (XIII) が

50

ら調製する一方法が、スキーム6（調製方法E）に示されている。

【0080】

化合物（IV）は、市販されているか、又は、文献に記載されている調製方法によって調製することができる（例えば、以下のものを参照されたい：WO 2010/065579；WO 2008/156726；「Journal of Organic Chemistry, 1983, 4567-4571」）。

【0081】

一般式（Ia）で表される化合物は、文献（例えば、以下のものを参照されたい：WO 2010/065579）に記載されている方法と同様にして、対応する一般式（XIII）で表される化合物を、場合により酸捕捉剤/塩基の存在下で、一般式（IV）〔式中、W⁷は、塩素、フッ素、臭素又はヨウ素である〕で表される基体とのカップリング反応に付すことによって、合成することができる。

10

【0082】

一般式（XIII）で表される出発物質に対して、少なくとも1当量の酸捕捉剤/塩基（例えば、ヒューニヒ塩基、トリエチルアミン又は市販されている高分子酸捕捉剤）を使用する。出発物質が塩である場合、少なくとも2当量の該酸捕捉剤が必要である。

【0083】

あるいは、式（Ia）で表される化合物は、さらにまた、文献（例えば、「Tetrahedron, 2005, 61, 10827-10852」及びその中で引用されている参考文献）に記載されている方法と同様にして、カップリング剤の存在下で、式（IV）〔式中、W⁷は、ヒドロキシルである〕で表される基体を用いて、式（XIII）で表される対応する化合物から合成することもできる。

20

【0084】

適切なカップリング試薬は、例えば、ペプチドカップリング試薬〔例えば、4-ジメチルアミノピリジンと混合されているN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールと混合されているN-(3-ジメチルアミノプロピル)-N'-エチルカルボジイミド、プロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート、O-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート又はプロピルホスホン酸無水物など〕である。

30

【0085】

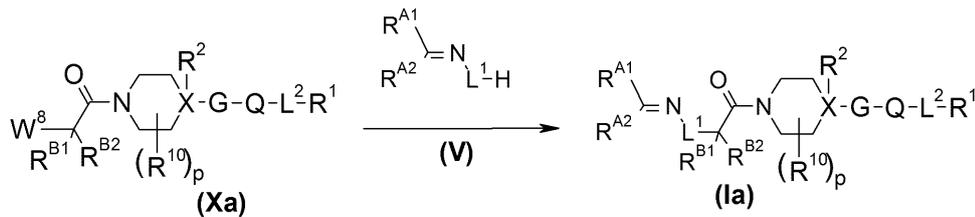
反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの1つによって、反応混合物から化合物（Ia）を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶又はクロマトグラフィーによって精製する。

【0086】

調製方法F

【化 1 1】

スキーム 7: 調製方法 F



10

ここで、記号 R^{A1}、R^{A2}、R^{B1}、R^{B2}、R¹⁰、p、R²、X、G、Q、L¹、L² 及び R¹ は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、W⁸ は、脱離基であり、並びに、L¹ は、NR^{L1}、S 又は O である

【0087】

式 (Ia) で表される化合物を化合物 (IV) を用いて対応する化合物 (Xa) から調製する一方法が、スキーム 7 (調製方法 F) に示されている。

20

【0088】

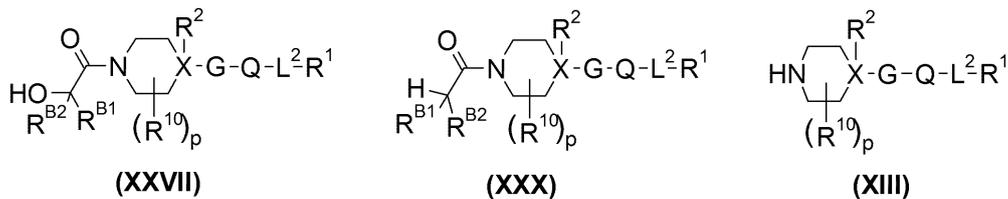
化合物 (V) は、市販されているか、又は、文献に記載されている調製方法によって調製することができる (例えば、以下のものを参照されたい: WO 2007/137792; 「Synthetic Communications, 2000, 4255-4262」; US 6307103)。

【0089】

出発物質 (Xa) [ここで、W⁸ は、脱離基である] は、文献に記載されている方法を用いて、化合物 (XXVII)、化合物 (XXX) 又は化合物 (XIII) から調製することができる (例えば、以下のものを参照されたい: メシル化について: 「Organic Letters, 2003, 2539-2541」; トシル化について: JP 60156601; ハロゲン化について: 「Australian Journal of Chemistry, 1983, 2095-2110」)。典型的には、式 (Xa; W⁸ = 塩素) で表される化合物は、式 (XIII) で表されるアミドと塩化クロロアセチルから出発して調製する。化合物 (XXVII) は、調製方法 E と同様にして、グリコール酸又は塩化ヒドロキシアセチルを用いて、(XIII) から調製する (例えば、以下のものを参照されたい: WO 2007103187; WO 2006117521; 「Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2007, 6326-6329」)。

30

【化 1 2】



40

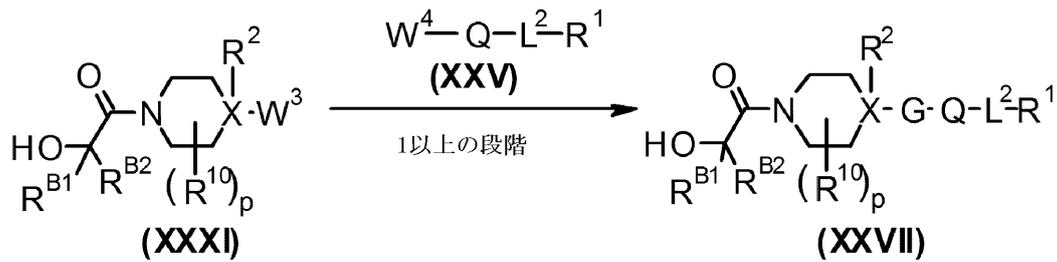
【0090】

化合物 (XXVII) は、調製方法 C と同様にして、(XXXI) から調製する (スキーム 8; 例えば、以下のものを参照されたい: WO 2008154241)。

【0091】

50

スキーム 8 :
【化 1 3】



10

【0092】

ここで、記号 R^{B1} 、 R^{B2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^1 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で定義されているとおりであり、並びに、 W^3 及び W^4 は、所望のヘテロ環 G を形成するのに適している官能基である。

【0093】

一般式 (Xa) で表される出発物質に対して、少なくとも 1 当量の塩基 (例えば、水酸化ナトリウム、炭酸カリウム) を使用する。

【0094】

反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの一つによって、反応混合物から化合物 (Ia) を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶又はクロマトグラフィーによって精製する。

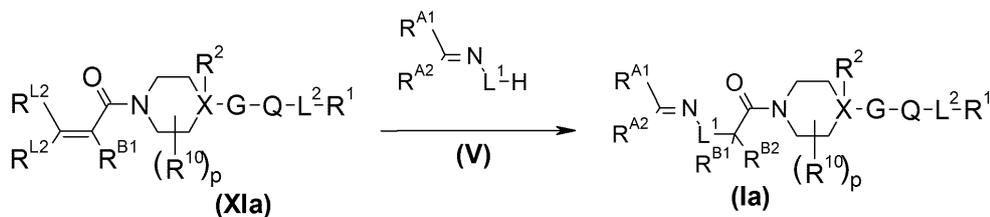
20

【0095】

調製方法 G

【化 1 4】

スキーム 9: 調製方法 G



30

ここで、記号 R^{L2} 、 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{B1} 、 R^{B2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^1 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 L^1 は、 O 、 S 、 NR^{L1} であり、並びに、 $R^{B2} = H$ である

【0096】

式 (Ia) で表される化合物を化合物 (IV) を用いて対応する化合物 (XIa) から調製する一方法が、スキーム 9 (調製方法 G) に示されている。

40

【0097】

出発物質 (XIa) は、調製方法 E と同様にして、置換されているか若しくは置換されていないアクリル酸又は置換されているか若しくは置換されていない塩化アクリロイルを用いてアミン (XIII) から調製する。

【0098】

一般式 (Ia) で表される化合物は、文献に記載されている方法と同様にして、対応する一般式 (XIa) で表される化合物を、場合により塩基 (例えば、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム、炭酸カリウム) の存在下で、一般式 (V) で表される基体とのカップ

50

リング反応に付すことによって、合成することができる（例えば、以下のものを参照されたい： WO 2010/065579；「Russian Journal of General Chemistry, 2005, 915-922」；「Journal of Medicinal Chemistry, 2009, 7397-7409」）。

【0099】

反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの一つによって、反応混合物から化合物（I a）を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶又はクロマトグラフィーによって精製する。

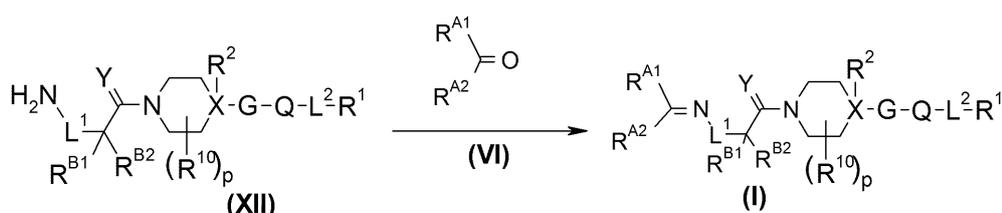
【0100】

調製方法 H

【化15】

10

スキーム 10: 調製方法 H



20

ここで、記号 R^{A1} 、 R^{A2} 、 R^{B1} 、 R^{B2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^1 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 L^1 は、 O 、 S 、 NR^{L1} である

【0101】

式（I）で表される化合物を化合物（VI）を用いて対応する化合物（XII）から調製する一方法が、スキーム 10（調製方法 H）に示されている。

30

【0102】

化合物（VI）は、市販されているか、又は、文献に記載されている調製方法によって調製することができる。出発物質（XII）は、文献に記載されている調製方法によって又は調製方法 E と同様にしてアミン（III）から調製する（例えば、以下のものを参照されたい： WO 2010/065579）。

【0103】

一般式（I a）で表される化合物は、文献に記載されている方法と同様にして、対応する一般式（XII）で表される化合物を、場合により塩基（例えば、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム、炭酸ナトリウム）の存在下又は酸（例えば、酢酸、硫酸又は塩酸）の存在下で、一般式（VI）で表される基体との縮合反応に付すことによって合成することができる（例えば、以下のものを参照されたい： WO 2011/020861； WO 2009/105755）。出発物質が塩である場合、少なくとも 2 当量の酸捕捉剤が必要である。

40

【0104】

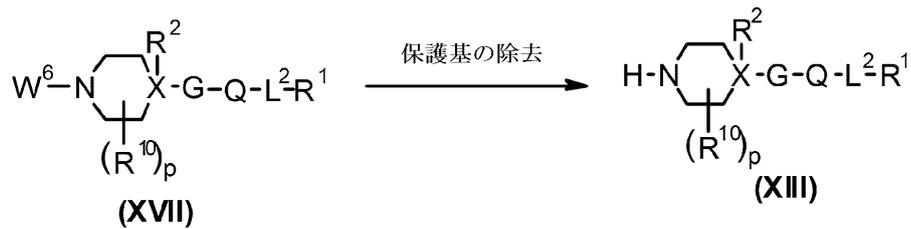
反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの一つによって、反応混合物から化合物（I a）を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶又はクロマトグラフィーによって精製する。

【0105】

調製方法 I

【化 1 6】

スキーム 11: 調製方法 I



ここで、記号 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 W^6 は、アセチル、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジロキシカルボニルである

10

【0106】

式 (XIII) で表される化合物を対応する化合物 (XVII) から調製する一方法が、スキーム 11 (調製方法 I) に示されている。

20

【0107】

文献に記載されている適切な保護基除去方法によって、式 (XVII) で表される化合物を式 (XIII) で表される化合物に変換する (“Protective Groups in Organic Synthesis”; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; Wiley-Interscience; Third Edition; 1999; 494 - 653)。

【0108】

tert-ブトキシカルボニル保護基及びベンジロキシカルボニル保護基は、酸性媒体中 (例えば、塩酸又はトリフルオロ酢酸を用いて) で除去することができる。アセチル保護基は、塩基性条件下 (例えば、炭酸カリウム又は炭酸セシウムを用いて) で除去することができる。ベンジル性保護基は、触媒 (例えば、活性炭担持パラジウム) の存在下で水素を用いる水素化分解によって除去することができる。

30

【0109】

反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの 1 つによって、反応混合物から化合物 (XIII) を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶若しくはクロマトグラフィーによって精製するか、又は、望ましい場合には、事前に精製することなく次の段階で使用することも可能である。一般式 (XIII) で表される化合物は、塩 (例えば、塩酸の塩又はトリフルオロ酢酸の塩) として単離することも可能である。

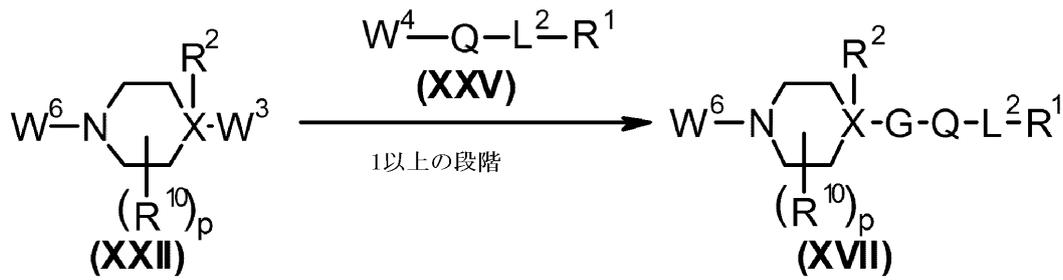
【0110】

調製方法 J

40

【化 17】

スキーム 12: 調製方法 J



10

ここで、記号 R¹⁰、p、R²、X、G、Q、L² 及び R¹ は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、W⁶ は、アセチル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジルオキシカルボニルであり、並びに、W³ 及び W⁴ は、所望のヘテロ環を形成するのに適している官能基である

20

【0111】

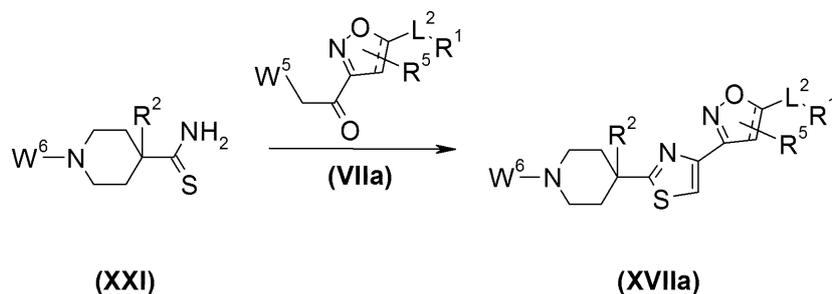
一般に、中間体 (XVII) は、化合物 (XXV) を用いて対応する化合物 (XXI) から調製することができる。調製方法 J (スキーム 12) は、調製方法 C (スキーム 3) と同様にして実施する。

【0112】

調製方法 K

【化 18】

スキーム 13: 調製方法 K



30

ここで、記号 R⁵、R²、L² 及び R¹ は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、W⁵ は、塩素、臭素、ヨウ素、p-トルエンスルホニルオキシ、メチルスルホニルオキシであり、並びに、W⁶ は、アセチル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジルオキシカルボニルである

40

【0113】

式 (XVII d) で表される中間体に対応する化合物 (XXI) から調製する別の方法が、スキーム 13 (調製方法 K) に示されている。化合物 (XXI) は、市販されているか、又は、文献に記載されている調製方法によって調製することができる (例えば、以下のものを参照された: WO 2008/013622、及び、WO 2007/014

50

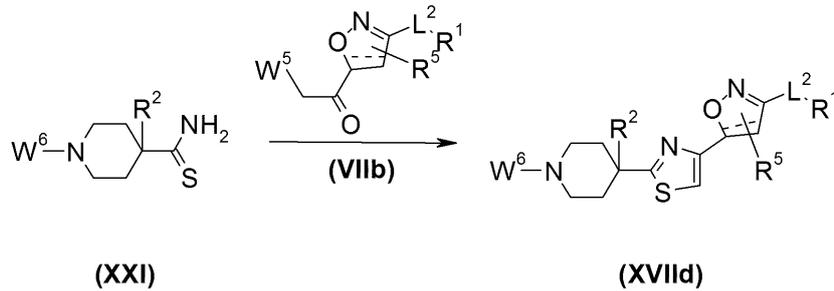
290)。調製方法 K は、調製方法 D (スキーム 4) と同様にして実施する。

【0114】

調製方法 L

【化19】

スキーム 14: 調製方法 L



10

ここで、記号 R^5 、 R^2 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 W^5 は、塩素、臭素、ヨウ素、p-トルエンスルホンイルオキシ、メチルスルホンイルオキシであり、並びに、 W^6 は、アセチル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジルオキシカルボニルである

20

【0115】

式 (XVIIId) で表される中間体に対応する化合物 (XXI) から調製する別の方法が、スキーム 14 (調製方法 L) に示されている。

【0116】

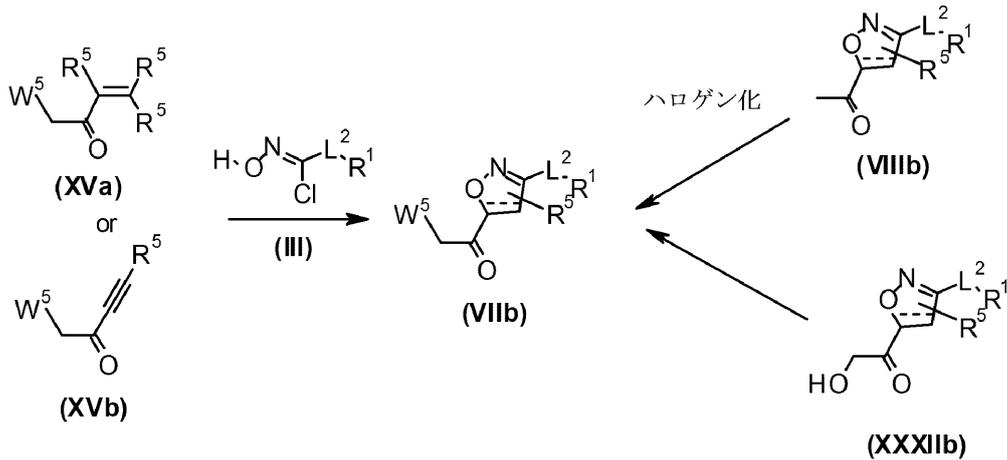
- ハロケトン類又は対応する等価物 (例えば、p-トルエンスルホンイルオキシ又はメチルスルホンイルオキシ) (VIIb) は、文献に記載されている調製方法 (スキーム 15) によって、例えば、対応するクロロオキシム (III) をアルケン (XVa) 若しくはアルキン (XVb) との付加環化に付すことによって、又は、対応するケトン (VIIb) をハロゲン化することによって、調製することができる (例えば、「Journal of Medicinal Chemistry, 1991, 600-605」、及び、「Journal of heterocyclic Chemistry, 1988, 337-342」)。化合物 (VIIb) は、文献に記載されている調製方法によって調製することができる (例えば、以下のものを参照されたい: WO 2008/091580、WO 2007/014290、及び、WO 2008/091594)。

30

【0117】

スキーム 15

【化20】



10

【0118】

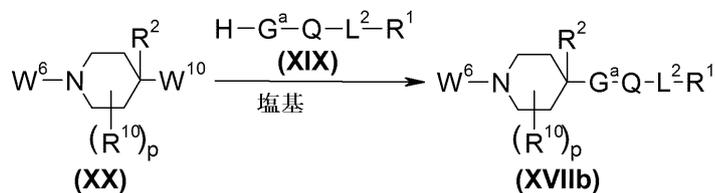
調製方法 L は、調製方法 D (スキーム 4) と同様にして、実施する。

【0119】

調製方法 M

【化21】

スキーム 16: 調製方法 M



20

ここで、記号 R^{10} 、 p 、 R^2 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 G^a は、窒素原子又は炭素原子を介して結合しているピペリジンラジカルであり、 W^6 は、アセチル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジルオキシカルボニルであり、並びに、 W^{10} は、塩素、臭素、ヨウ素、メチルスルホニルオキシ又はトリフルオロメチルスルホニルオキシである

30

【0120】

一般式 (XVIIb) で表される化合物は、文献に記載されている方法と同様にして、対応する一般式 (XX) で表される化合物を、場合により塩基 (スキーム 15, 調製方法 M を参照されたい) の存在下で、一般式 (XIX) で表される基体とのカップリング反応に付すことによって、合成することができる (例えば、以下のものを参照されたい: Zn/Pd カップリングについて: WO 2008/147831, WO 2006/106423 (ピリジン)、「Shakespeare, W. C. et al. Chem. Biol. Drug Design 2008, 71, 97-105 (ピリジン誘導体)」、「Pasternak, A. et al. Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, 18, 994-998 (ジアジン類)」、「Coleridge, B. M.; Bello, C. S.; Leitner, A. Tetrahedron Lett. 2009, 50, 4475-4477」、「Bach, T., Heuser, S. Angew. Chem. Int. Ed. 2001, 40, 3184-3185 (チアゾール類); 求核

40

50

置換について： WO 2008/104077、WO 2006/084015 (N-置換されているピラゾール類)。

【0121】

求核置換に関しては、一般式 (XX) で表される出発物質に対して、少なくとも1当量の塩基 (例えば、水素化ナトリウム、炭酸カリウム) を使用する。

【0122】

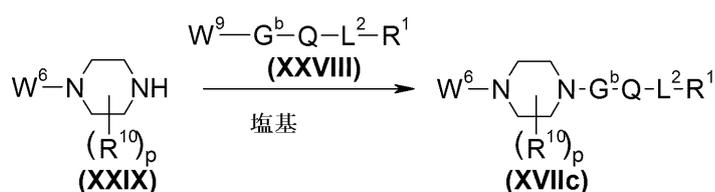
反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの一つによって、反応混合物から化合物 (XVIIb) を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶若しくはクロマトグラフィーによって精製するか、又は、望ましい場合には、事前に精製することなく次の段階で使用することも可能である。

【0123】

調製方法 N

【化22】

スキーム 17: 調製方法 N



ここで、記号 R^{10} 、 p 、 R^2 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、 G^b は、炭素原子を介して結合しているピペラジン環であり、 W^6 は、アセチル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジロキシカルボニルであり、並びに、 W^9 は、塩素、臭素、ヨウ素、メチルスルホニルオキシ又はトリフルオロメチルスルホニルオキシである

【0124】

一般式 (XVIIc) で表される化合物は、文献に記載されている方法と同様にして (例えば、以下のものを参照されたい： 求核置換について：「Li, C. S., Belair, L., Guay, J. et al Bioorg. Med. Chem. Lett. 2009, 19, 5214-5217」、WO 2008/062276；銅カップリングについて：「Yeh, V. S. C.; Wiedeman, P. E. Tetrahedron Lett. 2006, 47, 6011-6016」；パラジウムカップリングについて：WO 2005/061457)、対応する一般式 (XXIX) で表される化合物を、場合により塩基の存在下で、一般式 (XVII) で表される基体とのカップリング反応に付すことによって、合成することができる (スキーム 17, 調製方法 N)。

【0125】

一般式 (XXIX) で表される出発物質に対して、少なくとも1当量の塩基 (例えば、水素化ナトリウム、炭酸カリウム) を使用する。

【0126】

反応が終了した後、慣習的な分離技術のうちの一つによって、反応混合物から化合物 (XVIIc) を分離させる。必用に応じて、当該化合物を、再結晶若しくはクロマトグラフィーによって精製するか、又は、望ましい場合には、事前に精製することなく次の段階で使用することも可能である。

【0127】

10

20

30

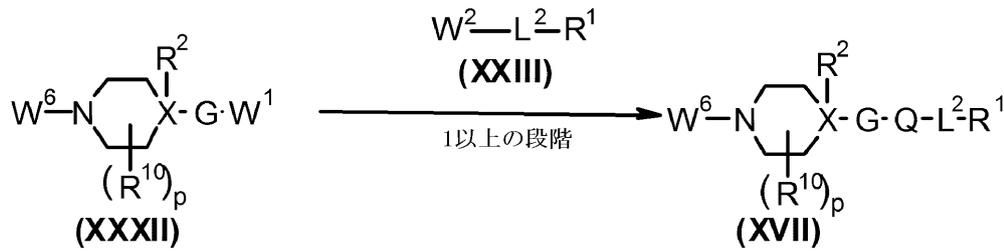
40

50

調製方法 O

【化 2 3】

スキーム 18: 調製方法 O



ここで、記号 R^1 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 W^6 は、アセチル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジロキシカルボニルであり、 W^1 及び W^2 は、所望のヘテロ環 Q を形成するのに適している官能基である

【0128】

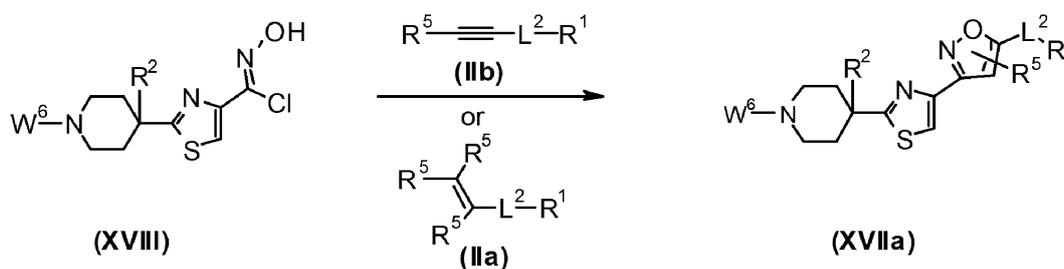
一般に、中間体 (XVII) は、対応する化合物 (XXXII) 及び化合物 (XXII) から調製することができる。調製方法 O (スキーム 18) は、調製方法 B (スキーム 2) と同様にして実施する。

【0129】

調製方法 P

【化 2 4】

スキーム 19: 調製方法 P



ここで、記号 R^1 、 R^2 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、 W^6 は、アセチル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、ベンジル又はベンジロキシカルボニルである

【0130】

式 (XVIIa) で表される化合物を、対応する化合物 (XVII) から、化合物 (IIa) 又は化合物 (IIb) との反応によって調製する特定の方法及び、調製方法 P (スキーム 19) に示されている。

【0131】

化合物 (XVII) は、文献に記載されている調製方法によって調製することができ

る（例えば、以下のものを参照されたい： WO 05/0040159、WO 08/013622、及び、WO 2011/076699）。

【0132】

アルケン及びアルキン（II a）及び（II b）は、市販されているか、又は、市販されている前駆物質から文献に記載されている方法によって調製することができる（例えば： ケトン又はアルデヒドからのウィッティヒオレフィン化又はホーナー・ワズワース・エモンズオレフィン化による調製について： 「Chem. Rev. 1989, 89, 863-927」、及び、「Julia olefination: Tetrahedron Lett., 1973, 14, 4833-4836」、「Peterson olefination: J. Org. Chem. 1968, 33, 780」； Bestmann-Ohira 試薬を用いた調製について： 「Synthesis 2004, 1, 59-62」）。

10

【0133】

一般式（XVII a）で表される化合物は、一般式（II a）で表されるアルケン又は式（II b）で表されるアルキンと化合物（XVII I）から、付加環化反応によって得られる（例えば、以下のものを参照されたい： WO 08/013622、及び「Synthesis, 1987, 11, 998-1001」）。

【0134】

調製方法 P は、適切な塩基の存在下で実施する。好ましい塩基は、第 3 級アミン類（例えば、トリエチルアミン）、並びに、アルカリ金属又はアルカリ土類金属の炭酸塩（例えば、炭酸カリウム又は炭酸ナトリウム）、炭酸水素塩及びリン酸塩である。

20

【0135】

調製方法 P は、好ましくは、1 種類以上の希釈剤を使用して実施する。調製方法 P の実施においては、不活性有機溶媒（例えば、トルエン及びヘキサン）が好ましい選択肢である。水も、可能な溶媒である。あるいは、調製方法 P は、過剰量のアルケン（II a）又はアルキン（II b）の中で実施することも可能である。

【0136】

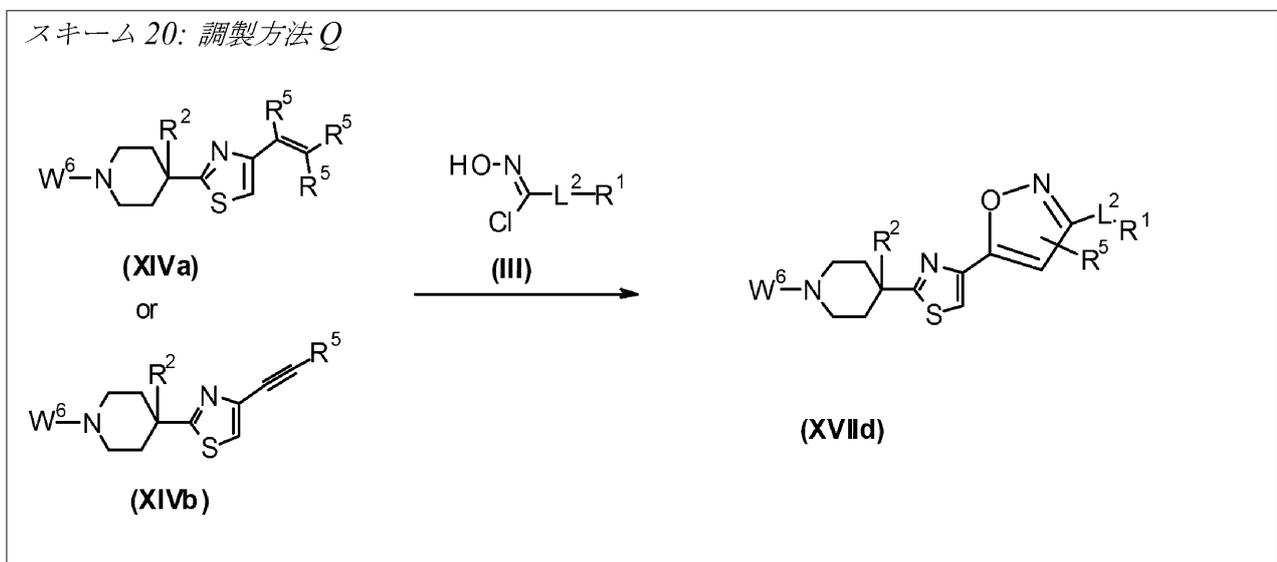
後処理は、慣習的な方法で行う。必用に応じて、当該化合物を、再結晶若しくはクロマトグラフィーによって精製する。

【0137】

調製方法 Q

【化 25】

30



40

【0138】

ここで、記号 R¹、R²、L² 及び R¹ は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義を有し、並びに、W⁶ は、アセチル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、ベンジル又

50

はベンジルオキシカルボニルである。式 (XVII d) で表される化合物を、調製方法 P (スキーム 19) と同様にして、対応する化合物 (XIV a) 又は化合物 (XIV b) から化合物 (III) との付加環化反応によって調製する特定の方法及び、スキーム 20 (調製方法 Q) に示されている。

【0139】

アルケン及びアルキン (XIV a) 及び (XIV b) は、市販されている前駆物質から、文献から知られている方法によって調製することができる (例えば、WO 2009/145360; WO 2010/037479; WO 2009/055514; WO 2008/013925; WO 2008/013622)。

【0140】

式 (I) で表される化合物の調製に関して上記に記載されている一部の試薬及び反応条件が、当該中間体化合物の中に存在している特定の官能性と適合しないこともあり得るといことは、理解される。そのような場合、保護/脱保護手順又は官能基の相互変換を当該合成に導入することは、所望の生成物を得るのに有用である。保護基の使用及び選択は、化学合成の当業者には、明らかである (例えば、以下のものを参照されたい: 「Protective Groups in Organic Synthesis»; Third Edition; 494-653) 及びその中で引用されている文献)。当業者は、場合により、個々のスキームにおいて示されている所与の試薬を導入した後で、式 (I) で表される化合物の合成を完結させるために、個別的には記載されていない付加的な型通りの合成段階を実施することが必要であり得るといことを、理解するであろう。当業者は、さらに、式 (I) で表される化合物を調製するために、特に示されている暗黙の手順ではなく、上記スキームの手順において例証されている段階の組合せを実施することが必要であり得るといことも、理解するであろう。

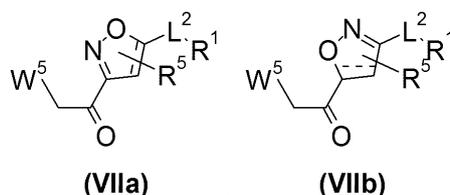
【0141】

後処理は、慣習的な方法で行う。必用に応じて、当該化合物を、再結晶若しくはクロマトグラフィーによって精製する。

【0142】

式 (VII a) 及び式 (VII b)

【化 26】



30

【0143】

〔式中、記号 W^5 、 L^2 、 R^1 及び R^5 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義、好ましい定義、さらに好ましい定義又は最も好ましい定義を有する〕

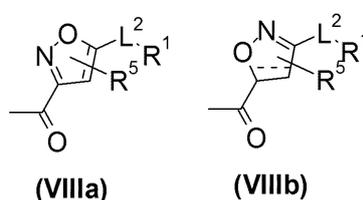
で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N-オキシドは、新規化合物である。

40

【0144】

式 (VIII a) 及び式 (VIII b)

【化 27】



50

【 0 1 4 5 】

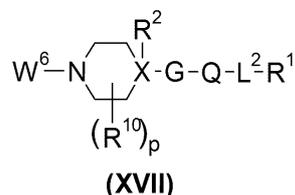
〔式中、記号 W^5 、 L^2 、 R^1 及び R^5 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義、好ましい定義、さらに好ましい定義又は最も好ましい定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシドは、新規化合物である。

【 0 1 4 6 】

式 (XVII)

【 化 2 8 】

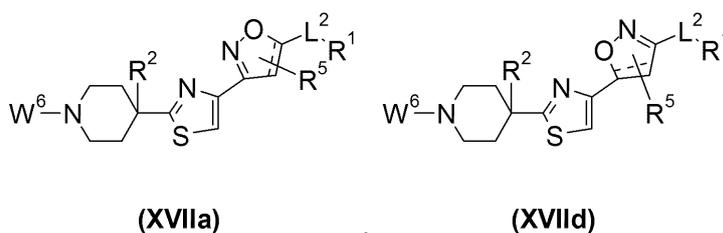


10

【 0 1 4 7 】

例えば、式 (XVIIa) 又は式 (XVII d)

【 化 2 9 】



20

【 0 1 4 8 】

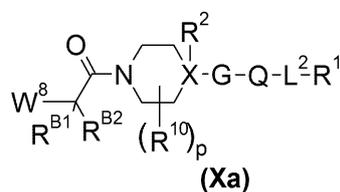
〔式中、記号 W^6 、 R^{10} 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義、好ましい定義、さらに好ましい定義又は最も好ましい定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N - オキシドは、新規化合物である。

【 0 1 4 9 】

式 (Xa)

【 化 3 0 】



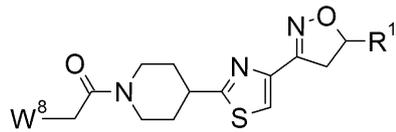
30

【 0 1 5 0 】

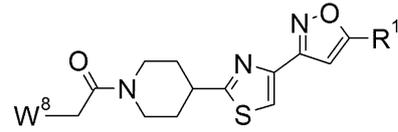
例えば、式 (Xc)、式 (Xd)、式 (Xe) 又は式 (Xf)

40

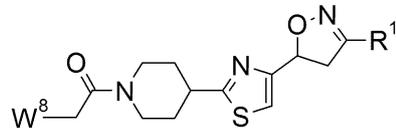
【化 3 1】



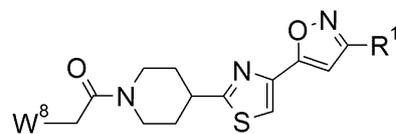
(Xc)



(Xd)



(Xe)



(Xf)

10

【 0 1 5 1】

〔式中、記号 W^8 、 R^{L1} 、 R^{L2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義、好ましい定義、さらに好ましい定義又は最も好ましい定義を有する〕

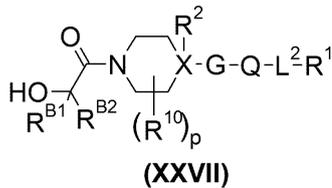
で表される化合物並びにその塩、金属錯体及び N -オキシドは、新規化合物である。

20

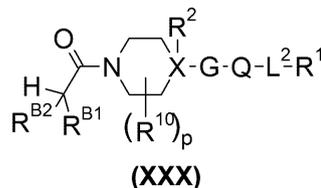
【 0 1 5 2】

式 (XXXVII)、式 (XXX) 及び式 (XIII)

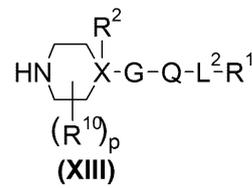
【化 3 2】



(XXVII)



(XXX)



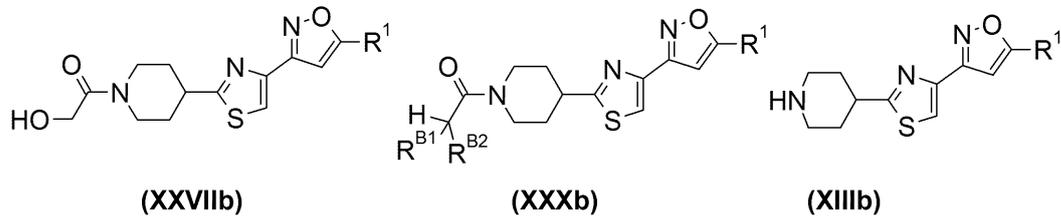
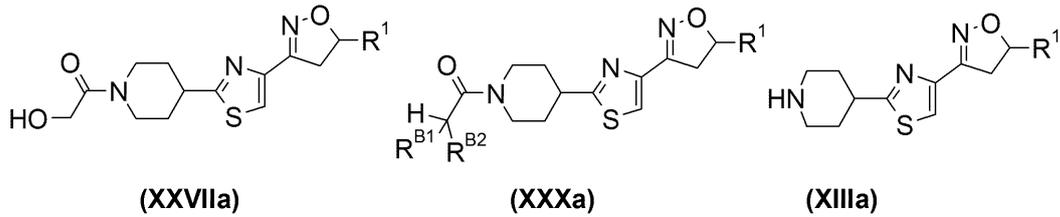
(XIII)

【 0 1 5 3】

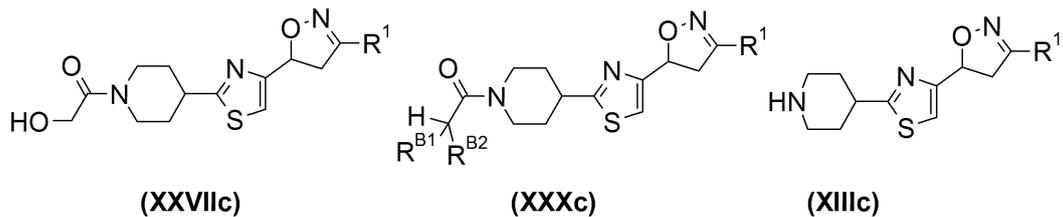
例えば、式 (XXXVIIa)、式 (XXXVIIb)、式 (XXXVIIc)、式 (XXXVIIId)、式 (XXXa)、式 (XXXb)、式 (XXXc)、式 (XXXd)、式 (XIIIa)、式 (XIIIb)、式 (XIIIc) 又は式 (XIIId)

30

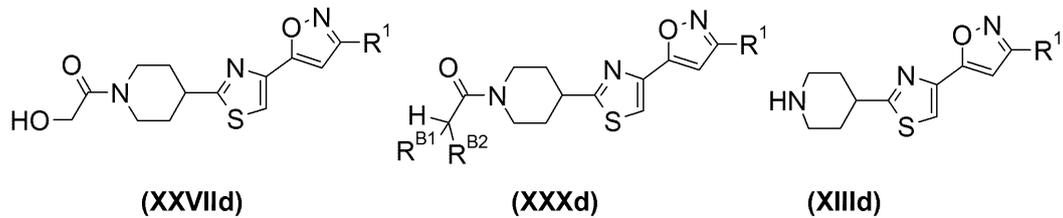
【化 3 3】



10



20



30

【0154】

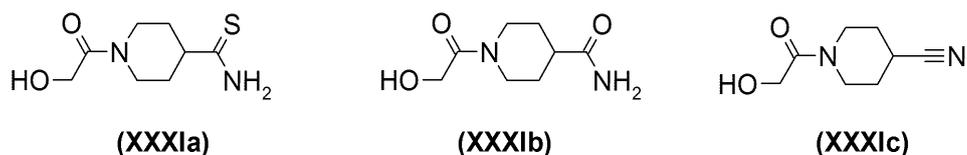
〔式中、記号 W^8 、 R^{L1} 、 R^{L2} 、 R^{10} 、 p 、 R^2 、 X 、 G 、 Q 、 L^2 及び R^1 は、それぞれ、上記で特定されている一般的な定義、好ましい定義、さらに好ましい定義又は最も好ましい定義を有する〕

で表される化合物並びにその塩、金属錯体及びN-オキシドは、新規化合物である。

【0155】

式(XXXIa)、式(XXXIb)及び式(XXXIc)

【化 3 4】



40

【0156】

で表される化合物は、新規化合物である。

【0157】

本発明は、さらに、本発明による少なくとも1種類のヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体を含んでいる、望ましくない微生物を防除するための組成物も提供する。

50

【0158】

本発明は、さらに、望ましくない微生物を防除する方法にも関し、ここで、該方法は、本発明によるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体を当該微生物及び/又はそれらの生息環境に施用することを特徴とする。

【0159】

本発明は、さらに、本発明による少なくとも1種類のヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体で処理された種子にも関する。

【0160】

本発明は、最後に、本発明による少なくとも1種類のヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体で処理された種子を使用することによる、望ましくない微生物から種子を保護する方法を提供する。

10

【0161】

本発明の物質は、強力な殺微生物活性 (microbicidal activity) を有しており、作物保護と材料物質 (materials) の保護において、望ましくない微生物 (例えば、菌類及び細菌類) を防除するために使用することができる。

【0162】

本発明による式 (I) で表されるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体は、極めて良好な殺菌特性を有しており、作物保護において、例えば、ネコブカビ類 (Plasmodiophoromycetes)、卵菌類 (Oomycetes)、ツボカビ類 (Chytridiomycetes)、接合菌類 (Zygomycetes)、子囊菌類 (Ascomycetes)、担子菌類 (Basidiomycetes) 及び不完全菌類 (Deuteromycetes) などを防除するために、使用することができる。

20

【0163】

殺細菌剤 (bactericide) は、作物保護において、例えば、シュードモナス科 (Pseudomonadaceae)、リゾビウム科 (Rhizobiaceae)、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae)、コリネバクテリウム科 (Corynebacteriaceae) 及びストレプトミセス科 (Streptomycetaceae) を防除するために、使用することができる。

【0164】

本発明による殺菌剤組成物は、植物病原性菌類を治療的又は保護的に防除するために使用することができる。従って、本発明は、本発明による活性成分又は組成物を使用して植物病原性菌類を防除するための治療的方法及び保護的方法にも関し、ここで、該活性成分又は組成物は、種子、植物若しくは植物の部分、果実又は植物がそこで生育している土壤に施用される。

30

【0165】

作物保護において植物病原性菌類を防除するための本発明による組成物は、有効で且つ植物に対して毒性を示さない量の本発明による活性成分を含んでいる。「有効で且つ植物に対して毒性を示さない量 (effective but non-phytotoxic amount)」は、植物の菌類病を満足のいくように防除するか又は植物の菌類病を完全に根絶するのに充分でありながら、同時に、植物毒性の重大などのような症状も引き起こすことのない、本発明組成物の量を意味する。一般に、そのような施用量は、比較的広い範囲内で変動し得る。それは、いくつかの要因に依存し、例えば、防除対象の菌類、植物、気候条件及び本発明組成物の成分などに依存する。

40

【0166】

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分を処理することができる。ここで、植物というのは、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物 (自然発生した作物植物を包含する) のような全ての植物及び植物個体群を意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって、又は、生物工学的的方法と遺伝子工学的的方法によって、又は、それら方法を組み合わせたものによって得ることが可能な植物であることができ

50

る。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得るか又は保護され得ない植物品種も包含される。植物の部分は、枝条、葉、花及び根などの、植物の地上及び地下の全ての部分及び全ての器官を意味するものと理解され、その例としては、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などを挙げる事ができる。植物の部分には、さらに、収穫物、並びに、栄養繁殖器官及び生殖繁殖器官 (vegetative and generative propagation material)、例えば、挿木 (cutting)、塊茎、根茎、接ぎ穂 (slip) 及び種子なども包含される。

【0167】

本発明に従って処理することが可能な植物としては、以下のものを挙げる事ができる：
 ワタ、アマ、ブドウの木、果実、野菜、例えば、バラ科各種 (Rosaceae sp.) (例えば、仁果、例えば、リンゴ及びナシ、さらに、核果、例えば、アンズ、サクラの木、アーモンド及びモモ、並びに、小果樹、例えば、イチゴ)、リベシオイダ工科各種 (Ribesioideae sp.)、クルミ科各種 (Juglandaceae sp.)、カバノキ科各種 (Betulaceae sp.)、ウルシ科各種 (Anacardiaceae sp.)、ブナ科各種 (Fagaceae sp.)、クワ科各種 (Moraceae sp.)、モクセイ科各種 (Oleaceae sp.)、マタタビ科各種 (Actinidaceae sp.)、クスノキ科各種 (Lauraceae sp.)、パショウ科各種 (Musaceae sp.) (例えば、バナナの木及びプランテーション)、アカネ科各種 (Rubiaceae sp.) (例えば、コーヒー)、ツバキ科各種 (Theaceae sp.)、アオギリ科各種 (Sterculiaceae sp.)、ミカン科各種 (Rutaceae sp.) (例えば、レモン、オレンジ及びグレープフルーツ)、ナス科各種 (Solanaceae sp.) (例えば、トマト)、ユリ科各種 (Liliaceae sp.)、キク科各種 (Asteraceae sp.) (例えば、レタス)、セリ科各種 (Umbelliferae sp.)、アブラナ科各種 (Cruciferae sp.)、アカザ科各種 (Chenopodiaceae sp.)、ウリ科各種 (Cucurbitaceae sp.) (例えば、キュウリ)、ネギ科各種 (Alliaceae sp.) (例えば、リーキ、タマネギ)、マメ科各種 (Papilionaceae sp.) (例えば、エンドウ)； 主要作物植物、例えば、イネ科各種 (Gramineae sp.) (例えば、トウモロコシ、芝、禾穀類、例えば、コムギ、ライムギ、イネ、オオムギ、エンバク、アワ及びライコムギ)、キク科各種 (Asteraceae sp.) (例えば、ヒマワリ)、アブラナ科各種 (Brassicaceae sp.) (例えば、白キャベツ、赤キャベツ、ブロッコリー、カリフラワー、芽キャベツ、タイサイ、コールラビ、ラディッシュ、ナタネ、カラシナ、セイヨウワサビ、及び、コショウソウ)、マメ科各種 (Fabaceae sp.) (例えば、インゲンマメ、ピーナッツ)、マメ科各種 (Papilionaceae sp.) (例えば、ダイズ)、ナス科各種 (Solanaceae sp.) (例えば、ジャガイモ)、アカザ科各種 (Chenopodiaceae sp.) (例えば、テンサイ、飼料ビート、フダンソウ、ビートルート)； 庭園及び樹木の茂った地域に関して有用な植物及び観賞植物；及び、これら植物のそれぞれの遺伝子組み換えが行われた品種。

【0168】

本発明に従って治療することが可能な菌類病の病原体の非限定的な例としては、以下のものを挙げる事ができる：

・ 例えば以下のような、うどんこ病病原体に起因する病害： ブルメリア属各種 (Blumeria species)、例えば、ブルメリア・グラミニス (Blumeria graminis)； ポドスファエラ属各種 (Podosphaera species)、例えば、ポドスファエラ・レウコトリカ (Podosphaera leucotricha)； スファエロテカ属各種 (Sphaerotheca species)、例えば、スファエロテカ・フリギネア (Sphaerotheca fuliginea)； ウンシヌラ属各種 (Uncinula species)、例えば、ウンシ

ヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*);

・ 例えば以下のような、さび病病原体に起因する病害： ギムノスポランギウム属各種 (*Gymnosporangium species*)、例えば、ギムノスポランギウム・サビナエ (*Gymnosporangium sabiniae*); ヘミレイア属各種 (*Hemileia species*)、例えば、ヘミレイア・バスタトリクス (*Hemileia vastatrix*); ファコブソラ属各種 (*Phakopsora species*)、例えば、ファコブソラ・パキリジ (*Phakopsora pachyrhizi*) 又はファコブソラ・メイボミアエ (*Phakopsora meibomiaae*); プッシニア属各種 (*Puccinia species*)、例えば、プッシニア・レコンジタ (*Puccinia recondita*)、プッシニア・グラミニス (*Puccinia graminis*) 又はプッシニア・ストリイホルミス (*Puccinia striiformis*); ウロミセス属各種 (*Uromyces species*)、例えば、ウロミセス・アペンジクラツス (*Uromyces appendiculatus*);

・ 例えば以下のような、卵菌類 (*Oomycetes*) の群の病原体に起因する病害： アルブゴ属各種 (*Albugo species*)、例えば、アルブゴ・カンジダ (*Albugo candida*); ブレミア属各種 (*Bremia species*)、例えば、ブレミア・ラクツカエ (*Bremia lactucae*); ペロノスポラ属各種 (*Peronospora species*)、例えば、ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisi*) 又はペロノスポラ・ブラシカエ (*P. brassicae*); フィトフトラ属各種 (*Phytophthora species*)、例えば、フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*); プラスモパラ属各種 (*Plasmopara species*)、例えば、プラスモパラ・ビチコラ (*Plasmopara viticola*); プセウドペロノスポラ属各種 (*Pseudoperonospora species*)、例えば、プセウドペロノスポラ・フムリ (*Pseudoperonospora humuli*) 又はプセウドペロノスポラ・クベンシス (*Pseudoperonospora cubensis*); ピシウム属各種 (*Pythium species*)、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*);

・ 例えば以下のものに起因する、斑点病 (*leaf blotch disease*) 及び萎凋病 (*leaf wilt disease*): アルテルナリア属各種 (*Alternaria species*)、例えば、アルテルナリア・ソラニ (*Alternaria solani*); セルコスポラ属各種 (*Cercospora species*)、例えば、セルコスポラ・ベチコラ (*Cercospora beticola*); クラジオスポリウム属各種 (*Cladosporium species*)、例えば、クラジオスポリウム・ククメリヌム (*Cladosporium cucumerinum*); コクリオボルス属各種 (*Cochliobolus species*)、例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: *Drechslera*, 同義語: *Helminthosporium*) 又はコクリオボルス・ミヤベアヌス (*Cochliobolus miyabeanus*);

コレトトリクム属各種 (*Colletotrichum species*)、例えば、コレトトリクム・リンデムタニウム (*Colletotrichum lindemuthianum*); シクロコニウム属各種 (*Cycloconium species*)、例えば、シクロコニウム・オレアギヌム (*Cycloconium oleaginum*); ジアボルテ属各種 (*Diaporthe species*)、例えば、ジアボルテ・シトリ (*Diaporthe citri*); エルシノエ属各種 (*Elsinoe species*)、例えば、エルシノエ・ファウセッチイ (*Elsinoe fawcettii*); グロエオスポリウム属各種 (*Gloeosporium species*)、例えば、グロエオスポリウム・ラエチコロール (*Gloeosporium laeticolor*); グロメラ属各種 (*Glomerella species*)、例

10

20

30

40

50

えば、グロメレラ・シングラタ (*Glomerella cingulata*) ; ギイグナルジア属各種 (*Guignardia species*)、例えば、ギイグナルジア・ビドウェリ (*Guignardia bidwelli*) ; レプトスファエリア属各種 (*Leptosphaeria species*)、例えば、レプトスファエリア・マクランズ (*Leptosphaeria maculans*) ; マグナポルテ属各種 (*Magnaporthe species*)、例えば、マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*) ; ミクロドキウム属各種 (*Microdochium species*)、例えば、ミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*) ; ミコスファエレラ属各種 (*Mycosphaerella species*)、例えば、ミコスファエレラ・グラミニコラ (*Mycosphaerella graminicola*)、ミコスファエレラ・アラキジコラ (*Mycosphaerella arachidicola*) 又はミコスファエレラ・フィジエンシス (*Mycosphaerella fijiensis*) ; ファエオスファエリア属各種 (*Phaeosphaeria species*)、例えば、ファエオスファエリア・ノドルム (*Phaeosphaeria nodorum*) ; ピレノホラ属各種 (*Pyrenophora species*)、例えば、ピレノホラ・テレス (*Pyrenophora teres*) 又はピレノホラ・トリチシ・レペンチス (*Pyrenophora tritici repentis*) ; ラムラリア属各種 (*Ramularia species*)、例えば、ラムラリア・コロ・シグニ (*Ramularia collo-cygni*) 又はラムラリア・アレオラ (*Ramularia areola*) ; リンコスボリウム属各種 (*Rhynchosporium species*)、例えば、リンコスボリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*) ; セプトリア属各種 (*Septoria species*)、例えば、セプトリア・アピイ (*Septoria apii*) 又はセプトリア・リコベルシシ (*Septoria lycopersici*) ; スタゴノスポラ属各種 (*Stagonospora species*)、例えば、スタゴノスポラ・ノドルム (*Stagonospora nodorum*) ; チフラ属各種 (*Typhula species*)、例えば、チフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*) ; ベンツリア属各種 (*Venturia species*)、例えば、ベンツリア・イナエクアリス (*Venturia inaequalis*) ;

・ 例えば以下のものに起因する、根及び茎の病害 : コルチシウム属各種 (*Corticium species*)、例えば、コルチシウム・グラミネアルム (*Corticium graminearum*) ; フサリウム属各種 (*Fusarium species*)、例えば、フサリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) ; ガエウマンノミセス属各種 (*Gaeumannomyces species*)、例えば、ガエウマンノミセス・グラミニス (*Gaeumannomyces graminis*) ; プラスモジオホラ属各種 (*Plasmodiophora species*)、例えば、プラスモジオホラ・ブラシカエ (*Plasmodiophora brassicae*) ; リゾクトニア属各種 (*Rhizoctonia species*)、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*) ; サロクラジウム属各種 (*Sarocladium species*)、例えば、サロクラジウム・オリザエ (*Sarocladium oryzae*) ; スクレロチウム属各種 (*Sclerotium species*)、例えば、スクレロチウム・オリザエ (*Sclerotium oryzae*) ; タペシア属各種 (*Tapesia species*)、例えば、タペシア・アクホルミス (*Tapesia acuformis*) ; チエラビオプシス属各種 (*Thielaviopsis species*)、例えば、チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*) ;

・ 例えば以下のものに起因する、穂の病害 (ear and panicle disease) (トウモロコシの穂軸を包含する) : アルテルナリア属各種 (*Alternaria species*)、例えば、アルテルナリア属種 (*Alternaria*

spp.); アスペルギルス属各種 (*Aspergillus species*)、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*); クラドスポリウム属各種 (*Cladosporium species*)、例えば、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*); クラビセプス属各種 (*Claviceps species*)、例えば、クラビセプス・プルプレア (*Claviceps purpurea*); フサリウム属各種 (*Fusarium species*)、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*); ジベレラ属各種 (*Gibberella species*)、例えば、ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*); モノグラフェラ属各種 (*Monographella species*)、例えば、モノグラフェラ・ニバリス (*Monographella nivalis*); スタグノスポラ属各種 (*Stagnospora species*)、例えば、スタグノスポラ・ノドルム (*Stagnospora nodorum*);

・ 例えば以下のものなどの、黒穂病菌類 (*smut fungi*) に起因する病害: スファセロテカ属各種 (*Sphacelotheca species*)、例えば、スファセロテカ・レイリアナ (*Sphacelotheca reiliana*); チレチア属各種 (*Tilletia species*)、例えば、チレチア・カリエス (*Tilletia caries*) 又はチレチア・コントロベルサ (*Tilletia controversa*); ウロシスチス属各種 (*Urocystis species*)、例えば、ウロシスチス・オクルタ (*Urocystis occulta*); ウスチラゴ属各種 (*Ustilago species*)、例えば、ウスチラゴ・ヌダ (*Ustilago nuda*);

・ 例えば以下のものに起因する、果実の腐敗 (*fruit rot*): アスペルギルス属各種 (*Aspergillus species*)、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*); ボトリチス属各種 (*Botrytis species*)、例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*); ペニシリウム属各種 (*Penicillium species*)、例えば、ペニシリウム・エキスパンスム (*Penicillium expansum*) 又はペニシリウム・プルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*); リゾプス属各種 (*Rhizopus species*)、例えば、リゾプス・ストロニフェル (*Rhizopus stolonifer*); スクレロチニア属各種 (*Sclerotinia species*)、例えば、スクレロチニア・スクレロチオルム (*Sclerotinia sclerotiorum*); ベルチシリウム属各種 (*Verticillium species*)、例えば、ベルチシリウム・アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*);

・ 例えば以下のものに起因する、種子及び土壌によって媒介される腐敗病及び萎凋病 (*seed- and soil-borne rot and wilt disease*) 並びに実生の病害: アルテルナリア属各種 (*Alternaria species*)、例えば、アルテルナリア・ブラシシコラ (*Alternaria brassicicola*); アファノミセス属各種 (*Aphanomyces species*)、例えば、アファノミセス・エウテイケス (*Aphanomyces euteiches*); アスコキタ属各種 (*Ascochyta species*)、例えば、アスコキタ・レンチス (*Ascochyta lentis*); アスペルギルス属各種 (*Aspergillus species*)、例えば、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*); クラドスポリウム属各種 (*Cladosporium species*)、例えば、クラドスポリウム・ヘルバルム (*Cladosporium herbarum*); コクリオボルス属各種 (*Cochliobolus species*)、例えば、コクリオボルス・サチブス (*Cochliobolus sativus*) (分生子形態: *Drechslera*、*Bipolaris* 異名: *Helminthosporium*); コレトトリクム属各種 (*Colletotrichum*

species)、例えば、コレトトリウム・ココデス (*Colletotrichum coccodes*); フサリウム属各種 (*Fusarium species*)、例えば、フサリウム・クルモルム (*Fusarium culmorum*); ジベレラ属各種 (*Gibberella species*)、例えば、ジベレラ・ゼアエ (*Gibberella zeae*); マクロホミナ属各種 (*Macrophomina species*)、例えば、マクロホミナ・ファセオリナ (*Macrophomina phaseolina*); ミクロドキウム属各種 (*Microdochium species*)、例えば、ミクロドキウム・ニバレ (*Microdochium nivale*); モノグラフエラ属各種 (*Monographella species*)、例えば、モノグラフエラ・ニバリス (*Monographella nivalis*); ペニシリウム属各種 (*Penicillium species*)、例えば、ペニシリウム・エキspansum (*Penicillium expansum*); ホマ属各種 (*Phoma species*)、例えば、ホマ・リングム (*Phoma lingam*); ホモプシス属各種 (*Phomopsis species*)、例えば、ホモプシス・ソジャエ (*Phomopsis sojae*); フィトフトラ属各種 (*Phytophthora species*)、例えば、フィトフトラ・カクトルム (*Phytophthora cactorum*); ピレノホラ属各種 (*Pyrenophora species*)、例えば、ピレノホラ・グラミネア (*Pyrenophora graminea*); ピリクラリア属各種 (*Pyricularia species*)、例えば、ピリクラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*); ピシウム属各種 (*Pythium species*)、例えば、ピシウム・ウルチムム (*Pythium ultimum*); リゾクトニア属各種 (*Rhizoctonia species*)、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*); リゾプス属各種 (*Rhizopus species*)、例えば、リゾプス・オリザエ (*Rhizopus oryzae*); スクレロチウム属各種 (*Sclerotium species*)、例えば、スクレロチウム・ロルフシイ (*Sclerotium rolfsii*); セプトリア属各種 (*Septoria species*)、例えば、セプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*); チフラ属各種 (*Typhula species*)、例えば、チフラ・インカルナタ (*Typhula incarnata*); ベルチシリウム属各種 (*Verticillium species*)、例えば、ベルチシリウム・ダーリアエ (*Verticillium dahliae*);

・ 例えは以下のものに起因する、癌性病害 (cancer)、こぶ (gall) 及び天狗巢病 (witches' broom): ネクトリア属各種 (*Nectria species*)、例えば、ネクトリア・ガリゲナ (*Nectria galligena*);

・ 例えは以下のものに起因する、萎凋病 (wilt disease): モニリニア属各種 (*Monilinia species*)、例えば、モニリニア・ラキサ (*Monilinia laxa*);

・ 例えは以下のものに起因する、葉、花及び果実の奇形: エキソバシジウム属各種 (*Exobasidium species*)、例えば、エキソバシジウム・ベキサンス (*Exobasidium vexans*); タフリナ属各種 (*Taphrina species*)、例えば、タフリナ・デホルマンス (*Taphrina deformans*);

・ 例えは以下のものに起因する、木本植物の衰退性病害 (degenerative disease): エスカ属各種 (*Esca species*)、例えば、ファエオモニエラ・クラミドスポラ (*Phaeomonniella chlamydospora*)、ファエオアクレモニウム・アレオフィルム (*Phaeoacremonium aleophilum*) 又はフォミチポリア・メジテラネア (*Fomitiporia mediterranea*); ガノデルマ属各種 (*Ganoderma species*)、例えば、ガノデルマ・ボニネンセ (*Ganoderma boninense*);

・ 例えば以下のものに起因する、花及び種子の病害： ボトリチス属各種 (*Botrytis species*)、例えば、ボトリチス・シネレア (*Botrytis cinerea*)；

・ 例えば以下のものに起因する、植物塊茎の病害： リゾクトニア属各種 (*Rhizoctonia species*)、例えば、リゾクトニア・ソラニ (*Rhizoctonia solani*)； ヘルミントスポリウム属各種 (*Helminthosporium species*)、例えば、ヘルミントスポリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*)；

・ 例えば以下のものなどの、細菌性病原体に起因する病害： キサントモナス属各種 (*Xanthomonas species*)、例えば、キサントモナス・カムペストリス *pv.* オリザエ (*Xanthomonas campestris pv. oryzae*)； シュードモナス属各種 (*Pseudomonas species*)、例えば、シュードモナス・シリングア *pv.* ラクリマンズ (*Pseudomonas syringae pv. lachrymans*)； エルウィニア属各種 (*Erwinia species*)、例えば、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*)。

10

【0169】

好ましくは、ダイズの以下の病害を防除する：

・ 例えば以下のものに起因する、葉、茎、鞘及び種子の菌類病：

アルテルナリア斑点病 (*alternaria leaf spot*) (*Alternaria spec. atrans tenuissima*)、炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*)、褐紋病 (*brown spot*) (*Septoria glycines*)、紫斑病 (*cercospora leaf spot and blight*) (*Cercospora kikuchii*)、コアネホラ葉枯病 (*choanephora leaf blight*) (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.))、ダクツリオホラ斑点病 (*dactuliophora leaf spot*) (*Dactuliophora glycines*)、べと病 (*Peronospora manshurica*)、ドレクスレラ胴枯病 (*drechslera blight*) (*Drechslera glycini*)、斑点病 (*frogeye leaf spot*) (*Cercospora sojae*)、そばかす病 (*leptosphaerulina leaf spot*) (*Leptosphaerulina trifolii*)、灰星病 (*phyllosticta leaf spot*) (*Phyllosticta sojaecola*)、黒点病 (*pod and stem blight*) (*Phomopsis sojae*)、うどんこ病 (*Microsphaera diffusa*)、ピレノカエタ斑点病 (*pyrenochaeta leaf spot*) (*Pyrenochaeta glycines*)、葉腐病 (*rhizoctonia aerial, foliage, and web blight*) (*Rhizoctonia solani*)、さび病 (*Phakopsora pachyrhizi, Phakopsora meibomiae*)、黒とう病 (*Sphaceloma glycines*)、ステムフィリウム葉枯病 (*stemphylium leaf blight*) (*Stemphylium botryosum*)、褐色輪紋病 (*Corynespora cassiicola*)；

20

30

40

・ 例えば以下のものに起因する、根及び茎基部の菌類病：

黒根腐病 (*Calonectria crotalariae*)、炭腐病 (*Macrophoma phaseolina*)、赤かび病 (*fusarium blight or wilt, root rot, and pod and collar rot*) (*Fusarium oxysporum, Fusarium orthoceras, Fusarium semitectum, Fusarium equiseti*)、ミコレプトジスクス根腐病 (*mycoleptodiscus root rot*) (

50

Mycoleptodiscus terrestris)、根腐病 (*neocosmospora*) (*Neocosmospora vasinfecta*)、黒点病 (*Diaporthe phaseolorum*)、茎腐爛病 (*stem canker*) (*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*)、茎疫病 (*phytophthora rot*) (*Phytophthora megasperma*)、落葉病 (*brown stem rot*) (*Phialophora gregata*)、根茎腐敗病 (*pythium rot*) (*Pythium aphanidermatum*、*Pythium irregulare*、*Pythium debaryanum*、*Pythium myriotylum*、*Pythium ultimum*)、リゾクトニア根腐病 (*rhizoctonia root rot, stem decay, and damping-off*) (*Rhizoctonia solani*)、菌核病 (*sclerotinia stem decay*) (*Sclerotinia sclerotiorum*)、スクレロチニアサウザンブライト病 (*sclerotinia southern blight*) (*Sclerotinia rolfsii*)、チエラビオプシス根腐病 (*thielaviopsis root rot*) (*Thielaviopsis basicola*)。 10

【0170】

本発明による活性成分は、植物において極めて優れた強化作用 (*fortifying action*) も示す。従って、本発明の活性成分は、望ましくない微生物による攻撃に対して植物自体の防御を動員させるのに適している。 20

【0171】

本発明に関連して、植物を強化する (抵抗性を誘導する) 物質は、処理された植物が、その後で望ましくない微生物を接種されたときに、それら微生物に対して高い程度の抵抗性を発現するように、植物の防御システムを刺激することができる物質を意味するものと理解される。

【0172】

この場合、望ましくない微生物は、植物病原性の菌類及び細菌類を意味するものと理解される。従って、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃に対して植物を保護するために、本発明の物質を用いることができる。保護がもたらされる期間は、植物が該活性成分で処理されてから、一般に、1～10日間、好ましくは、1～7日間に及ぶ。 30

【0173】

植物病害を防除するのに必要とされる濃度の該活性成分に対して植物は十分な耐性を示すという事実により、植物の地上部の処理、繁殖器官 (*propagation stock*) 及び種子の処理、並びに、土壌の処理が可能である。

【0174】

本発明の活性成分は、ブドウ栽培における病害並びにジャガイモ、果実及び野菜の栽培における病害を防除するために、例えば、うどんこ病菌類、卵菌類、例えば、フィトフトラ属各種 (*Phytophthora species*)、プラスモバラ属各種 (*Plasmopara species*)、プセウドペロノスポラ属各種 (*Pseudoperonospora species*) 及びピシウム属各種 (*Pythium species*) などに対して使用して、特に良好な結果を得ることができる。 40

【0175】

本発明の活性成分は、さらにまた、収穫量を増大させるのにも適している。さらに、本発明の活性成分は、毒性も低く、植物も十分な耐性を示す。

【0176】

適切な場合には、本発明の化合物は、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用剤としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (*microbicide*) として、例えば、殺菌剤 (*fungicide*)、抗真菌剤 (*antimycotic*)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウィロイドに対する作用剤も包含する) としても使用し得るか、又は、MLO (マイコバ 50

ラズマ様生物)及びRLO(リケッチア様生物)に対する作用剤としても使用し得る。適切な場合には、それらは、殺虫剤としても使用することができる。適切な場合には、それらは、別の活性成分を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

【0177】

本発明による活性成分は、植物が良好な耐性を示し、温血動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、環境によって十分に許容される場合、植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、並びに、農業において、園芸において、畜産において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において、収穫物の質を向上させるのに適している。それらは、好ましくは、作物保護剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して有効である。

10

【0178】

上記活性成分又は組成物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散(spreading-on)、灌水(灌漑(drenching))、点滴灌漑などによって、直接的に行うか、又は、該活性成分又は組成物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官(propagation material)の場合、特に種子の場合は、さらに、乾燥種子処理、湿潤種子処理、スラリー処理、被覆、1以上の層のコーティングなどによっても行う。さらに、該活性成分を微量散布法(ultra-low volume method)によって施用する(deploy)ことも可能であり、又は、該活性成分調製物/活性成分自体を土壤中に注入することも可能である。

20

【0179】

さらに、材料物質の保護において、本発明の活性成分又は組成物は、望ましくない微生物(例えば、菌類)による攻撃及び破壊に対して工業材料を保護するために用いることもできる。

【0180】

本発明に関連して、工業材料とは、工業において使用するために準備された無生物材料を意味するものと理解される。例えば、本発明の活性成分で微生物による変性又は破壊から保護することが意図されている工業材料は、接着剤、サイズ、紙及び板紙、織物、皮革、木材、塗料及びプラスチック製品、冷却用潤滑油、並びに、微生物によって感染又は破壊され得る別の材料などであり得る。微生物の増殖により悪影響を受け得る製造プラントの部品、例えば、冷却水循環路なども、保護すべき材料の範囲内に包含される。本発明の範囲内における工業材料としては、好ましくは、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、塗料、冷却用潤滑油及び熱媒液などを挙げることができ、さらに好ましくは、木材を挙げることができる。本発明による活性成分又は組成物は、腐朽、腐敗、変色、脱色又は黴発生などの、不利な効果を防止することができる。

30

【0181】

望ましくない菌類を防除するための本発明による方法は、貯蔵品を保護するために使用することもできる。貯蔵品は、長期間の保護が望まれる、植物若しくは動物起源の天然物質又は自然起源のそれら天然物質の加工製品を意味するものと理解される。植物起源の貯蔵品、例えば、植物若しくは植物の分部、例えば、茎、葉、塊茎、種子、果実、穀粒などは、新たに収穫された状態で保護することができるか、又は、(予備)乾燥、加湿、粉碎、摩砕、加圧成形又は焙焼によって加工された後で保護することができる。貯蔵品には、さらに、未加工の木材(例えば、建築用木材、電柱及び柵)又は完成品の形態にある木材(例えば、家具)の両方とも包含される。動物起源の貯蔵品は、例えば、皮革、革製品、毛皮及び獣毛などである。本発明による活性成分は、腐朽、腐敗、変色、脱色又は黴発生などの、不利な効果を防止することができる。

40

50

【0182】

工業材料を劣化又は変性させることができる微生物としては、例えば、細菌類、菌類、酵母類、藻類及び粘菌類 (slime organisms) などを挙げることができる。本発明の活性成分は、好ましくは、菌類、特に、カビ類、材木を変色させる菌類及び材木を破壊する菌類 (担子菌類 (Basidiomycetes))、並びに、粘菌類 (slime organisms) 及び藻類に対して作用する。以下の属の微生物を例として挙げることができる： アルテルナリア (Alternaria)、例えば、アルテルナリア・テヌイス (Alternaria tenuis)； アスペルギルス (Aspergillus)、例えば、アスペルギルス・ニゲル (Aspergillus niger)； カエトミウム (Chaetomium)、例えば、カエトミウム・グロボスム (Chaetomium globosum)； コニオホラ (Coniophora)、例えば、コニオホラ・プエタナ (Coniophora puetana)； レンチヌス (Lentinus)、例えば、レンチヌス・チグリヌス (Lentinus tigrinus)； ペニシリウム (Penicillium)、例えば、ペニシリウム・グラウカム (Penicillium glaucum)； ポリポルス (Polyporus)、例えば、ポリポルス・ベルシコロール (Polyporus versicolor)； アウレオバシジウム (Aureobasidium)、例えば、アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans)； スクレロホマ (Sclerophoma)、例えば、スクレロホマ・ピチオフィラ (Sclerophoma pityophila)； トリコデルマ (Trichoderma)、例えば、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride)； エシェリキア (Escherichia)、例えば、エシェリキア・コリ (Escherichia coli)； シュードモナス (Pseudomonas)、例えば、シュードモナス・アエルギノサ (Pseudomonas aeruginosa)； スタフィロコッカス (Staphylococcus)、例えば、スタフィロコッカス・アウレウス (Staphylococcus aureus)。

【0183】

本発明は、さらに、本発明によるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体のうちの少なくとも1種類を含んでいる、望ましくない微生物を防除するための組成物にも関する。該組成物は、好ましくは、農業上適切な補助剤、溶媒、担体、界面活性剤又は増量剤を含んでいる殺菌剤組成物である。

【0184】

本発明によれば、担体は、特に植物又は植物の部分又は種子への施用に関して、適用性を良好にするために、当該活性成分と混合させるか又は組み合わせる天然又は合成の有機物質又は無機物質である。このような担体は、固体又は液体であり得るが、一般に、不活性であり、そして、農業において使用するのに適しているべきである。

【0185】

有用な固体担体としては、例えば、アンモニウム塩、及び、天然岩粉、例えば、カオリン、クレイ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、合成岩粉、例えば、微粉化シリカ、アルミナ及びシリケートなどがあり； 粒剤に対して有用な固体担体としては、例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び苦灰岩、並びに、さらに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒や、有機材料、例えば、紙、おがくず、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などからなる顆粒などがあり； 有用な乳化剤及び/又は泡形成剤としては、例えば、非イオン性及びアニオン性の乳化剤、例えば、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル類、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル類、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリアルスルホネート類、及び、さらに、タンパク質加水分解物などがあり； 適切な分散剤は、非イオン性及び/又はイオン性の物質、例えば、アルコール-POE及び/又は-POPエーテル類、酸及び/又はPOP-POEエステル類、アルキルアリアル及び/又はPOP-P

OEエーテル類、脂肪及び/又はPOP POE付加体、POE-及び/又はPOP-ポリオール誘導体、POE-及び/又はPOP-ソルビタン若しくは糖付加体、アルキル若しくはアリーのスルフェート類、アルキル若しくはアリーのスルホネート類及びアルキル若しくはアリーのホスフェート類又はそれらの対応するPO-エーテル付加体の類から選ばれたものである。さらにまた、適しているものは、オリゴマー又はポリマー、例えば、ビニルモノマーから誘導されたもの、アクリル酸から誘導されたもの、EO及び/又はPOの単独又は例えば(ポリ)アルコール類若しくは(ポリ)アミン類と組み合わせたものから誘導されたものである。さらに、リグニン及びそのスルホン酸誘導体、未変性セルロース及び変性セルロース、芳香族及び/又は脂肪族スルホン酸並びにそれらのホルムアルデヒドとの付加体なども使用することができる。

10

【0186】

上記活性成分は、溶液剤、エマルジョン剤、水和剤、水性懸濁液剤、油性懸濁液剤、粉末剤(powders)、粉剤(dusts)、ペースト剤、可溶性粉末剤、可溶性顆粒剤、ばらまき用顆粒剤、サスポエマルジョン製剤、活性成分を含浸させた天然産物、活性成分を含浸させた合成物質、肥料、及び、さらに、ポリマー物質中にマイクロカプセル化したもののような、慣習的な製剤に変換することができる。

【0187】

本発明の活性成分は、それだけでも施用することができるし、その製剤の形態又はその製剤の形態から調製された使用形態、例えば、即時使用可能な(ready-to-use)溶液剤、エマルジョン剤、水性懸濁液剤、油性懸濁液剤、粉末剤(powders)、水和剤、ペースト剤、可溶性粉末剤、粉剤(dusts)、可溶性顆粒剤、ばらまき用顆粒剤、サスポエマルジョン製剤、活性成分を含浸させた天然産物、活性成分を含浸させた合成物質、肥料、及び、さらに、ポリマー物質中にマイクロカプセル化したものなどの形態でも施用することができる。施用は、慣習的な方法で、例えば、灌水、散布、噴霧、ばらまき、散粉、泡状散布(foaming)、塗布(spreading-on)などにより行う。さらに、本発明の活性成分は、微量散布法により施用することも可能であり、又は、該活性成分の調製物/活性成分自体を土壌に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

20

【0188】

上記製剤は、自体公知の方法で、例えば、該活性成分を少なくとも1種類の慣習的な増量剤、溶媒若しくは希釈剤、乳化剤、分散剤、及び/又は、結合剤若しくは固定剤、湿潤剤、撥水剤と混合させ、適切な場合には、さらに、乾燥剤及び紫外線安定剤と混合させ、適切な場合には、さらに、染料及び顔料、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、固着剤、ジベレリン類、並びに、さらに、別の加工助剤と混合させることにより、調製することができる。

30

【0189】

本発明は、適切な装置を用いて植物又は種子に対して施用(deploy)可能で且つ既に使用できる状態にある製剤のみではなく、使用前に水で希釈することが必要な商業的な濃厚物も包含する。

【0190】

本発明による活性成分は、それだけで、又は、その(商業用)製剤中に、及び、そのような製剤から調製された使用形態中に、殺虫剤、誘引剤、不妊剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、成長調節剤、除草剤、肥料、薬害軽減剤及び/又は情報化学物質などの別の(既知)活性成分との混合物として、存在させることができる。

40

【0191】

使用する補助剤は、当該組成物自体及び/又はそれから誘導された調製物(例えば、散布液、種子粉衣)に、特定の特性、例えば、特定の技術的特性及び/又特定の生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。典型的な補助剤としては、増量剤、溶媒及び担体などがある。

【0192】

50

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

【0193】

液化ガス増量剤又は担体は、標準温度及び標準圧下では気体である液体、例えば、エーロゾル噴射剤、例えば、ハロ炭化水素類、又は、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などで意味するものと理解される。

【0194】

上記製剤において、粘着性付与剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質などを使用することができる。さらなる添加剤は、鉱油及び植物油であり得る。

【0195】

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

【0196】

本発明の組成物には、さらに、例えば界面活性剤などの、さらなる成分も含有させることができる。適切な界面活性剤は、イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び/若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤であるか、又は、そのような界面活性剤の混合物である。それらの例は、以下のものである：ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリールフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオールの脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリールポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリールスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液及びメチルセルロースなど。該活性成分のうちの1種類及び/又は該不活性担体のうちの1種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが必要である。界面活性剤の割合は、本発明組成物の5重量%～40重量%である。

【0197】

着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（Prussian Blue）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などを使用することができる。

10

20

30

40

50

【0198】

さらなる添加剤は、芳香物質、場合により改質されていてもよい鉱油又は植物油、蠟、並びに、栄養素（微量栄養素を包含する）、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などである。

【0199】

さらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び/若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤であり得る。

【0200】

適切な場合には、付加的な別の成分、例えば、保護コロイド、結合剤、粘着剤、増粘剤、揺変性物質、浸透剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯体形成物質（complex former）なども存在させることができる。一般的に、該活性成分は、製剤目的で通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることが可能である。

10

【0201】

該製剤は、一般に、0.05～99重量%、0.01～98重量%、好ましくは、0.1～95重量%、さらに好ましくは、0.5～90重量%の活性成分を含有し、最も好ましくは、10～70重量%の活性成分を含有する。

【0202】

上記製剤は、望ましくない微生物を防除するための本発明による方法において使用することが可能であり、その際、本発明によるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体は、当該微生物及び/又はそれらの生息環境に施用される。

20

【0203】

本発明による活性成分は、それだけで、又は、その製剤中に含ませて、例えば活性スペクトルを拡大するために又は抵抗性の発達を防止するために、既知の殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、殺線虫剤若しくは殺虫剤と混合した状態で使用することもできる。

【0204】

有用な混合相手剤としては、例えば、既知の殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤又は殺細菌剤などがある（「Pesticide Manual, 14th ed.」も参照されたい）。

【0205】

除草剤のような別の既知活性成分と混合することも可能であり、又は、肥料及び成長調節剤、薬害軽減剤及び/若しくは情報化学物質と混合することも可能である。

30

【0206】

施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

【0207】

本発明は、さらに、種子を処理する方法も包含する。

【0208】

本発明のさらなる態様は、特に、本発明によるヘテロアリアルピペリジン誘導体及びヘテロアリアルピペラジン誘導体のうちの少なくとも1種類で処理された種子に関する。本発明による種子は、有害な植物病原性菌類から種子を保護するための方法において使用される。これらの方法においては、本発明による少なくとも1種類の活性成分で処理された種子を使用する。

40

【0209】

本発明による活性成分又は組成物は、種子を処理するのにも適している。有害な生物に起因する作物植物に対する被害の大部分は、貯蔵中に、又は、播種後、植物が発芽している最中及び発芽の後の両方において、種子が感染することによって起こる。この相は特に危険である。それは、生長している植物の根及び苗条は特に感受性が高く、少量の損傷であってもその植物が死に至り得るからである。従って、適切な組成物を用いて種子及び発芽中の植物を保護することに、大きな関心が持たれている。

【0210】

植物の種子を処理することによる有害な植物病原性菌類の防除は、長い間知られており

50

、継続的に改良が加えられている。しかしながら、種子の処理には、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が伴っている。例えば、播種後又は植物の出芽後に作物保護組成物を追加で施用することを不要とするような又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性成分によって植物自体に損傷を与えることなく、植物病原性菌類による攻撃から種子及び発芽中の植物が最良に保護され得るように、使用する活性成分の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の作物保護組成物を使用して種子及び発芽中の植物の最適な保護を達成するために、トランスジェニック植物の内因性の殺菌特性も考慮に入れるべきである。

【0211】

従って、本発明は、害虫及び/又は有害な植物病原性菌類による攻撃に対して種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を本発明の組成物で処理することによる。本発明は、さらに、種子及び発芽中の植物を植物病原性菌類から保護するために種子を処理するための本発明の組成物の使用にも関する。本発明は、さらに、植物病原性菌類から保護するために、本発明の組成物で処理された種子にも関する。

【0212】

出芽後の植物に損傷を与える害虫及び/又は有害な植物病原性菌類は、主として、土壌及び植物の露出部分を作物保護組成物で処理することによって防除される。作物保護組成物は、環境並びにヒト及び動物の健康に対して影響を及ぼし得ることに懸念があるので、施用する活性成分の量を低減する努力が成されている。

【0213】

本発明の有利な点の1つは、本発明の組成物が有している際立った浸透移行特性によって、そのような組成物で種子を処理することにより、害虫及び/又は有害な植物病原性菌類から、その種子自体が保護されるのみではなく、出芽後に生じる植物も保護されるということである。このようにして、播種時又は播種後間もなくの作物の即時的な処理を省くことができる。

【0214】

さらにまた、本発明の活性成分又は組成物が、特に、トランスジェニック種子(その場合、当該種子から生長した植物は、害虫に対して作用するタンパク質を発現することができる)に対しても使用可能であるということも、有利な点として見なされる。そのような種子を本発明の活性成分又は組成物で処理することによって、特定の害虫は、単にタンパク質(例えば、殺虫性タンパク質)が発現することによって、防除可能である。驚くべきことに、この場合、さらなる相乗効果が観察され得る。そのような相乗効果は、害虫による攻撃に対する保護の有効性をさらに増大させる。

【0215】

本発明の組成物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、該種子は、禾穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワ及びエンバク)、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、インゲンマメ、コーヒー、ビート(例えば、テンサイ及び飼料用ビート)、ラッカセイ、野菜(例えば、トマト、キュウリ、タマネギ及びレタス)、芝及び観賞植物の種子である。特に重要なのは、禾穀類(例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク)、トウモロコシ及びイネの種子を処理することである。

【0216】

以下でも記載されているように、本発明の活性成分又は組成物によるトランスジェニック種子の処理は、特に重要である。これは、殺虫特性を有するポリペプチド又はタンパク質の発現を可能とする少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいる植物の種子に関する。トランスジェニック種子内の異種遺伝子は、例えば、バシルス(*Bacillus*)種、リゾビウム(*Rhizobium*)種、シュードモナス(*Pseudomonas*)種、セラチア(*Serratia*)種、トリコデルマ(*Trichoderma*)種、クラビバクテル(*Clavibacter*)種、グロムス(*Glomus*)種又はグリオクラジ

10

20

30

40

50

ウム (*Gliocladium*) 種の微生物に由来し得る。この異種遺伝子は、好ましくは、バシルス属種 (*Bacillus* sp.) に由来し、この場合、その遺伝子産物は、アワノメイガ (European corn borer) 及び / 又はウェスタンコーンルートワーム (Western corn rootworm) に対して有効ある。該異種遺伝子は、特に好ましくは、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する。

【 0 2 1 7 】

本発明に関連して、本発明の組成物は、種子に対して、単独で施用するか、又は、適切な製剤中に含ませて施用する。好ましくは、種子は、処理中に損傷が生じないように十分なほど安定な状態で処理する。一般に、種子は、収穫と播種の間任意の時点で処理することができる。慣習的に、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉を伴っていない種子を処理する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、含水量が 15 重量%未満となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に、例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子を使用することもできる。

10

【 0 2 1 8 】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、種子から生じた植物が損傷を受けないように、一般に、種子に施用する本発明組成物の量及び / 又はさらなる添加剤の量を確実に選択しなくてはならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性成分の場合には、保証しなくてはならない。

20

【 0 2 1 9 】

本発明の組成物は、直接的に施用することが、即ち、別の成分を含ませることなく、また、希釈することなく、施用することが可能である。一般に、該組成物は、適切な製剤の形態で種子に施用するのが好ましい。種子を処理するための適切な製剤及び方法は、当業者には知られており、そして、例えば、以下の文献に記載されている：US 4, 272, 417、US 4, 245, 432、US 4, 808, 430、US 5, 876, 739、US 2003/0176428、WO 2002/080675、WO 2002/028186。

【 0 2 2 0 】

本発明に従って使用することが可能な活性成分は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物、及び、さらに、ULV製剤などに変換することができる。

30

【 0 2 2 1 】

これらの製剤は、既知方法で、活性成分又は活性成分組合せを、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、調製する。

【 0 2 2 2 】

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

40

【 0 2 2 3 】

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

【 0 2 2 4 】

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

50

分散剤及び／又は乳化剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的に使用される非イオン性、アニオン性及びカチオン性の全ての分散剤である。好ましくは、非イオン性若しくはアニオン性の分散剤又は非イオン性若しくはアニオン性の分散剤の混合物を使用することができる。有用な非イオン性分散剤としては、特に、エチレンオキシド／プロピレンオキシドブロックコポリマー類、アルキルフェノールポリグリコールエーテル類及びトリスチリルフェノールポリグリコールエーテル類、並びに、それらのリン酸化誘導体又は硫酸化誘導体などを挙げるができる。適しているアニオン性分散剤は、特に、リグノスルホネート類、ポリアクリル酸塩類及びアリアルスルホネート／ホルムアルデヒド縮合物である。

【0225】

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

10

【0226】

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

【0227】

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

20

【0228】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができる粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げるができる。

【0229】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤中に存在させることができるジベレリン類は、好ましくは、ジベレリンA1、ジベレリンA3(=ジベレリン酸)、ジベレリンA4及びジベレリンA7であり得る。特に好ましくは、ジベレリン酸を使用する。ジベレリン類は知られている(c f . R . Wegler " Chemie der Pflanzenschutz - und Schadlingsbekämpfungsmittel " [Chemistry of Crop Protection Agents and Pesticides], vol . 2 , Springer Verlag , 1970 , p . 401 - 412) 。

30

【0230】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚製剤(concentrate)又は水で希釈することによって濃厚製剤から得ることができる調製物は、禾穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ及びビートの種子を粉衣するのに使用可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又はそれらの希釈された調製物は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。この場合、発現により形成された物質との相互作用において、付加的な相乗効果が生じることもあり得る。

40

【0231】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤又は水を添加することによってその

50

種子粉衣製剤から調製された調製物を用いて種子を処理する場合、種子粉衣に関して慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣製剤を、そのまま添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該製剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで全てを混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

【0232】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該製剤中の活性成分の特定の含有量及び種子に左右される。活性成分組合せの施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001~50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01~15gである。

10

【0233】

さらに、本発明による式(I)で表される化合物は、極めて優れた抗真菌作用も示す。それらは、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有しており、特に、皮膚系状菌、並びに、酵母菌、カビ及び二相性真菌類に対して〔例えば、カンジダ属各種(*Candida species*)、例えば、カンジダ・アルビカンス(*Candida albicans*)、カンジダ・グラブラタ(*Candida glabrata*)に対して〕、並びに、エピデルモフィトン・フロコスム(*Epidermophyton floccosum*)、アスペルギルス属各種(*Aspergillus species*)、例えば、アスペルギルス・ニゲル(*Aspergillus niger*)及びアスペルギルス・フミガツス(*Aspergillus fumigatus*)、トリコフィトン属各種(*Trichophyton species*)、例えば、トリコフィトン・メンタグロフィテス(*Trichophyton mentagrophytes*)、ミクロスポロン属各種(*Microsporon species*)、例えば、ミクロスポロン・カニス(*Microsporon canis*)及びミクロスポロン・アウドウイニイ(*Microsporon audouinii*)などに対して、極めて広い抗真菌活性スペクトルを有している。これら菌類のリストは、包含され得る真菌スペクトルを決して限定するものではなく、単に例示的な特徴を有している。

20

【0234】

従って、本発明による式(I)で表される活性成分は、医薬用途と非医薬用途の両方で使用することができる。

30

【0235】

本発明の活性成分は、そのままでも使用することができるし、その製剤の形態又はそれから調製された使用形態、例えば、即時使用可能な(*ready-to-use*)溶液剤、懸濁液剤、水和剤、ペースト剤、可溶性粉末剤、粉剤及び顆粒剤などの形態でも使用することができる。施用は、慣習的な方法で、例えば、灌水、散布、噴霧、ばらまき、散粉、泡状散布(*foaming*)、塗布(*spreading-on*)などにより行う。本発明の活性成分は、微量散布法(*ultra-low volume method*)により施用することも可能であり、又は、該活性成分の調製物/活性成分自体を土壤中に注入することも可能である。植物の種子を処理することも可能である。

40

【0236】

本発明の活性成分を殺菌剤として使用する場合、その施用量は、施用の種類に応じて、比較的広い範囲内で変えることができる。本発明による活性成分の施用量は、以下のとおりである：

- 植物の部分、例えば、葉を処理する場合： 0.1~10000g/ha、好ましくは、10~1000g/ha、さらに好ましくは、50~300g/ha(灌水又は滴下による施用の場合、特に、ロックウール又はパーライトなどの不活性底土を用いる場合は、上記施用量はさらに低減させることもできる)；

- 種子を処理する場合： 種子100kg当たり2~200g、好ましくは、種子100kg当たり3~150g、さらに好ましくは、種子100kg当たり2.5~25g、一層さらに好ましくは、種子100kg当たり2.5~12.5g；

50

・ 土壌を処理する場合： 0.1 ~ 10000 g / ha、好ましくは、1 ~ 5000 g / ha。

【0237】

上記施用量は、単に例として挙げられており、本発明の目的に関して限定するものではない。

【0238】

本発明による活性成分は、獣医学の分野及び畜産業においては、既知方法で、例えば、錠剤の形態、カプセル剤の形態、頓服水剤 (p o t i o n) の形態、水薬 (d r e n c h) の形態、顆粒剤の形態、ペースト剤の形態、大型丸薬の形態、フィードスルー法及び坐剤の形態などで腸内投与することにより、並びに、例えば、注射 (筋肉内注射、皮下注射、静脈内注射、腹腔内注射など) 及びインプラントなどにより非経口投与することにより、並びに、鼻内投与することにより、並びに、例えば、浸漬 (d i p p i n g) 又は薬浴 (b a t h i n g)、スプレー、ポアオン及びスポットオン、洗浄及び散粉の形態で皮膚に使用することにより、並びに、さらに、当該活性成分を含有する成形品、例えば、首輪、耳標、尾標、肢バンド (l i m b b a n d s)、端綱、マーキング装置などを用いて、使用する。

10

【0239】

家畜、家禽及び家庭内動物などに使用する場合、式 (I) で表される活性成分は、1 ~ 80 重量 % の量の該活性成分を含有する製剤 (例えば、粉末剤、エマルジョン剤、フロアブル剤など) として、直接的に使用することができるか、又は、100 倍 ~ 10000 倍に希釈した後で使用することができるか、又は、それらは、薬浴として使用することができる。

20

【0240】

即時使用可能な (r e a d y - t o - u s e) 組成物には、場合により、別の殺虫剤も含ませることができ、また、場合により、1 種類以上の殺菌剤も含ませることができる。

【0241】

可能な付加的な混合相手剤に関しては、上記で挙げた殺虫剤及び殺菌剤を参照されたい。

【0242】

さらにまた、本発明による化合物は、海水又は淡水と接触するもの (特に、船体、障壁 (s c r e e n)、網、建造物、係船設備及び信号システム) を付着物に対して保護するために使用することもできる。

30

【0243】

さらに、本発明の化合物は、単独で、又は、別の活性成分と組み合わせて、汚れ止め組成物として用いることもできる。

【0244】

本発明による処理方法は、遺伝子組換え生物 (G M O)、例えば、植物又は種子などを処理するために使用することができる。遺伝子組換え植物 (又は、トランスジェニック植物) は、異種遺伝子がゲノム内に安定的に組み込まれている植物である。表現「異種遺伝子」は、本質的に、供給されたか又は当該植物の外部で構築された遺伝子であって、核のゲノム、葉緑体のゲノム又はミトコンドリア (h y p o c h o n d r i a l) のゲノムの中に導入されたときに、興味深いタンパク質若しくはポリペプチドを発現することにより、又は、その植物体内に存在している別の1つ若しくは複数の遺伝子をダウンレギュレート若しくはサイレンシングすることにより、当該形質転換された植物に新しい又は改善された作物学的特性又は別の特性を付与する遺伝子を意味する [例えば、アンチセンス技術、コサプレッション技術又は R N A i 技術 [R N A 干渉] などを使用する]。ゲノム内に存在している異種遺伝子は、導入遺伝子とも称される。植物ゲノム内におけるその特異的な位置によって定義される導入遺伝子は、形質転換又は遺伝子導入イベントと称される。

40

【0245】

植物種又は植物品種、それらの生育場所及び生育条件 (土壌、気候、生育期、養分 (d

50

iet)) に応じて、本発明の処理により、相加効果を超える効果(「相乗効果」)も生じ得る。例えば、実際に予期される効果を超える以下の効果などが可能である: 本発明に従って使用し得る活性成分及び組成物の施用量の低減及び/又は活性スペクトルの拡大及び/又は活性の増強、植物の生育の向上、高温又は低温に対する耐性の向上、渇水又は水中若しくは土壌中に含まれる塩分に対する耐性の向上、開花能力の向上、収穫の容易性の向上、促進された成熟、収穫量の増加、果実の大きさの増大、植物の高さの増大、葉の緑色の向上、より早い開花、収穫された生産物の品質の向上及び/又は栄養価の増加、果実内の糖度の上昇、収穫された生産物の貯蔵安定性の向上及び/又は加工性の向上。

【0246】

特定の施用量において、本発明による活性成分組合せは、植物に対する強化効果も示し得る。従って、本発明の活性成分組合せは、望ましくない植物病原性の菌類及び/又は微生物類及び/又はウイルス類による攻撃に対して植物の防御システムを動員させるのにも適している。これは、適切な場合には、本発明による組合せの例えば菌類に対する強化された活性の理由のうちの一つであり得る。植物を強化する(抵抗性を誘導する)物質は、本発明に関連して、処理された植物が、その後で望ましくない植物病原性の菌類及び/又は微生物類及び/又はウイルス類を接種されたときに、それらの望ましくない植物病原性の菌類及び/又は微生物類及び/又はウイルス類に対して実質的な程度の抵抗性を示すように、植物の防御システムを刺激することができる物質又は物質の組合せも意味するものと理解されるべきである。この場合、望ましくない植物病原性の菌類及び/又は微生物類及び/又はウイルス類は、植物病原性の菌類、細菌類及びウイルス類を意味するものと理解される。かくして、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃から植物を保護するために、本発明の物質を用いることができる。保護が達成される期間は、植物が該活性成分で処理されてから、一般に、1~10日間、好ましくは、1~7日間に及ぶ。

【0247】

本発明に従って処理するのが好ましい植物及び植物品種には、特に有利で有用な形質を植物に付与する遺伝物質を有している全ての植物(育種によって得られたものであろうと、及び/又は、生物工学的手段によって得られたものであろうと)が包含される。

【0248】

本発明に従って処理するのが同様に好ましい植物及び植物品種は、1以上の生物的ストレス因子に対して抵抗性を示す。即ち、そのような植物は、害虫及び有害微生物に対して、例えば、線虫類、昆虫類、ダニ類、植物病原性の菌類、細菌類、ウイルス類及び/又はウイロイド類などに対して、良好な防御を示す。

【0249】

本発明に従って同様に処理し得る植物及び植物品種は、1以上の非生物的ストレス因子に対して抵抗性を示す植物である。非生物的なストレス状態としては、例えば、渇水、低温条件及び高温条件、浸透ストレス、湛水、土壌中の増大した塩分、鉍物により多く晒されること、オゾン条件、強光条件、利用可能な窒素養分が限られていること、利用可能なリン養分が限られていること、日陰回避などを挙げることができる。

【0250】

本発明に従って同様に処理し得る植物及び植物品種は、増大した収量特性を特徴とする植物である。そのような植物における増大した収量は、例えば、植物の改善された生理機能、生長及び発育、例えば、水の利用効率、水の保持効率、改善された窒素の利用性、強化された炭素同化作用、改善された光合成、上昇した発芽効率及び促進された成熟などの結果であり得る。収量は、さらに、改善された植物の構成(architecture)によっても影響され得る(ストレス条件下及び非ストレス条件下)。そのような改善された植物の構成としては、早咲き、ハイブリッド種子産生のための開花制御、実生の活力、植物の寸法、節間の数及び距離、根の成長、種子の寸法、果実の寸法、莢の寸法、莢又は穂の数、1つの莢又は穂当たりの種子の数、種子の体積、強化された種子充填、低減された種子分散、低減された莢の裂開及び耐倒伏性などがある。収量についてのさらなる形質としては、種子の組成、例えば、炭水化物含有量、タンパク質含有量、油含有量及び油の

10

20

30

40

50

組成、栄養価、抗栄養化合物の低減、改善された加工性並びに向上した貯蔵安定性などがある。

【0251】

本発明に従って処理し得る植物は、雑種強勢 (heterosis) 又は雑種効果 (hybrid effect) (これは、結果として、一般に、増加した収量、向上した活力、向上した健康状態並びに生物的及び非生物的ストレス因子に対する向上した抵抗性をもたらす) の特性を既に呈しているハイブリッド植物である。そのような植物は、典型的には、雄性不稔交配母体近交系 (inbred male-sterile parent line) (雌性親) を別の雄性稔性交配母体近交系 (inbred male-fertile parent line) (雄性親) と交雑させることによって作られる。ハイブリッド種子は、典型的には、雄性不稔植物から収穫され、そして、栽培者に販売される。雄性不稔植物は、場合により (例えば、トウモロコシにおいて)、雄穂を除去することによって (即ち、雄性繁殖器官又は雄花を機械的に除去することによって)、作ることができる。しかしながら、より典型的には、雄性不稔性は、植物ゲノム内の遺伝的決定基の結果である。その場合、及び、特に種子がハイブリッド植物から収穫される所望の生産物である場合、典型的には、雄性不稔性に関する遺伝的決定基を含んでいるハイブリッド植物において雄性稔性を確実に完全に回復させることは有益である。これは、雄性不稔性に関する遺伝的決定基を含んでいるハイブリッド植物において雄性稔性を回復させることが可能な適切な稔性回復遺伝子を雄性親が有していることを確実なものとすることによって達成することができる。雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、細胞質内に存在し得る。細胞質雄性不稔 (CMS) の例は、例えば、アブラナ属各種 (Brassica species) に関して記述された。しかしながら、雄性不稔性に関する遺伝的決定基は、核ゲノム内にも存在し得る。雄性不稔性植物は、遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によっても得ることができる。雄性不稔性植物を得る特に有用な方法は、WO 89/10396 に記載されており、ここでは、例えば、バルナーゼなどのリボヌクレアーゼを雄ずい内のタペータム細胞において選択的に発現させる。次いで、タペータム細胞内においてパルスターなどのリボヌクレアーゼインヒビターを発現させることによって、稔性を回復させることができる。

10

20

【0252】

本発明に従って処理し得る植物又は植物品種 (遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの) は、除草剤耐性植物、即ち、1種類以上の所与の除草剤に対して耐性にされた植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、当該除草剤耐性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

30

【0253】

除草剤耐性植物は、例えば、グリホセート耐性植物、即ち、除草剤グリホセート又はその塩に対して耐性にされている植物である。例えば、グリホセート耐性植物は、酵素 5-エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ (EPSPS) をコードする遺伝子で植物を形質転換させることによって得ることができる。そのような EPSPS 遺伝子の例は、以下のものである: 細菌サルモネラ・チフィムリウム (Salmonella typhimurium) の *aroA* 遺伝子 (突然変異 CT7)、細菌アグロバクテリウム属各種 (Agrobacterium sp.) の CP4 遺伝子、ペチュニアの EPSPS をコードする遺伝子、トマトの EPSPS をコードする遺伝子又はオヒシバ属 (Eleusine) の EPSPS をコードする遺伝子。それは、突然変異 EPSPS であることも可能である。グリホセート耐性植物は、さらにまた、グリホセートオキシドレダクターゼ酵素をコードする遺伝子が発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、さらにまた、グリホセートアセチルトランスフェラーゼ酵素をコードする遺伝子が発現させることによって得ることもできる。グリホセート耐性植物は、さらにまた、上記遺伝子の自然発生突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることもできる。

40

50

【0254】

別の除草剤抵抗性植物は、例えば、酵素グルタミンシンターゼを阻害する除草剤（例えば、ピアラホス、ホスフィノトリシン又はグルホシネート）に対して耐性にされている植物である。そのような植物は、当該除草剤を解毒する酵素を発現させるか、又は、阻害に対して抵抗性を示す突然変異グルタミンシンターゼ酵素を発現させることによって、得ることができる。そのような有効な一解毒酵素は、例えば、ホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼをコードする酵素である（例えば、ストレプトマイセス属各種（*Streptomyces species*）に由来するbarタンパク質又はpatタンパク質など）。外因性のホスフィノトリシンアセチルトランスフェラーゼを発現する植物は、記述されている。

10

【0255】

さらなる除草剤耐性植物は、さらにまた、酵素ヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPD）を阻害する除草剤に対して耐性にされている植物である。ヒドロキシフェニルビルビン酸ジオキシゲナーゼ類は、パラ-ヒドロキシフェニルビルベート（HPP）がホモゲンチセートに変換される反応を触媒する酵素である。HPD阻害薬に対して耐性を示す植物は、自然発生抵抗性HPD酵素をコードする遺伝子を用いて、又は、突然変異HPD酵素をコードする遺伝子を用いて、形質転換させることができる。HPD阻害薬に対する耐性は、さらにまた、HPD阻害薬による天然HPD酵素の阻害にもかかわらずホモゲンチセートを形成させることが可能な特定の酵素をコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによっても得ることができる。HPD阻害薬に対する植物の耐性は、さらにまた、HPD耐性酵素をコードする遺伝子に加えて酵素プレフェナートデヒドロゲナーゼをコードする遺伝子を用いて植物を形質転換させることによって改善することもできる。

20

【0256】

さらなる除草剤抵抗性植物は、アセトラクテートシンターゼ（ALS）阻害薬に対して耐性にされている植物である。既知ALS阻害薬としては、例えば、スルホニル尿素系除草剤、イミダゾリノン系除草剤、トリアゾロピリミジン系除草剤、ピリミジニルオキシ（チオ）ベンゾエート系除草剤、及び/又は、スルホニルアミノカルボニルトリアゾリノン系除草剤などがある。ALS酵素（「アセトヒドロキシ酸シンターゼ（AHAS）」としても知られている）における種々の突然変異体は、種々の除草剤及び除草剤の群に対する耐性を付与することが知られている。スルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物の作製については、国際公開WO 1996/033270に記述されている。さらなるスルホニル尿素耐性植物及びイミダゾリノン耐性植物についても、例えば、WO 2007/024782に記述されている。

30

【0257】

イミダゾリノン及び/又はスルホニル尿素に対して耐性を示す別の植物は、誘導された突然変異誘発によって得ることができるか、当該除草剤の存在下での細胞培養における選抜によって得ることができるか、又は、突然変異育種によって得ることができる。

【0258】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、昆虫抵抗性トランスジェニック植物、即ち、特定の標的昆虫による攻撃に対して抵抗性にされている植物である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような昆虫抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。

40

【0259】

本明細に関連して、用語「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」には、以下のものをコードするコード配列を含んでいる少なくとも1の導入遺伝子を含んでいる任意の植物が含まれる：

(1) バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する殺虫性結晶タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、オンライ

50

ン「http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/」において列挙されている殺虫性結晶タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、Cryタンパク質類(Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Ae、又は、Cry3Bb)のタンパク質又はその殺虫活性を示す一部分；又は、

(2) バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する第2の別の結晶タンパク質又はその一部分の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する結晶タンパク質又はその一部分、例えば、Cry34結晶タンパク質とCry35結晶タンパク質で構成されているバイナリートキシン；又は、

(3) バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する2種類の異なった殺虫性結晶タンパク質の一部分を含んでいる殺虫性ハイブリッドタンパク質、例えば、上記(1)のタンパク質のハイブリッド、又は、上記(2)のタンパク質のハイブリッド、例えば、トウモロコシイベントMON98034によって産生されるCry1A.105タンパク質(WO 2007/027777)；又は、

(4) 上記項目(1)~項目(3)のいずれか1つのタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び/又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び/又は、クローニング若しくは形質転換に際してコード化DNA中に誘導された変化に起因して、幾つかのアミノ酸(特に、1~10のアミノ酸)が別のアミノ酸で置き換えられているもの、例えば、トウモロコシイベントMON863若しくはMON88017におけるCry3Bb1タンパク質又はトウモロコシイベントMIR604におけるCry3Aタンパク質；又は、

(5) バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)又はバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)に由来する殺虫性分泌タンパク質又はその殺虫活性を示す一部分、例えば、「http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html」において挙げられている栄養生長期殺虫性タンパク質(vegetative insecticidal protein)(VIP)、例えば、VIP3Aaタンパク質類のタンパク質；又は、

(6) バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)又はバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)に由来する第2の分泌タンパク質の存在下において殺虫活性を示す、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)又はバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)に由来する分泌タンパク質、例えば、VIP1aタンパク質とVIP2Aタンパク質で構成されているバイナリートキシン；

(7) バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)又はバシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)に由来する異なった分泌タンパク質の一部分を含んでいる殺虫性ハイブリッドタンパク質、例えば、上記(1)のタンパク質のハイブリッド、又は、上記(2)のタンパク質のハイブリッド；又は、

(8) 上記項目(1)~項目(3)のいずれか1つのタンパク質において、標的昆虫種に対するさらに強い殺虫活性を得るために、及び/又は、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、及び/又は、クローニング若しくは形質転換に際してコード化DNA中に誘導された変化(それでも、まだ、殺虫性タンパク質をコードしている)に起因して、幾つかのアミノ酸(特に、1~10のアミノ酸)が別のアミノ酸で置き換えられているもの、例えば、ワタイイベントCOT102におけるVIP3Aaタンパク質。

【0260】

もちろん、「昆虫抵抗性トランスジェニック植物」は、本明細書中で使用されている場合、上記クラス(1)~(8)のいずれか1つのタンパク質をコードする遺伝子の組合せを含んでいる任意の植物も包含する。一実施形態では、影響を受ける標的昆虫種の範囲を拡大するために、又は、同一の標的昆虫種に対して殺虫活性を示すが作用機序は異なって

10

20

30

40

50

いる（例えば、当該昆虫体内の異なった受容体結合部位に結合する）異なったタンパク質を用いることによって当該植物に対する昆虫の抵抗性の発達を遅延させるために、昆虫抵抗性植物は、上記クラス（１）～（８）のいずれか１つのタンパク質をコードする２つ以上の導入遺伝子を含んでいる。

【０２６１】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、非生物学的ストレス因子に対して耐性を示す。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのようなストレス抵抗性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。特に有用なストレス耐性植物としては、以下のものなどがある：

（a）植物細胞内又は植物体内におけるポリ（ADP-リボース）ポリメラーゼ（PARP）遺伝子の発現及び／又は活性を低減させることが可能な導入遺伝子を含んでいる植物；

（b）植物又は植物細胞のPARGコード化遺伝子の発現及び／又は活性を低減させることが可能なストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物；

（c）ニコチンアミダーゼ、ニコチン酸ホスホリボシルトランスフェラーゼ、ニコチン酸モノヌクレオチドアデニルトランスフェラーゼ、ニコチンアミドアデニンジヌクレオチドシンターゼ又はニコチンアミドホスホリボシルトランスフェラーゼを包含するニコチンアミドアデニンジヌクレオチドサルベージ生合成経路の植物機能性酵素（plant-functional enzyme）をコードするストレス耐性を強化する導入遺伝子を含んでいる植物。

【０２６２】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、収穫された生産物の改変された量、品質及び／若しくは貯蔵安定性、並びに／又は、収穫された生産物の特定の成分の改変された特性を示す。例えば：

（１）野生型の植物細胞又は植物において合成された澱粉と比較して、その物理化学的形質〔特に、アミロース含有量若しくはアミロース／アミロペクチン比、枝分かれ度、平均鎖長、側鎖の分布、粘性挙動、ゲル抵抗（gel resistance）、澱粉粒径及び／又は澱粉の粒子形態〕に関して改変されていて、特定の用途により適した変性澱粉を合成するトランスジェニック植物；

（２）非澱粉炭水化物ポリマーを合成するか、又は、遺伝子組換えがなされていない野生型植物と比較して改変された特性を有する非澱粉炭水化物ポリマーを合成する、トランスジェニック植物〔その例は、ポリフルクトース（特に、イヌリン型及びレバン型のポリフルクトース）を産生する植物、 α -1,4-グルカン類を産生する植物、 α -1,6-分枝 α -1,4-グルカン類を産生する植物、及び、アルテルナンを産生する植物である〕；

（３）ヒアルロナンを産生するトランスジェニック植物。

【０２６３】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種（遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの）は、改変された繊維特性を有する植物（例えば、ワタ植物）である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変された繊維特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものなどがある：

（a）セルロースシンターゼ遺伝子の改変された形態を含んでいる植物（例えば、ワタ植物）；

（b）rsw2相同核酸又はrsw3相同核酸の改変された形態を含んでいる植物（例えば、ワタ植物）；

（c）スクロースリン酸シンターゼの発現が増大している植物（例えば、ワタ植物）

；

10

20

30

40

50

(d) スクロースシンターゼの発現が増大している植物(例えば、ワタ植物)；

(e) 繊維細胞に基づいた原形質連絡のゲーティングのタイミングが(例えば、繊維選択的 - 1, 3 - グルカナーゼのダウンレギュレーションを介して) 改変されている植物(例えば、ワタ植物)；

(f) 反応性が(例えば、nodCを包含するN - アセチルグルコサミントランスフェラーゼ遺伝子の発現及びキチンシンターゼ遺伝子の発現を介して) 改変されている繊維を有する植物(例えば、ワタ植物)。

【0264】

本発明に従って同様に処理し得る植物又は植物品種(遺伝子工学などの植物バイオテクノロジー法によって得られたもの)は、改変されたオイルプロファイル特性を有する植物(例えば、ナタネ植物又は関連するアブラナ属植物)である。そのような植物は、遺伝的形質転換によって得ることができるか、又は、そのような改変されたオイル特性を付与する突然変異を含んでいる植物を選抜することによって得ることができる。そのような植物としては、以下のものなどがある：

(a) オレイン酸含有量が高いオイルを産生する植物(例えば、ナタネ植物)；

(b) リノレン酸含有量が低いオイルを産生する植物(例えば、ナタネ植物)；

(c) 飽和脂肪酸のレベルが低いオイルを産生する植物(例えば、ナタネ植物)。

【0265】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、1種類以上の毒素をコードする1種類以上の遺伝子を含んでいる植物であって、以下の商品名で販売されているトランスジェニック植物である：YIELD GARD(登録商標)(例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、Knock Out(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、Bite Gard(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、BT - Xtra(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、Star Link(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、Bollgard(登録商標)(ワタ)、Nucotn(登録商標)(ワタ)、Nucotn 33B(登録商標)(ワタ)、Nature Gard(登録商標)(例えば、トウモロコシ)、Protecta(登録商標)及びNew Leaf(登録商標)(ジャガイモ)。挙げるべき除草剤耐性植物の例は、以下の商品名で入手可能なトウモロコシ品種、ワタ品種及びダイズ品種である：Roundup Ready(登録商標)(グリホセートに対する耐性、例えば、トウモロコシ、ワタ、ダイズ)、Liberty Link(登録商標)(ホスフィノトリシンに対する耐性、例えば、ナタネ)、IMI(登録商標)(イミダゾリノン系に対する耐性)及びSCS(登録商標)(スルホニル尿素系に対する耐性、例えば、トウモロコシ)。挙げることができる除草剤抵抗性植物(除草剤耐性に関して慣習的な方法で品種改良された植物)としては、Clearfield(登録商標)(例えば、トウモロコシ)の商品名で販売されている品種などがある。

【0266】

本発明に従って処理し得る特に有用なトランスジェニック植物は、形質転換イベント又は形質転換イベントの組合せを含んでいる植物であり、それらは、例えば、国又は地域のさまざまな規制機関に関するデータベースに記載されている[例えば、「http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx」及び「<http://www.agbios.com/database.php>」を参照されたい]。

【0267】

上記で挙げられている植物は、本発明に従って、一般式(I)で表される化合物及び/又は本発明による活性成分混合物を用いて、特に有利に処理することができる。該活性成分又は混合物に関して上記で示されている好ましい範囲は、これら植物の処理にも当てはまる。特に重要なのは、本明細書中において具体的に挙げられている化合物又は混合物を用いた植物の処理である。

【0268】

本発明の活性成分又は組成物は、かくして、処理後ある一定の期間、上記病原体による攻撃から植物を保護するために用いることができる。保護がもたらされる期間は、植物が

10

20

30

40

50

該活性成分で処理されてから、一般に、1～28日間、好ましくは、1～14日間、特に好ましくは、1～10日間、極めて特に好ましくは、1～7日間に及び、又は、種子処理後、最大で200日間に及び。

【0269】

下記実施例によって、本発明による式(I)で表される活性成分の調製及び使用について例証する。しかしながら、本発明は、それら実施例に限定されるものではない。

【実施例】

【0270】

調製実施例

一般注意事項： 特に別途示されていない限り、クロマトグラフィーによる全ての精製段階及び分離段階は、0：100の酢酸エチル/シクロヘキサンから100：0の酢酸エチル/シクロヘキサンまでの溶媒の勾配を使用してシリカゲル上で実施する。

【0271】

式(I)で表される化合物の調製

2 - { 3 - [2 - (1 - { [(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } ベンズアルデヒド (I - 8)

4 - { 4 - [5 - (2 - ホルミルフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (2 . 2 0 g) を 1 , 4 - ジオキサランに溶解させた溶液に、0 で、1 , 4 - ジオキサラン中の塩化水素の4モル溶液 (1 2 m L) を滴下して加えた。その反応混合物を0 で攪拌し、次いで、室温まで徐々に昇温させた。一晚攪拌した後、その溶媒及び過剰な塩化水素を除去した。これにより、4 - { 4 - [5 - (2 - ホルミルフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロリド (X I I I a - 9 9 , 2 . 0 g) が得られた。

【0272】

[(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] 酢酸 (1 8 5 m g) をジクロロメタン (1 0 m L) に溶解させた溶液に、0 で、塩化オキサリル (1 6 8 μ L) 及び1滴のN , N - ジメチルホルムアミドを添加した。その反応混合物を室温で120分間攪拌した。その後、その溶媒及び過剰な試薬を減圧下で除去した。その固体残渣を、再度、ジクロロメタンに溶解させ、0 で、4 - { 4 - [5 - (2 - ホルミルフェニル) - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジニウムクロリド (4 8 4 m g) とトリエチルアミン (3 5 7 μ L) をジクロロメタン (1 0 m L) に溶解させた溶液に滴下して加えた。その反応混合物を室温で1時間攪拌した。次いで、それに、濃炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、2 - { 3 - [2 - (1 - { [(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } ベンズアルデヒド (1 5 0 m g) を得た。

【0273】

2 - { 3 - [2 - (1 - { [(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニルメタンスルホネート (I - 1 2)

アセトンオキシム (9 . 3 m g) をN , N - ジメチルホルムアミド (0 . 2 8 m L) に溶解させた溶液に、室温で、3 モレキュラーシーブを添加し、その混合物をその温度で2時間攪拌した。その後、それに、2 - (3 - { 2 - [1 - (クロロアセチル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (5 0 m g) 及び炭酸セシウム (6 4 m g) を添加し、その混合物を室温で18時間攪拌した。その後、その混合物を濾過し、酢酸エチルで2回抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。カラ

10

20

30

40

50

ムクロマトグラフィーで精製して、2 - { 3 - [2 - (1 - { [(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニルメタンスルホネート (5 m g 、 1 0 %) を得た。

【 0 2 7 4 】

式 (I V) で表される化合物の調製

[(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] 酢酸 (I V - 1)

(アミノオキシ) 酢酸ヘミヒドロクロリド (2 . 5 1 g) とアセトン (6 . 0 g) の混合物を室温で 6 4 時間攪拌した。その後、その混合物にジクロロメタン (1 0 m L) を添加した。その後、その溶媒及び過剰な試薬を減圧下で除去した。これにより、[(プロパン - 2 - イリデンアミノ) オキシ] 酢酸 (3 . 1 g) が得られた。これは、それ以上精製することなくさらに変換した。

10

【 0 2 7 5 】

({ [1 - (4 - フルオロフェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) 酢酸 (I V - 2)

段階 1 :

アセトニトリル中の 1 - (4 - フルオロフェニル) エタノンオキシム (8 . 0 0 g) と炭酸セシウム (2 0 . 4 g) の混合物を 2 0 で 3 0 分間攪拌した。次いで、それに、プロモ酢酸エチル (1 2 . 2 g) 及びヨウ化カリウム (8 . 7 g) を添加し、その混合物を 8 2 で 3 時間攪拌した。次いで、その反応混合物を濾過した。その濾液から減圧下で溶媒を除去した。クロマトグラフィーで精製して、({ [1 - (4 - フルオロフェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) 酢酸エチル (8 . 7 g) を得た。

20

【 0 2 7 6 】

段階 2 :

({ [1 - (4 - フルオロフェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) 酢酸エチル (8 . 7 g) を 5 0 m L のテトラヒドロフランと 1 0 m L の水の混合物に溶解させた溶液に、2 0 で、水酸化リチウム一水和物 (2 . 3 g) を添加し、その混合物をその温度で 1 8 時間攪拌した。その後、その混合物を攪拌しながら氷冷 1 0 % 塩酸の中に入れ、酢酸エチル (毎回 5 0 m L) で 2 回抽出した。その有機相を合して硫酸ナトリウムで脱水し、濃縮した。0 : 1 0 0 のメタノール / ジクロロメタンから 6 0 : 0 のメタノール / ジクロロメタンまでの溶媒勾配を使用するシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、({ [1 - (4 - フルオロフェニル) エチリデン] アミノ } オキシ) 酢酸 (2 . 9 g) を得た。

30

【 0 2 7 7 】

式 (X) で表される化合物の調製

2 - (3 - { 2 - [1 - (N , N - ジメチルグリシル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (X - 1)

ジメチルホルムアミド (6 m L) の中の 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジニウムクロリド (5 0 0 m g) に、アルゴン下、N , N - ジメチルグリシン (1 2 2 m g) 、 ジイソプロピルエチルアミン (5 8 2 m g) 及び O - (ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (T B T U 、 5 4 2 m g) を添加した。その反応混合物を室温で 1 8 時間攪拌した。次いで、それに、氷冷炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その混合物を濾過した。その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。これにより、2 - (3 - { 2 - [1 - (N , N - ジメチルグリシル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (3 1 0 m g 、 5 5 %) が得られた。

40

【 0 2 7 8 】

Log P (p H 2 . 7) : 1 . 4 8 .

50

【0279】

2 - (3 - { 2 - [1 - ({ [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } アセチル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (X - 2)

ジメチルホルムアミド (6 m L) の中の 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジニウムクロリド (5 0 0 m g) に、アルゴン下、{ [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } 酢酸 (2 2 5 m g) 、ジイソプロピルエチルアミン (5 8 2 m g) 及び O - (ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (T B T U , 5 4 2 m g) を添加した。その反応混合物を室温で 1 8 時間攪拌した。次いで、それに、氷冷炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その混合物を濾過した。その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、2 - (3 - { 2 - [1 - ({ [t e r t - ブチル (ジメチル) シリル] オキシ } アセチル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (1 5 0 m g 、 2 2 %) を得た。

【0280】

Log P (p H 2 . 7) : 4 . 1 4 .

【0281】

2 - { 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル } - 2 - オキソエチルアセテート (X - 3)

ジクロロメタン (6 m L) の中の 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジニウムクロリド (5 0 0 m g) に、アルゴン下、2 - クロロ - 2 - オキソエチルアセテート (1 5 4 m g) 及びトリエチルアミン (3 4 2 m g) を添加した。その反応混合物を室温で 1 8 時間攪拌した。次いで、それに水を添加し、濾過し、脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、2 - { 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル } - 2 - オキソエチルアセテート (1 7 0 m g 、 3 0 %) を得た。

【0282】

Log P (p H 2 . 7) : 2 . 1 8

2 - (3 - { 2 - [1 - (クロロアセチル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (X c - a - 1 4 2)

クロロアセチルクロリド (2 2 m g) の溶液に、0 で、4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジニウムクロリド (8 7 m g) とトリエチルアミン (4 1 m g) をジクロロメタン (1 m L) に溶解させた溶液を添加した。その反応混合物を 0 で 1 5 分間攪拌し、室温でさらに 1 8 時間攪拌した。次いで、それに水を添加した。その水相を除去し、ジクロロメタンで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、2 - (3 - { 2 - [1 - (クロロアセチル) ピペリジン - 4 - イル] - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル) フェニルメタンスルホネート (6 0 m g 、 6 0 %) を得た。

【0283】

Log P (p H 2 . 7) : 2 . 4 2

¹H NMR (2 5 0 M H z , C D C l ₃) : p p m : 1 . 7 - 2 . 0 (m , 2 H) ,

2.15 - 2.35 (m, 2H), 2.80 - 2.95 (m, 1H), 3.05 - 3.20 (m, 1H), 3.30 (s, 3H), 3.27 - 3.38 (m, 1H), 3.39 - 3.50 (dd, 1H), 3.85 - 3.97 (dd, 1H), 3.90 - 4.10 (m, 1H), 4.20 (s, 2H), 4.55 - 4.66 (m, 1H), 5.98 - 6.06 (dd, 1H), 7.30 - 7.42 (m, 3H), 7.55 - 7.62 (m, 1H), 7.62 (s, 1H)。

【0284】

式 (XXVII a) で表される化合物の調製

2 - { 3 - [2 - (1 - グリコロイルピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニルメタンスルホネート (XXVII a - 142)

ジメチルホルムアミド (6 mL) の中の 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジニウムクロリド (110 mg) に、アルゴン下、グリコール酸 (19 mg)、ジイソプロピルエチルアミン (32 mg) 及び O - (ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (TBTU、159 mg) を添加した。次いで、その反応混合物にジイソプロピルエチルアミン (64 mg) を再度添加した。その反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。次いで、それに、氷冷炭酸水素ナトリウム溶液を添加し、その混合物を濾過した。その水相を除去し、ジクロロメタンで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、2 - { 3 - [2 - (1 - グリコロイルピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } フェニルメタンスルホネート (15 mg、12%) を得た。

【0285】

Log P (pH 2.7) : 1.88

¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) : ppm : 1.7 - 1.9 (m, 2H), 2.15 - 2.25 (m, 2H), 2.88 - 3.00 (m, 1H), 3.10 - 3.20 (m, 1H), 3.27 (s, 3H), 3.27 - 3.38 (m, 1H), 3.39 - 3.47 (dd, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.89 - 3.97 (dd, 1H), 4.20 (s, 2H), 4.60 - 4.66 (m, 1H), 5.98 - 6.06 (dd, 1H), 7.30 - 7.40 (m, 3H), 7.55 - 7.60 (m, 1H), 7.61 (s, 1H)。

【0286】

式 (XVI) で表される化合物の調製

4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (XVI - 143)

2 - [3 - (クロロアセチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル] - 5 - (トリフルオロメチル) フェニルメタンスルホネート (200 mg) と 4 - カルバモチオイルピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル (108 mg) をテトラヒドロフラン (2 mL) に溶解させた溶液に、室温で、テトラブチルアンモニウムブロミドを添加した。その反応混合物を室温で 12 時間攪拌した。次いで、それに水を添加した。その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、tert - ブチル 4 - [4 - (5 - { 2 - [(メチルスルホニル) オキシ] - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル } - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル) - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - カルボン酸 ate (168 mg、56%) を得た。

【0287】

Log P (pH 2.7) : 4.36。

【0288】

10

20

30

40

50

式 (V I I a) で表される化合物の調製

2 - [3 - (クロロアセチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル] - 5 - (トリフルオロメチル) フェニルメタンスルホネート (V I I a - a - 1 4 3)

5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ビニルフェニルメタンスルホネート (1 . 0 5 g) をアセトニトリル (1 0 m L) に溶解させた溶液に、アルゴン下、室温で、炭酸水素ナトリウム (2 . 5 5 g) 及び 3 - クロロ - N - ヒドロキシ - 2 - オキソプロパンイミドイルクロリド (0 . 6 0 g) を添加した。その反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。その固体を吸引濾過し、その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣をヘプタンと一緒に攪拌して、2 - [3 - (クロロアセチル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル] - 5 - (トリフルオロメチル) フェニルメタンスルホネート (1 . 3 3 g 、 純度 8 6 % 、 7 5 %) を得た。

【 0 2 8 9 】

Log P (p H 2 . 7) : 3 . 2 5

式 (V I I I) で表される化合物の調製

1 - [5 - (2 - { [プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] エタノン (V I I I a - a - 8 1)

段階 1 :

3 , 3 - ジメトキシブタン - 2 - オン (1 . 0 0 g) をエタノール (1 0 m L) に溶解させた溶液に、室温で、ヒドロキシルアミン (水中 5 0 % 、 0 . 2 3 m L) を滴下して加えた。その反応混合物を 5 0 で 4 時間攪拌した。次いで、それに水を添加した。その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。これにより、3 , 3 - ジメトキシブタン - 2 - オンオキシム (8 0 0 m g 、 7 2 %) が得られた。

【 0 2 9 0 】

段階 2 :

3 , 3 - ジメトキシブタン - 2 - オンオキシム (2 7 0 m g) をテトラヒドロフラン (2 . 7 m L) に溶解させた溶液に、アルゴン下、0 で、n - ブチルリチウム (テトラヒドロフラン中 2 M 、 1 . 8 3 m L) を滴下して加えた。さらに 5 分間攪拌した後、その反応混合物に、2 - { [3 - (トリメチルシリル) プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } ベンズアルデヒド (2 3 2 m g) をテトラヒドロフラン (1 m L) に溶解させた溶液を滴下して加え、それを、さらに 1 時間攪拌した。その後、その反応混合物に濃塩化アンモニウムを添加した。その水相を除去し、酢酸エチルで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。カラムクロマトグラフィーで精製して、1 - ヒドロキシル - 4 , 4 - ジメトキシ - 1 - (2 - { [3 - (トリメチルシリル) プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } フェニル) ペンタン - 3 - オンオキシム (4 8 2 m g 、 6 9 %) を得た。

【 0 2 9 1 】

Log P (p H 2 . 7) : 3 . 1 9 .

【 0 2 9 2 】

段階 3 :

1 - ヒドロキシル - 4 , 4 - ジメトキシ - 1 - (2 - { [3 - (t r i メチルシリル) プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } フェニル) ペンタン - 3 - オンオキシムに、塩酸溶液 (ジオキサン中 4 M 、 3 . 8 0 m L) を添加した。さらに 1 5 分間攪拌した後、その反応混合物に濃炭酸水素ナトリウム溶液を添加した。その水相を除去し、ジクロロメタンで抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、濃縮した。これにより、1 - [5 - (2 - { [プロパ - 2 - イン - 1 - イル] オキシ } フェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル] エタノン (3 1 5 m g 、 9 9 %) が得られた。

【 0 2 9 3 】

Log P (p H 2 . 7) : 4 . 4 1 .

【 0 2 9 4 】

10

20

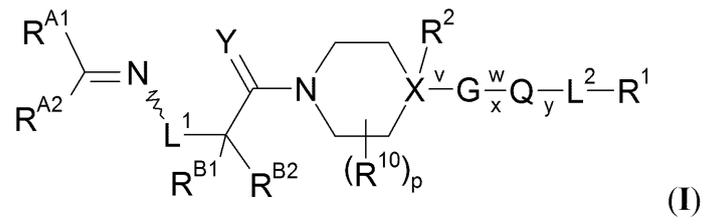
30

40

50

化合物例

【化35】

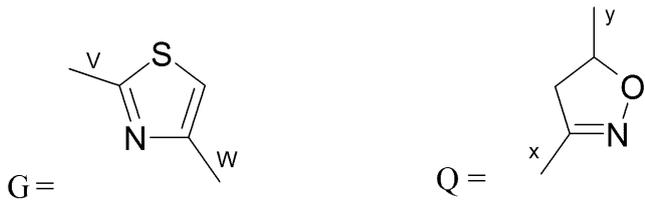


10

【0295】

表1に記載されている構造要素G及びQは、以下のように定義される：

【化36】



20

【0296】

表1に記載されている全ての化合物に関して、 $p = 0$ であり、及び、 $L^2 =$ 直接結合である。

【0297】

表1：

【表 1】

Ex.	R ^{A1}	R ^{A2}	L ¹	R ^{B1}	R ^{B2}	Y	X	R ²	R ¹	Log P
I-1	CH ₃	1,3-ベンゾジオキソール-5-イル	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.29 ^[a] , 3.28 ^[b]
I-2	プロパン-2-イル	4-エトキシフェニル	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	4.19 ^[a] , 4.21 ^[b]
I-3	CH ₃	3-フルオロフェニル	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.48 ^[a] , 3.51 ^[b]
I-4	CH ₃	3,4-ジメチルフェニル	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	3.93 ^[a] , 3.94 ^[b]
I-5	CH ₃	3-(トリフルオロメトキシ)フェニル	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	4.01 ^[a] , 4.01 ^[b]
I-6	CH ₃	3,4-ジメチルフェニル	O	H	H	O	C	H	5-フルオロ-2-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	4.18 ^[a] , 4.19 ^[b]
I-7	プロパン-2-イル	4-エトキシフェニル	O	H	H	O	C	H	5-フルオロ-2-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	4.42 ^[a] , 4.42 ^[b]
I-8	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-ホルミルフェニル	2.45 ^[a]
I-9	CH ₃	トリフルオロメチル	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル	2.91 ^[a]
I-10	CH ₃	トリフルオロメチル	O	H	H	O	C	H	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル	2.94 ^[a]
I-11	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-(7°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル	2.75 ^[a]
I-12	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル	2.36 ^[a]
I-13	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-フルオロ-6-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル	2.34 ^[a]
I-14	CH ₃	1,1-ジメチルエチル	O	H	H	O	C	H	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル	3.42 ^[a]

10

20

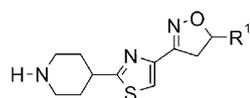
30

40

【 0 2 9 8 】

表 2 :

【表 2】



Ex.	R ¹
XIIIa-1	2,3-ジ°クロロ-4-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-2	2,3-ジ°クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-3	2,3-ジ°フルオロ-4-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-4	2,3-ジ°フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-5	2,3-ジ°フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-6	2,4-ジ°クロロ-3-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-7	2,4-ジ°クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-8	2,4-ジ°フルオロ-3-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-9	2,4-ジ°フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-10	2,4-ジ°フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-11	2,5-ジ°クロロ-3-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-12	2,5-ジ°クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-13	2,5-ジ°クロロ-4-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-14	2,5-ジ°クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-15	2,5-ジ°フルオロ-3-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-16	2,5-ジ°フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-17	2,5-ジ°フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-18	2,5-ジ°フルオロ-4-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-19	2,5-ジ°フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-20	2,5-ジ°フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-21	2,6-ジ°クロロ-3-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-22	2,6-ジ°クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-23	2,6-ジ°クロロ-4-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-24	2,6-ジ°クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-25	2,6-ジ°フルオロ-3-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-26	2,6-ジ°フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-27	2,6-ジ°フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-28	2,6-ジ°フルオロ-4-(フ°ロハ°-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-29	2,6-ジ°フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-30	2,6-ジ°フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-31	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ°クロロフェニル
XIIIa-32	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ°フルオロフェニル

10

20

30

40

Ex.	R ¹
XIIIa-33	2-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-34	2-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-35	2-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-36	2-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-37	2-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
XIIIa-38	2-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
XIIIa-39	2-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
XIIIa-40	2-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-41	2-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-42	2-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-43	2-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-44	2-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
XIIIa-45	2-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
XIIIa-46	2-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
XIIIa-47	2-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-48	2-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-49	2-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
XIIIa-50	2-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
XIIIa-51	2-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
XIIIa-52	2-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
XIIIa-53	2-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
XIIIa-54	2-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
XIIIa-55	2-(アリルオキシ)フェニル
XIIIa-56	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-57	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-58	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-59	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-60	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-61	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-62	2-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
XIIIa-63	2-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
XIIIa-64	2-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
XIIIa-65	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-66	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-67	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-68	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-69	2-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-70	2-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
XIIIa-71	2-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
XIIIa-72	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-73	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-74	2-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
XIIIa-75	2-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
XIIIa-76	2-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
XIIIa-77	2-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
XIIIa-78	2-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル
XIIIa-79	2-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
XIIIa-80	2-(シアノメトキシ)フェニル
XIIIa-81	2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-82	2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェニル
XIIIa-83	2-クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-84	2-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-85	2-クロロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-86	2-クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-87	2-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-88	2-クロロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-89	2-フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-90	2-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-91	2-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-92	2-フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-93	2-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-94	2-フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-95	2-ホルミル-3-メチルフェニル
XIIIa-96	2-ホルミル-4-メチルフェニル
XIIIa-97	2-ホルミル-5-メチルフェニル
XIIIa-98	2-ホルミル-6-メチルフェニル
XIIIa-99	2-ホルミルフェニル
XIIIa-100	2-メチル-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-101	2-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-102	2-メチル-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-103	2-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-104	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-105	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-106	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-107	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XIIIa-108	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XIIIa-109	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XIIIa-110	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-111	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-112	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XIIIa-113	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XIIIa-114	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XIIIa-115	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-116	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XIIIa-117	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XIIIa-118	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XIIIa-119	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XIIIa-120	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XIIIa-121	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XIIIa-122	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
XIIIa-123	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-124	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-125	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-126	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XIIIa-127	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XIIIa-128	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XIIIa-129	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-130	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-131	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XIIIa-132	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XIIIa-133	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XIIIa-134	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-135	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XIIIa-136	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XIIIa-137	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XIIIa-138	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XIIIa-139	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XIIIa-140	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XIIIa-141	2-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
XIIIa-142	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-143	2-[(メチルスルホニル)オキシ]-4-(トリフルオロメチル)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-144	3,4-ジ ^o クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-145	3,4-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-146	3,4-ジ ^o フルオロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-147	3,4-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-148	3,4-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-149	3,5-ジ ^o クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-150	3,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-151	3,5-ジ ^o クロロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-152	3,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-153	3,5-ジ ^o フルオロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-154	3,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-155	3,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-156	3,5-ジ ^o フルオロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-157	3,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-158	3,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-159	3,6-ジ ^o クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-160	3,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-161	3,6-ジ ^o クロロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-162	3,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-163	3,6-ジ ^o フルオロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-164	3,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-165	3,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-166	3,6-ジ ^o フルオロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-167	3,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-168	3,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-169	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-170	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-171	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-172	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-173	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-174	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-175	3-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
XIIIa-176	3-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
XIIIa-177	3-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
XIIIa-178	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
XIIIa-179	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-180	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-181	3-(アリルオキシ)-4,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-182	3-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
XIIIa-183	3-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
XIIIa-184	3-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
XIIIa-185	3-(アリルオキシ)-5,6-ジクロロフェニル
XIIIa-186	3-(アリルオキシ)-5,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-187	3-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
XIIIa-188	3-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
XIIIa-189	3-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
XIIIa-190	3-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
XIIIa-191	3-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
XIIIa-192	3-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
XIIIa-193	3-(アリルオキシ)フェニル
XIIIa-194	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジクロロフェニル
XIIIa-195	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジフルオロフェニル
XIIIa-196	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジクロロフェニル
XIIIa-197	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジフルオロフェニル
XIIIa-198	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジクロロフェニル
XIIIa-199	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-200	3-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
XIIIa-201	3-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
XIIIa-202	3-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
XIIIa-203	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジクロロフェニル
XIIIa-204	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジフルオロフェニル
XIIIa-205	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジクロロフェニル
XIIIa-206	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-207	3-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
XIIIa-208	3-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
XIIIa-209	3-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
XIIIa-210	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジクロロフェニル
XIIIa-211	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-212	3-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
XIIIa-213	3-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
XIIIa-214	3-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
XIIIa-215	3-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
XIIIa-216	3-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル
XIIIa-217	3-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-218	3-(シアノメトキシ)フェニル
XIIIa-219	3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-220	3-クロロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-221	3-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-222	3-クロロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-223	3-クロロ-4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-224	3-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-225	3-クロロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-226	3-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-227	3-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-228	3-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-229	3-フルオロ-4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-230	3-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-231	3-フルオロ-4-ホルミルフェニル
XIIIa-232	3-ホルミル-2-メチルフェニル
XIIIa-233	3-ホルミル-4-メチルフェニル
XIIIa-234	3-ホルミル-5-メチルフェニル
XIIIa-235	3-ホルミル-6-メチルフェニル
XIIIa-236	3-ホルミルフェニル
XIIIa-237	3-メチル-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-238	3-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-239	3-メチル-4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-240	3-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-241	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,4-ジフルオロフェニル
XIIIa-242	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジフルオロフェニル
XIIIa-243	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-244	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XIIIa-245	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XIIIa-246	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XIIIa-247	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジフルオロフェニル
XIIIa-248	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-249	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XIIIa-250	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XIIIa-251	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XIIIa-252	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-253	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XIIIa-254	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-255	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XIIIa-256	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XIIIa-257	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XIIIa-258	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XIIIa-259	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
XIIIa-260	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-261	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-262	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-263	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XIIIa-264	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XIIIa-265	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XIIIa-266	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-267	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-268	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XIIIa-269	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XIIIa-270	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XIIIa-271	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XIIIa-272	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XIIIa-273	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XIIIa-274	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XIIIa-275	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XIIIa-276	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XIIIa-277	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XIIIa-278	3-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
XIIIa-279	3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-280	4,5-ジ ^o クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-281	4,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-282	4,5-ジ ^o クロロ-3-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-283	4,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-284	4,5-ジ ^o フルオロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-285	4,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-286	4,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-287	4,5-ジ ^o フルオロ-3-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-288	4,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-289	4,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-290	4,6-ジ ^o クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-291	4,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-292	4,6-ジ [°] クロロ-3-(フ [°] ロハ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-293	4,6-ジ [°] クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-294	4,6-ジ [°] フルオロ-2-(フ [°] ロハ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-295	4,6-ジ [°] フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-296	4,6-ジ [°] フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-297	4,6-ジ [°] フルオロ-3-(フ [°] ロハ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-298	4,6-ジ [°] フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-299	4,6-ジ [°] フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-300	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-301	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-302	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-303	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-304	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-305	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-306	4-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
XIIIa-307	4-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
XIIIa-308	4-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
XIIIa-309	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-310	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-311	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-312	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-313	4-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
XIIIa-314	4-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
XIIIa-315	4-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
XIIIa-316	4-(アリルオキシ)フェニル
XIIIa-317	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-318	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-319	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-320	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-321	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-322	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-323	4-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
XIIIa-324	4-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
XIIIa-325	4-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
XIIIa-326	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ [°] クロロフェニル
XIIIa-327	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-328	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ [°] クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-329	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-330	4-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
XIIIa-331	4-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
XIIIa-332	4-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
XIIIa-333	4-(シアノメトキシ)フェニル
XIIIa-334	4-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-335	4-クロロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-336	4-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-337	4-クロロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-338	4-クロロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-339	4-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-340	4-クロロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-341	4-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-342	4-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-343	4-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-344	4-フルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-345	4-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-346	4-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-347	4-ホルミル-2-メチルフェニル
XIIIa-348	4-ホルミル-3-メチルフェニル
XIIIa-349	4-ホルミルフェニル
XIIIa-350	4-メチル-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-351	4-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-352	4-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-353	4-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-354	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,3-ジフルオロフェニル
XIIIa-355	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジフルオロフェニル
XIIIa-356	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-357	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XIIIa-358	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XIIIa-359	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XIIIa-360	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジフルオロフェニル
XIIIa-361	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジフルオロフェニル
XIIIa-362	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XIIIa-363	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XIIIa-364	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XIIIa-365	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-366	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,3-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-367	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-368	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-369	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XIIIa-370	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XIIIa-371	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XIIIa-372	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-373	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ [°] フルオロフェニル
XIIIa-374	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XIIIa-375	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XIIIa-376	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XIIIa-377	4-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
XIIIa-378	4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-379	5,6-ジ [°] クロロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-380	5,6-ジ [°] クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-381	5,6-ジ [°] クロロ-3-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-382	5,6-ジ [°] クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-383	5,6-ジ [°] フルオロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-384	5,6-ジ [°] フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-385	5,6-ジ [°] フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-386	5,6-ジ [°] フルオロ-3-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-387	5,6-ジ [°] フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-388	5,6-ジ [°] フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-389	5-クロロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-390	5-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-391	5-クロロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-392	5-クロロ-3-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-393	5-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-394	5-クロロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-395	5-フルオロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-396	5-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-397	5-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-398	5-フルオロ-3-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-399	5-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-400	5-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-401	5-メチル-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-402	5-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XIIIa-403	5-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-404	5-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-405	6-クロロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-406	6-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-407	6-クロロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-408	6-クロロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-409	6-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-410	6-クロロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-411	6-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-412	6-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-413	6-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XIIIa-414	6-フルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-415	6-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-416	6-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XIIIa-417	6-メチル-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-418	6-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XIIIa-419	6-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XIIIa-420	6-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

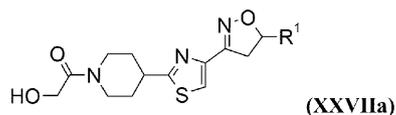
30

40

【 0 2 9 9 】

表 3 :

【表 3】



Ex.	R ¹
XXVIIa-1	2,3-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-2	2,3-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-3	2,3-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-4	2,3-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-5	2,3-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-6	2,4-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-7	2,4-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-8	2,4-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-9	2,4-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-10	2,4-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-11	2,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-12	2,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-13	2,5-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-14	2,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-15	2,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-16	2,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-17	2,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-18	2,5-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-19	2,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-20	2,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-21	2,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-22	2,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-23	2,6-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-24	2,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-25	2,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-26	2,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-27	2,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-28	2,6-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-29	2,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-30	2,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-31	2-(^o アリルオキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル

10

20

30

40

Ex.	R ¹
XXVIIa-32	2-(アリオキシ)-3,4-ジフルオロフェニル
XXVIIa-33	2-(アリオキシ)-3,5-ジクロロフェニル
XXVIIa-34	2-(アリオキシ)-3,5-ジフルオロフェニル
XXVIIa-35	2-(アリオキシ)-3,6-ジクロロフェニル
XXVIIa-36	2-(アリオキシ)-3,6-ジフルオロフェニル
XXVIIa-37	2-(アリオキシ)-3-クロロフェニル
XXVIIa-38	2-(アリオキシ)-3-フルオロフェニル
XXVIIa-39	2-(アリオキシ)-3-メチルフェニル
XXVIIa-40	2-(アリオキシ)-4,5-ジクロロフェニル
XXVIIa-41	2-(アリオキシ)-4,5-ジフルオロフェニル
XXVIIa-42	2-(アリオキシ)-4,6-ジクロロフェニル
XXVIIa-43	2-(アリオキシ)-4,6-ジフルオロフェニル
XXVIIa-44	2-(アリオキシ)-4-クロロフェニル
XXVIIa-45	2-(アリオキシ)-4-フルオロフェニル
XXVIIa-46	2-(アリオキシ)-4-メチルフェニル
XXVIIa-47	2-(アリオキシ)-5,6-ジクロロフェニル
XXVIIa-48	2-(アリオキシ)-5,6-ジフルオロフェニル
XXVIIa-49	2-(アリオキシ)-5-クロロフェニル
XXVIIa-50	2-(アリオキシ)-5-フルオロフェニル
XXVIIa-51	2-(アリオキシ)-5-メチルフェニル
XXVIIa-52	2-(アリオキシ)-6-クロロフェニル
XXVIIa-53	2-(アリオキシ)-6-フルオロフェニル
XXVIIa-54	2-(アリオキシ)-6-メチルフェニル
XXVIIa-55	2-(アリオキシ)フェニル
XXVIIa-56	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジクロロフェニル
XXVIIa-57	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジフルオロフェニル
XXVIIa-58	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジクロロフェニル
XXVIIa-59	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジフルオロフェニル
XXVIIa-60	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジクロロフェニル
XXVIIa-61	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジフルオロフェニル
XXVIIa-62	2-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
XXVIIa-63	2-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
XXVIIa-64	2-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
XXVIIa-65	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジクロロフェニル
XXVIIa-66	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジフルオロフェニル
XXVIIa-67	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジクロロフェニル
XXVIIa-68	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジフルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-69	2-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
XXVIIa-70	2-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
XXVIIa-71	2-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
XXVIIa-72	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
XXVIIa-73	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-74	2-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
XXVIIa-75	2-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
XXVIIa-76	2-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
XXVIIa-77	2-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
XXVIIa-78	2-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル
XXVIIa-79	2-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
XXVIIa-80	2-(シアノメトキシ)フェニル
XXVIIa-81	2-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-82	2-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェニル
XXVIIa-83	2-クロロ-3-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-84	2-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-85	2-クロロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-86	2-クロロ-4-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-87	2-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-88	2-クロロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-89	2-フルオロ-3-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-90	2-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-91	2-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-92	2-フルオロ-4-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-93	2-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-94	2-フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-95	2-ホルミル-3-メチルフェニル
XXVIIa-96	2-ホルミル-4-メチルフェニル
XXVIIa-97	2-ホルミル-5-メチルフェニル
XXVIIa-98	2-ホルミル-6-メチルフェニル
XXVIIa-99	2-ホルミルフェニル
XXVIIa-100	2-メチル-3-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-101	2-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-102	2-メチル-4-(ブ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-103	2-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-104	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-105	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-106	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-107	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XXVIIa-108	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XXVIIa-109	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XXVIIa-110	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-111	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-112	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XXVIIa-113	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XXVIIa-114	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XXVIIa-115	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-116	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XXVIIa-117	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XXVIIa-118	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XXVIIa-119	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XXVIIa-120	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XXVIIa-121	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XXVIIa-122	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
XXVIIa-123	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-124	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-125	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-126	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XXVIIa-127	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XXVIIa-128	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XXVIIa-129	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-130	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-131	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XXVIIa-132	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XXVIIa-133	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XXVIIa-134	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-135	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XXVIIa-136	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XXVIIa-137	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XXVIIa-138	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XXVIIa-139	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XXVIIa-140	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XXVIIa-141	2-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
XXVIIa-142	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-143	2-[(メチルスルホニル)オキシ]-4-(トリフルオロメチル)フェニル
XXVIIa-144	3,4-ジ [°] クロロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-145	3,4-ジ [°] クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-146	3,4-ジ [°] フルオロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-147	3,4-ジ [°] フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-148	3,4-ジ [°] フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-149	3,5-ジ [°] クロロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-150	3,5-ジ [°] クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-151	3,5-ジ [°] クロロ-4-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-152	3,5-ジ [°] クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-153	3,5-ジ [°] フルオロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-154	3,5-ジ [°] フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-155	3,5-ジ [°] フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-156	3,5-ジ [°] フルオロ-4-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-157	3,5-ジ [°] フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-158	3,5-ジ [°] フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-159	3,6-ジ [°] クロロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-160	3,6-ジ [°] クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-161	3,6-ジ [°] クロロ-4-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-162	3,6-ジ [°] クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-163	3,6-ジ [°] フルオロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-164	3,6-ジ [°] フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-165	3,6-ジ [°] フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-166	3,6-ジ [°] フルオロ-4-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-167	3,6-ジ [°] フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-168	3,6-ジ [°] フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-169	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-170	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-171	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-172	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-173	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-174	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-175	3-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
XXVIIa-176	3-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
XXVIIa-177	3-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
XXVIIa-178	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-179	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ [°] フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-180	3-(アリオキシ)-4,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-181	3-(アリオキシ)-4,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-182	3-(アリオキシ)-4-クロロフェニル
XXVIIa-183	3-(アリオキシ)-4-フルオロフェニル
XXVIIa-184	3-(アリオキシ)-4-メチルフェニル
XXVIIa-185	3-(アリオキシ)-5,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-186	3-(アリオキシ)-5,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-187	3-(アリオキシ)-5-クロロフェニル
XXVIIa-188	3-(アリオキシ)-5-フルオロフェニル
XXVIIa-189	3-(アリオキシ)-5-メチルフェニル
XXVIIa-190	3-(アリオキシ)-6-クロロフェニル
XXVIIa-191	3-(アリオキシ)-6-フルオロフェニル
XXVIIa-192	3-(アリオキシ)-6-メチルフェニル
XXVIIa-193	3-(アリオキシ)フェニル
XXVIIa-194	3-(シアノトキシ)-2,4-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-195	3-(シアノトキシ)-2,4-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-196	3-(シアノトキシ)-2,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-197	3-(シアノトキシ)-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-198	3-(シアノトキシ)-2,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-199	3-(シアノトキシ)-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-200	3-(シアノトキシ)-2-クロロフェニル
XXVIIa-201	3-(シアノトキシ)-2-フルオロフェニル
XXVIIa-202	3-(シアノトキシ)-2-メチルフェニル
XXVIIa-203	3-(シアノトキシ)-4,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-204	3-(シアノトキシ)-4,5-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-205	3-(シアノトキシ)-4,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-206	3-(シアノトキシ)-4,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-207	3-(シアノトキシ)-4-クロロフェニル
XXVIIa-208	3-(シアノトキシ)-4-フルオロフェニル
XXVIIa-209	3-(シアノトキシ)-4-メチルフェニル
XXVIIa-210	3-(シアノトキシ)-5,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-211	3-(シアノトキシ)-5,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-212	3-(シアノトキシ)-5-クロロフェニル
XXVIIa-213	3-(シアノトキシ)-5-フルオロフェニル
XXVIIa-214	3-(シアノトキシ)-5-メチルフェニル
XXVIIa-215	3-(シアノトキシ)-6-クロロフェニル
XXVIIa-216	3-(シアノトキシ)-6-フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-217	3-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
XXVIIa-218	3-(シアノメトキシ)フェニル
XXVIIa-219	3-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-220	3-クロロ-2-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-221	3-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-222	3-クロロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-223	3-クロロ-4-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-224	3-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-225	3-クロロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-226	3-フルオロ-2-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-227	3-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-228	3-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-229	3-フルオロ-4-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-230	3-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-231	3-フルオロ-4-ホルミルフェニル
XXVIIa-232	3-ホルミル-2-メチルフェニル
XXVIIa-233	3-ホルミル-4-メチルフェニル
XXVIIa-234	3-ホルミル-5-メチルフェニル
XXVIIa-235	3-ホルミル-6-メチルフェニル
XXVIIa-236	3-ホルミルフェニル
XXVIIa-237	3-メチル-2-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-238	3-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-239	3-メチル-4-(プロパノ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-240	3-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-241	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-242	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-243	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-244	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XXVIIa-245	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XXVIIa-246	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XXVIIa-247	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-248	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-249	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XXVIIa-250	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XXVIIa-251	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XXVIIa-252	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-253	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-254	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XXVIIa-255	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XXVIIa-256	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XXVIIa-257	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XXVIIa-258	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XXVIIa-259	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
XXVIIa-260	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-261	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-262	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-263	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XXVIIa-264	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XXVIIa-265	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XXVIIa-266	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-267	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-268	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
XXVIIa-269	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
XXVIIa-270	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
XXVIIa-271	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-272	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
XXVIIa-273	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
XXVIIa-274	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
XXVIIa-275	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
XXVIIa-276	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
XXVIIa-277	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
XXVIIa-278	3-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
XXVIIa-279	3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-280	4,5-ジ ^o クロロ-2-(^o ロバ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-281	4,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-282	4,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロバ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-283	4,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-284	4,5-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロバ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-285	4,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-286	4,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-287	4,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロバ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-288	4,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-289	4,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-290	4,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロバ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-291	4,6-ジ [°] クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-292	4,6-ジ [°] クロロ-3-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-293	4,6-ジ [°] クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-294	4,6-ジ [°] フルオロ-2-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-295	4,6-ジ [°] フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-296	4,6-ジ [°] フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-297	4,6-ジ [°] フルオロ-3-(プロパ [°] -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-298	4,6-ジ [°] フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-299	4,6-ジ [°] フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-300	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-301	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-302	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-303	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-304	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-305	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-306	4-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
XXVIIa-307	4-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
XXVIIa-308	4-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
XXVIIa-309	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-310	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-311	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-312	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-313	4-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
XXVIIa-314	4-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
XXVIIa-315	4-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
XXVIIa-316	4-(アリルオキシ)フェニル
XXVIIa-317	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-318	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-319	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-320	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-321	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-322	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ [°] フルオロフェニル
XXVIIa-323	4-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
XXVIIa-324	4-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
XXVIIa-325	4-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
XXVIIa-326	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ [°] クロロフェニル
XXVIIa-327	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ [°] フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-328	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
XXVIIa-329	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-330	4-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
XXVIIa-331	4-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
XXVIIa-332	4-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
XXVIIa-333	4-(シアノメトキシ)フェニル
XXVIIa-334	4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-335	4-クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-336	4-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-337	4-クロロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-338	4-クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-339	4-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-340	4-クロロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-341	4-フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-342	4-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-343	4-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-344	4-フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-345	4-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-346	4-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-347	4-ホルミル-2-メチルフェニル
XXVIIa-348	4-ホルミル-3-メチルフェニル
XXVIIa-349	4-ホルミルフェニル
XXVIIa-350	4-メチル-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-351	4-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-352	4-メチル-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-353	4-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-354	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-355	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-356	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-357	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XXVIIa-358	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XXVIIa-359	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XXVIIa-360	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-361	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-362	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XXVIIa-363	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XXVIIa-364	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-365	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
XXVIIa-366	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-367	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-368	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-369	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
XXVIIa-370	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
XXVIIa-371	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
XXVIIa-372	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-373	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
XXVIIa-374	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
XXVIIa-375	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
XXVIIa-376	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
XXVIIa-377	4-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
XXVIIa-378	4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-379	5,6-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-380	5,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-381	5,6-ジ ^o クロロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-382	5,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-383	5,6-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-384	5,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-385	5,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-386	5,6-ジ ^o フルオロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-387	5,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-388	5,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-389	5-クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-390	5-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-391	5-クロロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-392	5-クロロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-393	5-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-394	5-クロロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-395	5-フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-396	5-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-397	5-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-398	5-フルオロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-399	5-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-400	5-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-401	5-メチル-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
XXVIIa-402	5-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-403	5-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-404	5-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-405	6-クロロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-406	6-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-407	6-クロロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-408	6-クロロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-409	6-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-410	6-クロロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-411	6-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-412	6-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-413	6-フルオロ-2-ホルミルフェニル
XXVIIa-414	6-フルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-415	6-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-416	6-フルオロ-3-ホルミルフェニル
XXVIIa-417	6-メチル-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-418	6-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
XXVIIa-419	6-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
XXVIIa-420	6-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

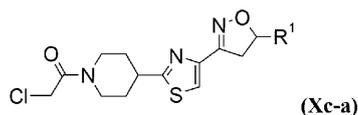
30

40

【 0 3 0 0 】

表 4 :

【表 4】



Ex.	R ¹
Xc-a-1	2,3-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-2	2,3-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-3	2,3-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-4	2,3-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-5	2,3-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-6	2,4-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-7	2,4-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-8	2,4-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-9	2,4-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-10	2,4-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-11	2,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-12	2,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-13	2,5-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-14	2,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-15	2,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-16	2,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-17	2,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-18	2,5-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-19	2,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-20	2,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-21	2,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-22	2,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-23	2,6-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-24	2,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-25	2,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-26	2,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-27	2,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-28	2,6-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-29	2,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-30	2,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-31	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル

10

20

30

40

Ex.	R ¹
Xc-a-32	2-(アリオキシ)-3,4-ジフルオロフェニル
Xc-a-33	2-(アリオキシ)-3,5-ジクロロフェニル
Xc-a-34	2-(アリオキシ)-3,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-35	2-(アリオキシ)-3,6-ジクロロフェニル
Xc-a-36	2-(アリオキシ)-3,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-37	2-(アリオキシ)-3-クロロフェニル
Xc-a-38	2-(アリオキシ)-3-フルオロフェニル
Xc-a-39	2-(アリオキシ)-3-メチルフェニル
Xc-a-40	2-(アリオキシ)-4,5-ジクロロフェニル
Xc-a-41	2-(アリオキシ)-4,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-42	2-(アリオキシ)-4,6-ジクロロフェニル
Xc-a-43	2-(アリオキシ)-4,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-44	2-(アリオキシ)-4-クロロフェニル
Xc-a-45	2-(アリオキシ)-4-フルオロフェニル
Xc-a-46	2-(アリオキシ)-4-メチルフェニル
Xc-a-47	2-(アリオキシ)-5,6-ジクロロフェニル
Xc-a-48	2-(アリオキシ)-5,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-49	2-(アリオキシ)-5-クロロフェニル
Xc-a-50	2-(アリオキシ)-5-フルオロフェニル
Xc-a-51	2-(アリオキシ)-5-メチルフェニル
Xc-a-52	2-(アリオキシ)-6-クロロフェニル
Xc-a-53	2-(アリオキシ)-6-フルオロフェニル
Xc-a-54	2-(アリオキシ)-6-メチルフェニル
Xc-a-55	2-(アリオキシ)フェニル
Xc-a-56	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジクロロフェニル
Xc-a-57	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジフルオロフェニル
Xc-a-58	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジクロロフェニル
Xc-a-59	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-60	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジクロロフェニル
Xc-a-61	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-62	2-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
Xc-a-63	2-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
Xc-a-64	2-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
Xc-a-65	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジクロロフェニル
Xc-a-66	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-67	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジクロロフェニル
Xc-a-68	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジフルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-69	2-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
Xc-a-70	2-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
Xc-a-71	2-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
Xc-a-72	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-73	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-74	2-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
Xc-a-75	2-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
Xc-a-76	2-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
Xc-a-77	2-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
Xc-a-78	2-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル
Xc-a-79	2-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
Xc-a-80	2-(シアノメトキシ)フェニル
Xc-a-81	2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-82	2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェニル
Xc-a-83	2-クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-84	2-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-85	2-クロロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-86	2-クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-87	2-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-88	2-クロロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-89	2-フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-90	2-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-91	2-フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-92	2-フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-93	2-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-94	2-フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-95	2-ホルミル-3-メチルフェニル
Xc-a-96	2-ホルミル-4-メチルフェニル
Xc-a-97	2-ホルミル-5-メチルフェニル
Xc-a-98	2-ホルミル-6-メチルフェニル
Xc-a-99	2-ホルミルフェニル
Xc-a-100	2-メチル-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-101	2-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-102	2-メチル-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-103	2-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-104	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-105	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-106	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-107	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
Xc-a-108	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
Xc-a-109	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
Xc-a-110	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-111	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-112	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
Xc-a-113	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
Xc-a-114	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
Xc-a-115	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-116	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
Xc-a-117	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
Xc-a-118	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
Xc-a-119	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
Xc-a-120	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
Xc-a-121	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
Xc-a-122	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
Xc-a-123	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-124	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-125	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-126	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
Xc-a-127	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
Xc-a-128	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
Xc-a-129	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-130	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-131	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
Xc-a-132	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
Xc-a-133	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
Xc-a-134	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-135	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
Xc-a-136	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
Xc-a-137	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
Xc-a-138	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
Xc-a-139	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
Xc-a-140	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
Xc-a-141	2-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
Xc-a-142	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-143	2-[(メチルスルホニル)オキシ]-4-(トリフルオロメチル)フェニル
Xc-a-144	3,4-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-145	3,4-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-146	3,4-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-147	3,4-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-148	3,4-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-149	3,5-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-150	3,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-151	3,5-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-152	3,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-153	3,5-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-154	3,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-155	3,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-156	3,5-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-157	3,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-158	3,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-159	3,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-160	3,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-161	3,6-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-162	3,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-163	3,6-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-164	3,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-165	3,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-166	3,6-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-167	3,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-168	3,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-169	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-170	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-171	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-172	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-173	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-174	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-175	3-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
Xc-a-176	3-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
Xc-a-177	3-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
Xc-a-178	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-179	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-180	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-181	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-182	3-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
Xc-a-183	3-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
Xc-a-184	3-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
Xc-a-185	3-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-186	3-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-187	3-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
Xc-a-188	3-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
Xc-a-189	3-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
Xc-a-190	3-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
Xc-a-191	3-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
Xc-a-192	3-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
Xc-a-193	3-(アリルオキシ)フェニル
Xc-a-194	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-195	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-196	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-197	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-198	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-199	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-200	3-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
Xc-a-201	3-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
Xc-a-202	3-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
Xc-a-203	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-204	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-205	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-206	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-207	3-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
Xc-a-208	3-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
Xc-a-209	3-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
Xc-a-210	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-211	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-212	3-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
Xc-a-213	3-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
Xc-a-214	3-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
Xc-a-215	3-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
Xc-a-216	3-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-217	3-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
Xc-a-218	3-(シアノメトキシ)フェニル
Xc-a-219	3-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-220	3-クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-221	3-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-222	3-クロロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-223	3-クロロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-224	3-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-225	3-クロロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-226	3-フルオロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-227	3-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-228	3-フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-229	3-フルオロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-230	3-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-231	3-フルオロ-4-ホルミルフェニル
Xc-a-232	3-ホルミル-2-メチルフェニル
Xc-a-233	3-ホルミル-4-メチルフェニル
Xc-a-234	3-ホルミル-5-メチルフェニル
Xc-a-235	3-ホルミル-6-メチルフェニル
Xc-a-236	3-ホルミルフェニル
Xc-a-237	3-メチル-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-238	3-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-239	3-メチル-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-240	3-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-241	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-242	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-243	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-244	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
Xc-a-245	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
Xc-a-246	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
Xc-a-247	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-248	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-249	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
Xc-a-250	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
Xc-a-251	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
Xc-a-252	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-253	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-254	3-[(ヒト ⁺ ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
Xc-a-255	3-[(ヒト ⁺ ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
Xc-a-256	3-[(ヒト ⁺ ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
Xc-a-257	3-[(ヒト ⁺ ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
Xc-a-258	3-[(ヒト ⁺ ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
Xc-a-259	3-[(ヒト ⁺ ロキシイミノ)メチル]フェニル
Xc-a-260	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ⁺ フルオロフェニル
Xc-a-261	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ⁺ フルオロフェニル
Xc-a-262	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ⁺ フルオロフェニル
Xc-a-263	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
Xc-a-264	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
Xc-a-265	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
Xc-a-266	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ⁺ フルオロフェニル
Xc-a-267	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ⁺ フルオロフェニル
Xc-a-268	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
Xc-a-269	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
Xc-a-270	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
Xc-a-271	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ⁺ フルオロフェニル
Xc-a-272	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
Xc-a-273	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
Xc-a-274	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
Xc-a-275	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
Xc-a-276	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
Xc-a-277	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
Xc-a-278	3-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
Xc-a-279	3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-280	4,5-ジ ⁺ クロロ-2-(プロパ ⁺ -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-281	4,5-ジ ⁺ クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-282	4,5-ジ ⁺ クロロ-3-(プロパ ⁺ -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-283	4,5-ジ ⁺ クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-284	4,5-ジ ⁺ フルオロ-2-(プロパ ⁺ -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-285	4,5-ジ ⁺ フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-286	4,5-ジ ⁺ フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-287	4,5-ジ ⁺ フルオロ-3-(プロパ ⁺ -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-288	4,5-ジ ⁺ フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-289	4,5-ジ ⁺ フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-290	4,6-ジ ⁺ クロロ-2-(プロパ ⁺ -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-291	4,6-ジクロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-292	4,6-ジクロロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-293	4,6-ジクロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-294	4,6-ジフルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-295	4,6-ジフルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-296	4,6-ジフルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-297	4,6-ジフルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-298	4,6-ジフルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-299	4,6-ジフルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-300	4-(アリルオキシ)-2,3-ジクロロフェニル
Xc-a-301	4-(アリルオキシ)-2,3-ジフルオロフェニル
Xc-a-302	4-(アリルオキシ)-2,5-ジクロロフェニル
Xc-a-303	4-(アリルオキシ)-2,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-304	4-(アリルオキシ)-2,6-ジクロロフェニル
Xc-a-305	4-(アリルオキシ)-2,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-306	4-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
Xc-a-307	4-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
Xc-a-308	4-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
Xc-a-309	4-(アリルオキシ)-3,5-ジクロロフェニル
Xc-a-310	4-(アリルオキシ)-3,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-311	4-(アリルオキシ)-3,6-ジクロロフェニル
Xc-a-312	4-(アリルオキシ)-3,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-313	4-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
Xc-a-314	4-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
Xc-a-315	4-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
Xc-a-316	4-(アリルオキシ)フェニル
Xc-a-317	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジクロロフェニル
Xc-a-318	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジフルオロフェニル
Xc-a-319	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジクロロフェニル
Xc-a-320	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジフルオロフェニル
Xc-a-321	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジクロロフェニル
Xc-a-322	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジフルオロフェニル
Xc-a-323	4-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
Xc-a-324	4-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
Xc-a-325	4-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
Xc-a-326	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジクロロフェニル
Xc-a-327	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジフルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-328	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
Xc-a-329	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-330	4-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
Xc-a-331	4-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
Xc-a-332	4-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
Xc-a-333	4-(シアノメトキシ)フェニル
Xc-a-334	4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-335	4-クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-336	4-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-337	4-クロロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-338	4-クロロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-339	4-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-340	4-クロロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-341	4-フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-342	4-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-343	4-フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-344	4-フルオロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-345	4-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-346	4-フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-347	4-ホルミル-2-メチルフェニル
Xc-a-348	4-ホルミル-3-メチルフェニル
Xc-a-349	4-ホルミルフェニル
Xc-a-350	4-メチル-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-351	4-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-352	4-メチル-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-353	4-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-354	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-355	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-356	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-357	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
Xc-a-358	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
Xc-a-359	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
Xc-a-360	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-361	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-362	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
Xc-a-363	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
Xc-a-364	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-365	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
Xc-a-366	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-367	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-368	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-369	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
Xc-a-370	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
Xc-a-371	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
Xc-a-372	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-373	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
Xc-a-374	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
Xc-a-375	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
Xc-a-376	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
Xc-a-377	4-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
Xc-a-378	4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-379	5,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-380	5,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-381	5,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-382	5,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-383	5,6-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-384	5,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-385	5,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-386	5,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-387	5,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-388	5,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-389	5-クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-390	5-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-391	5-クロロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-392	5-クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-393	5-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-394	5-クロロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-395	5-フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-396	5-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-397	5-フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-398	5-フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-399	5-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-400	5-フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-401	5-メチル-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
Xc-a-402	5-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-403	5-メチル-3-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-404	5-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-405	6-クロロ-2-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-406	6-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-407	6-クロロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-408	6-クロロ-3-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-409	6-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-410	6-クロロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-411	6-フルオロ-2-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-412	6-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-413	6-フルオロ-2-ホルミルフェニル
Xc-a-414	6-フルオロ-3-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-415	6-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-416	6-フルオロ-3-ホルミルフェニル
Xc-a-417	6-メチル-2-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-418	6-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
Xc-a-419	6-メチル-3-(7 ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
Xc-a-420	6-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

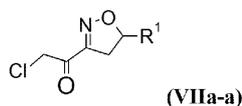
30

40

【 0 3 0 1 】

表 5 :

【表 5】



Ex.	R ¹
VIIa-a-1	2,3-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-2	2,3-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-3	2,3-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-4	2,3-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-5	2,3-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-6	2,4-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-7	2,4-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-8	2,4-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-9	2,4-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-10	2,4-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-11	2,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-12	2,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-13	2,5-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-14	2,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-15	2,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-16	2,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-17	2,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-18	2,5-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-19	2,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-20	2,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-21	2,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-22	2,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-23	2,6-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-24	2,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-25	2,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-26	2,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-27	2,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-28	2,6-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-29	2,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-30	2,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-31	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル

10

20

30

40

Ex.	R ¹
VIIa-a-32	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-33	2-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-34	2-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-35	2-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-36	2-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-37	2-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
VIIa-a-38	2-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
VIIa-a-39	2-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
VIIa-a-40	2-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-41	2-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-42	2-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-43	2-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-44	2-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
VIIa-a-45	2-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
VIIa-a-46	2-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
VIIa-a-47	2-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-48	2-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-49	2-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
VIIa-a-50	2-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
VIIa-a-51	2-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
VIIa-a-52	2-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
VIIa-a-53	2-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
VIIa-a-54	2-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
VIIa-a-55	2-(アリルオキシ)フェニル
VIIa-a-56	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-57	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-58	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-59	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-60	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-61	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-62	2-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
VIIa-a-63	2-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
VIIa-a-64	2-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
VIIa-a-65	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-66	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-67	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-68	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-69	2-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
VIIa-a-70	2-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
VIIa-a-71	2-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
VIIa-a-72	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-73	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-74	2-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
VIIa-a-75	2-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
VIIa-a-76	2-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
VIIa-a-77	2-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
VIIa-a-78	2-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル
VIIa-a-79	2-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
VIIa-a-80	2-(シアノメトキシ)フェニル
VIIa-a-81	2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-82	2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェニル
VIIa-a-83	2-クロロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-84	2-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-85	2-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-86	2-クロロ-4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-87	2-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-88	2-クロロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-89	2-フルオロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-90	2-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-91	2-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-92	2-フルオロ-4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-93	2-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-94	2-フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-95	2-ホルミル-3-メチルフェニル
VIIa-a-96	2-ホルミル-4-メチルフェニル
VIIa-a-97	2-ホルミル-5-メチルフェニル
VIIa-a-98	2-ホルミル-6-メチルフェニル
VIIa-a-99	2-ホルミルフェニル
VIIa-a-100	2-メチル-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-101	2-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-102	2-メチル-4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-103	2-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-104	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-105	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-106	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-107	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIa-a-08	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIa-a-109	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
VIIa-a-110	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-111	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-112	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIa-a-113	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIa-a-114	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIa-a-115	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-116	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
VIIa-a-117	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIa-a-118	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIa-a-119	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIa-a-120	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIa-a-121	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIa-a-122	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
VIIa-a-123	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-124	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-125	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-126	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIa-a-127	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIa-a-128	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
VIIa-a-129	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-130	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-131	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIa-a-132	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIa-a-133	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIa-a-134	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-135	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
VIIa-a-136	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIa-a-137	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIa-a-138	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIa-a-139	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIa-a-140	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIa-a-141	2-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
VIIa-a-142	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-143	2-[(メチルスルホニル)オキシ]-4-(トリフルオロメチル)フェニル
VIIa-a-144	3,4-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-145	3,4-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-146	3,4-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-147	3,4-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-148	3,4-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-149	3,5-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-150	3,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-151	3,5-ジ ^o クロロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-152	3,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-153	3,5-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-154	3,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-155	3,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-156	3,5-ジ ^o フルオロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-157	3,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-158	3,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-159	3,6-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-160	3,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-161	3,6-ジ ^o クロロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-162	3,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-163	3,6-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-164	3,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-165	3,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-166	3,6-ジ ^o フルオロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-167	3,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-168	3,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-169	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-170	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-171	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-172	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-173	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-174	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-175	3-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
VIIa-a-176	3-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
VIIa-a-177	3-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
VIIa-a-178	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-179	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-180	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-181	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-182	3-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
VIIa-a-183	3-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
VIIa-a-184	3-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
VIIa-a-185	3-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-186	3-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-187	3-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
VIIa-a-188	3-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
VIIa-a-189	3-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
VIIa-a-190	3-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
VIIa-a-191	3-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
VIIa-a-192	3-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
VIIa-a-193	3-(アリルオキシ)フェニル
VIIa-a-194	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-195	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-196	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-197	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-198	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-199	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-200	3-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
VIIa-a-201	3-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
VIIa-a-202	3-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
VIIa-a-203	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-204	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-205	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-206	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-207	3-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
VIIa-a-208	3-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
VIIa-a-209	3-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
VIIa-a-210	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-211	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-212	3-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
VIIa-a-213	3-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
VIIa-a-214	3-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
VIIa-a-215	3-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
VIIa-a-216	3-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-217	3-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
VIIa-a-218	3-(シアノメトキシ)フェニル
VIIa-a-219	3-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-220	3-クロロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-221	3-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-222	3-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-223	3-クロロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-224	3-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-225	3-クロロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-226	3-フルオロ-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-227	3-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-228	3-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-229	3-フルオロ-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-230	3-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-231	3-フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIa-a-232	3-ホルミル-2-メチルフェニル
VIIa-a-233	3-ホルミル-4-メチルフェニル
VIIa-a-234	3-ホルミル-5-メチルフェニル
VIIa-a-235	3-ホルミル-6-メチルフェニル
VIIa-a-236	3-ホルミルフェニル
VIIa-a-237	3-メチル-2-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-238	3-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-239	3-メチル-4-(フ ^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-240	3-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-241	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-242	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-243	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-244	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIa-a-245	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIa-a-246	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIa-a-247	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-248	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-249	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIa-a-250	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIa-a-251	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIa-a-252	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-253	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-254	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIa-a-255	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIa-a-256	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIa-a-257	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIa-a-258	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIa-a-259	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
VIIa-a-260	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-261	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-262	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-263	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIa-a-264	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIa-a-265	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIa-a-266	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-267	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-268	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIa-a-269	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIa-a-270	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIa-a-271	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-272	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
VIIa-a-273	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIa-a-274	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIa-a-275	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIa-a-276	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIa-a-277	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIa-a-278	3-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
VIIa-a-279	3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-280	4,5-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-281	4,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-282	4,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-283	4,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-284	4,5-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-285	4,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-286	4,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-287	4,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-288	4,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-289	4,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-290	4,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-291	4,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-292	4,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-293	4,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-294	4,6-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-295	4,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-296	4,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-297	4,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-298	4,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-299	4,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-300	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-301	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-302	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-303	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-304	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-305	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-306	4-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
VIIa-a-307	4-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
VIIa-a-308	4-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
VIIa-a-309	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-310	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-311	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-312	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-313	4-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
VIIa-a-314	4-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
VIIa-a-315	4-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
VIIa-a-316	4-(アリルオキシ)フェニル
VIIa-a-317	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-318	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-319	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-320	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-321	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-322	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-323	4-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
VIIa-a-324	4-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
VIIa-a-325	4-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
VIIa-a-326	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-327	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-328	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIa-a-329	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^p フルオロフェニル
VIIa-a-330	4-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
VIIa-a-331	4-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
VIIa-a-332	4-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
VIIa-a-333	4-(シアノメトキシ)フェニル
VIIa-a-334	4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-335	4-クロロ-2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-336	4-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-337	4-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-338	4-クロロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-339	4-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-340	4-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-341	4-フルオロ-2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-342	4-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-343	4-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-344	4-フルオロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-345	4-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-346	4-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-347	4-ホルミル-2-メチルフェニル
VIIa-a-348	4-ホルミル-3-メチルフェニル
VIIa-a-349	4-ホルミルフェニル
VIIa-a-350	4-メチル-2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-351	4-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-352	4-メチル-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-353	4-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-354	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-355	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-356	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-357	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIa-a-358	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIa-a-359	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIa-a-360	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-361	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-362	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIa-a-363	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIa-a-364	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIa-a-365	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
VIIa-a-366	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-367	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-368	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-369	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIa-a-370	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIa-a-371	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIa-a-372	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-373	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIa-a-374	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIa-a-375	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIa-a-376	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
VIIa-a-377	4-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
VIIa-a-378	4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-379	5,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-380	5,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-381	5,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-382	5,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-383	5,6-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-384	5,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-385	5,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-386	5,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-387	5,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-388	5,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-389	5-クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-390	5-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-391	5-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-392	5-クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-393	5-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-394	5-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-395	5-フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-396	5-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-397	5-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIa-a-398	5-フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIa-a-399	5-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIa-a-400	5-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIa-a-401	5-メチル-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-402	5-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-403	5-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-404	5-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-405	6-クロロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-406	6-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-407	6-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-408	6-クロロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-409	6-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-410	6-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-411	6-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-412	6-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-413	6-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-414	6-フルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-415	6-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-416	6-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-417	6-メチル-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-418	6-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-419	6-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-420	6-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

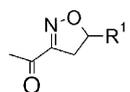
30

40

【 0 3 0 2 】

表 6 :

【表 6】



(VIIIa-a)

Ex.	R ¹
VIIIa-a-1	2,3-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-2	2,3-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-3	2,3-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-4	2,3-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-5	2,3-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-6	2,4-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-7	2,4-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-8	2,4-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-9	2,4-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-10	2,4-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-11	2,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-12	2,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-13	2,5-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-14	2,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-15	2,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-16	2,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-17	2,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-18	2,5-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-19	2,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-20	2,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-21	2,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-22	2,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-23	2,6-ジ ^o クロロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-24	2,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-25	2,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-26	2,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-27	2,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-28	2,6-ジ ^o フルオロ-4-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-29	2,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-30	2,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-31	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル

10

20

30

40

Ex.	R ¹
VIIIa-a-32	2-(アリルオキシ)-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-33	2-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-34	2-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-35	2-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-36	2-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-37	2-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
VIIIa-a-38	2-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-39	2-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
VIIIa-a-40	2-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-41	2-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-42	2-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-43	2-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-44	2-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
VIIIa-a-45	2-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-46	2-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
VIIIa-a-47	2-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-48	2-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-49	2-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
VIIIa-a-50	2-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-51	2-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
VIIIa-a-52	2-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
VIIIa-a-53	2-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-54	2-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
VIIIa-a-55	2-(アリルオキシ)フェニル
VIIIa-a-56	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-57	2-(シアノメトキシ)-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-58	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-59	2-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-60	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-61	2-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-62	2-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
VIIIa-a-63	2-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-64	2-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
VIIIa-a-65	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-66	2-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-67	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-68	2-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-69	2-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
VIIIa-a-70	2-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-71	2-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
VIIIa-a-72	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-73	2-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-74	2-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
VIIIa-a-75	2-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-76	2-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
VIIIa-a-77	2-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
VIIIa-a-78	2-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-79	2-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
VIIIa-a-80	2-(シアノメトキシ)フェニル
VIIIa-a-81	2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-82	2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)-4-(トリフルオロメチル)フェニル
VIIIa-a-83	2-クロロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-84	2-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-85	2-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-86	2-クロロ-4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-87	2-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-88	2-クロロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-89	2-フルオロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-90	2-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-91	2-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-92	2-フルオロ-4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-93	2-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-94	2-フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-95	2-ホルミル-3-メチルフェニル
VIIIa-a-96	2-ホルミル-4-メチルフェニル
VIIIa-a-97	2-ホルミル-5-メチルフェニル
VIIIa-a-98	2-ホルミル-6-メチルフェニル
VIIIa-a-99	2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-100	2-メチル-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-101	2-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-102	2-メチル-4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-103	2-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-104	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-105	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-106	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-107	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIIa-a-108	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-109	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
VIIIa-a-110	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-111	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-112	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIIa-a-113	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-114	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIIa-a-115	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-116	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
VIIIa-a-117	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-118	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIIa-a-119	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIIa-a-120	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-121	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIIa-a-122	2-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
VIIIa-a-123	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-124	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-125	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-126	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIIa-a-127	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-128	2-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
VIIIa-a-129	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-130	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-131	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIIa-a-132	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-133	2-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIIa-a-134	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-135	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
VIIIa-a-136	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-137	2-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIIa-a-138	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIIa-a-139	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-140	2-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIIa-a-141	2-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
VIIIa-a-142	2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-143	2-[(メチルスルホニル)オキシ]-4-(トリフルオロメチル)フェニル
VIIIa-a-144	3,4-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-145	3,4-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-146	3,4-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-147	3,4-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-148	3,4-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-149	3,5-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-150	3,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-151	3,5-ジ ^o クロロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-152	3,5-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-153	3,5-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-154	3,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-155	3,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-156	3,5-ジ ^o フルオロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-157	3,5-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-158	3,5-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-159	3,6-ジ ^o クロロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-160	3,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-161	3,6-ジ ^o クロロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-162	3,6-ジ ^o クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-163	3,6-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-164	3,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-165	3,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-166	3,6-ジ ^o フルオロ-4-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-167	3,6-ジ ^o フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-168	3,6-ジ ^o フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-169	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-170	3-(アリルオキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-171	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-172	3-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-173	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-174	3-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-175	3-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
VIIIa-a-176	3-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-177	3-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
VIIIa-a-178	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-179	3-(アリルオキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-180	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-181	3-(アリルオキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-182	3-(アリルオキシ)-4-クロロフェニル
VIIIa-a-183	3-(アリルオキシ)-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-184	3-(アリルオキシ)-4-メチルフェニル
VIIIa-a-185	3-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-186	3-(アリルオキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-187	3-(アリルオキシ)-5-クロロフェニル
VIIIa-a-188	3-(アリルオキシ)-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-189	3-(アリルオキシ)-5-メチルフェニル
VIIIa-a-190	3-(アリルオキシ)-6-クロロフェニル
VIIIa-a-191	3-(アリルオキシ)-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-192	3-(アリルオキシ)-6-メチルフェニル
VIIIa-a-193	3-(アリルオキシ)フェニル
VIIIa-a-194	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-195	3-(シアノメトキシ)-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-196	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-197	3-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-198	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-199	3-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-200	3-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
VIIIa-a-201	3-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-202	3-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
VIIIa-a-203	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-204	3-(シアノメトキシ)-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-205	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-206	3-(シアノメトキシ)-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-207	3-(シアノメトキシ)-4-クロロフェニル
VIIIa-a-208	3-(シアノメトキシ)-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-209	3-(シアノメトキシ)-4-メチルフェニル
VIIIa-a-210	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-211	3-(シアノメトキシ)-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-212	3-(シアノメトキシ)-5-クロロフェニル
VIIIa-a-213	3-(シアノメトキシ)-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-214	3-(シアノメトキシ)-5-メチルフェニル
VIIIa-a-215	3-(シアノメトキシ)-6-クロロフェニル
VIIIa-a-216	3-(シアノメトキシ)-6-フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-217	3-(シアノメトキシ)-6-メチルフェニル
VIIIa-a-218	3-(シアノメトキシ)フェニル
VIIIa-a-219	3-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-220	3-クロロ-2-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-221	3-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-222	3-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-223	3-クロロ-4-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-224	3-クロロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-225	3-クロロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-226	3-フルオロ-2-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-227	3-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-228	3-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-229	3-フルオロ-4-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-230	3-フルオロ-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-231	3-フルオロ-4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-232	3-ホルミル-2-メチルフェニル
VIIIa-a-233	3-ホルミル-4-メチルフェニル
VIIIa-a-234	3-ホルミル-5-メチルフェニル
VIIIa-a-235	3-ホルミル-6-メチルフェニル
VIIIa-a-236	3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-237	3-メチル-2-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-238	3-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-239	3-メチル-4-(プロパノ-2-イル-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-240	3-メチル-4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-241	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,4-ジフルオロフェニル
VIIIa-a-242	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジフルオロフェニル
VIIIa-a-243	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジフルオロフェニル
VIIIa-a-244	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIIa-a-245	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-246	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIIa-a-247	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,5-ジフルオロフェニル
VIIIa-a-248	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4,6-ジフルオロフェニル
VIIIa-a-249	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIIa-a-250	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-251	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIIa-a-252	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5,6-ジフルオロフェニル
VIIIa-a-253	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-254	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-255	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIIa-a-256	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIIa-a-257	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-258	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIIa-a-259	3-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
VIIIa-a-260	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,4-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-261	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-262	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-263	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIIa-a-264	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-265	3-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIIa-a-266	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-267	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-268	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-クロロフェニル
VIIIa-a-269	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-フルオロフェニル
VIIIa-a-270	3-[(メトキシイミノ)メチル]-4-メチルフェニル
VIIIa-a-271	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-272	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-クロロフェニル
VIIIa-a-273	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-フルオロフェニル
VIIIa-a-274	3-[(メトキシイミノ)メチル]-5-メチルフェニル
VIIIa-a-275	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-クロロフェニル
VIIIa-a-276	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-フルオロフェニル
VIIIa-a-277	3-[(メトキシイミノ)メチル]-6-メチルフェニル
VIIIa-a-278	3-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
VIIIa-a-279	3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-280	4,5-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-281	4,5-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-282	4,5-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-283	4,5-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-284	4,5-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-285	4,5-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-286	4,5-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-287	4,5-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-288	4,5-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-289	4,5-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-290	4,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-291	4,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-292	4,6-ジ ^o クロロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-293	4,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-294	4,6-ジ ^o フルオロ-2-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-295	4,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-296	4,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-297	4,6-ジ ^o フルオロ-3-(プロパ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-298	4,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-299	4,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-300	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-301	4-(アリルオキシ)-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-302	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-303	4-(アリルオキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-304	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-305	4-(アリルオキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-306	4-(アリルオキシ)-2-クロロフェニル
VIIIa-a-307	4-(アリルオキシ)-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-308	4-(アリルオキシ)-2-メチルフェニル
VIIIa-a-309	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-310	4-(アリルオキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-311	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-312	4-(アリルオキシ)-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-313	4-(アリルオキシ)-3-クロロフェニル
VIIIa-a-314	4-(アリルオキシ)-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-315	4-(アリルオキシ)-3-メチルフェニル
VIIIa-a-316	4-(アリルオキシ)フェニル
VIIIa-a-317	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-318	4-(シアノメトキシ)-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-319	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-320	4-(シアノメトキシ)-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-321	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-322	4-(シアノメトキシ)-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-323	4-(シアノメトキシ)-2-クロロフェニル
VIIIa-a-324	4-(シアノメトキシ)-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-325	4-(シアノメトキシ)-2-メチルフェニル
VIIIa-a-326	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-327	4-(シアノメトキシ)-3,5-ジ ^o フルオロフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-328	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^o クロロフェニル
VIIIa-a-329	4-(シアノメトキシ)-3,6-ジ ^p フルオロフェニル
VIIIa-a-330	4-(シアノメトキシ)-3-クロロフェニル
VIIIa-a-331	4-(シアノメトキシ)-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-332	4-(シアノメトキシ)-3-メチルフェニル
VIIIa-a-333	4-(シアノメトキシ)フェニル
VIIIa-a-334	4-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-335	4-クロロ-2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-336	4-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-337	4-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-338	4-クロロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-339	4-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-340	4-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-341	4-フルオロ-2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-342	4-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-343	4-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-344	4-フルオロ-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-345	4-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-346	4-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-347	4-ホルミル-2-メチルフェニル
VIIIa-a-348	4-ホルミル-3-メチルフェニル
VIIIa-a-349	4-ホルミルフェニル
VIIIa-a-350	4-メチル-2-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-351	4-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-352	4-メチル-3-(^p ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-353	4-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-354	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-355	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-356	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-357	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIIa-a-358	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-359	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIIa-a-360	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-361	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-362	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIIa-a-363	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-364	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-365	4-[(ヒト ^o ロキシイミノ)メチル]フェニル
VIIIa-a-366	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,3-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-367	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-368	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-369	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-クロロフェニル
VIIIa-a-370	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-フルオロフェニル
VIIIa-a-371	4-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルフェニル
VIIIa-a-372	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,5-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-373	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3,6-ジ ^o フルオロフェニル
VIIIa-a-374	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-クロロフェニル
VIIIa-a-375	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-フルオロフェニル
VIIIa-a-376	4-[(メトキシイミノ)メチル]-3-メチルフェニル
VIIIa-a-377	4-[(メトキシイミノ)メチル]フェニル
VIIIa-a-378	4-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-379	5,6-ジ ^o クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-380	5,6-ジ ^o クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-381	5,6-ジ ^o クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-382	5,6-ジ ^o クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-383	5,6-ジ ^o フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-384	5,6-ジ ^o フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-385	5,6-ジ ^o フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-386	5,6-ジ ^o フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-387	5,6-ジ ^o フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-388	5,6-ジ ^o フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-389	5-クロロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-390	5-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-391	5-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-392	5-クロロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-393	5-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-394	5-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-395	5-フルオロ-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-396	5-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-397	5-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-398	5-フルオロ-3-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-399	5-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-400	5-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-401	5-メチル-2-(^o ロハ ^o -2-イン-1-イルオキシ)フェニル

10

20

30

Ex.	R ¹
VIIIa-a-402	5-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-403	5-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-404	5-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-405	6-クロロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-406	6-クロロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-407	6-クロロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-408	6-クロロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-409	6-クロロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-410	6-クロロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-411	6-フルオロ-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-412	6-フルオロ-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-413	6-フルオロ-2-ホルミルフェニル
VIIIa-a-414	6-フルオロ-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-415	6-フルオロ-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-416	6-フルオロ-3-ホルミルフェニル
VIIIa-a-417	6-メチル-2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-418	6-メチル-2-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル
VIIIa-a-419	6-メチル-3-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル
VIIIa-a-420	6-メチル-3-[(メチルスルホニル)オキシ]フェニル

10

20

30

40

50

【0303】

log P値は、「EEC directive 79/831 Annex V. A 8」に従い、下記方法を用いて、逆相カラム(C18)でのHPLC(高性能液体クロマトグラフィー)によって測定した。

【0304】

[a] 酸性範囲内におけるLC-MSの測定は、0.1%水性ギ酸及びアセトニトリル(0.1%ギ酸含有)を溶離液〔10%アセトニトリルから95%アセトニトリルまでの直線勾配〕として用いて、pH 2.7で実施する。

【0305】

[b] 中性範囲内におけるLC-MSの測定は、0.001モル炭酸水素アンモニウム水溶液及びアセトニトリルを溶離液〔10%アセトニトリルから95%アセトニトリルま

での直線勾配)として用いて、pH 7.8で実施する。

【0306】

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

【0307】

ラムダマックス値は、200nm~400nmの紫外線スペクトルを使用し、クロマトグラフシグナルの最大値で決定した。

【0308】

選択された実施例のNMRデータ

NMRピークリスト法

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

【0309】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態で示される：

ν_1 (強度 ν_1) ; ν_2 (強度 ν_2) ; . . . ; ν_i (強度 ν_i) ; . . . ; ν_n (強度 ν_n)。

【表 7】

実施例 I-1, 溶媒: DMSO-d₆, 分光計: 399.95 MHz

7.9545 (3.60); 7.4134 (0.43); 7.3965 (0.44); 7.1822 (0.83); 7.1782 (1.01); 7.1516 (0.33); 7.1314 (0.39); 7.0088 (0.67); 6.9876 (0.60); 6.9104 (0.58); 6.8890 (0.39); 6.8848 (0.41); 6.0411 (1.73); 6.0305 (0.76); 4.8750 (0.67); 4.8476 (0.96); 4.8430 (1.60); 4.8377 (1.51); 3.5424 (0.37); 3.5368 (0.73); 3.5312 (0.35); 3.3287 (11.63); 2.8904 (16.00); 2.7310 (13.61); 2.6890 (0.37); 2.5110 (4.13); 2.5066 (8.51); 2.5021 (11.46); 2.4976 (8.43); 2.4933 (4.16); 2.1951 (4.61); 2.0941 (0.33); 2.0668 (0.35); -0.0002 (1.94)

10

実施例 I-2, 溶媒: DMSO-d₆, 分光計: 399.95 MHz

8.7704 (0.40); 7.9674 (7.50); 7.9568 (14.86); 7.4320 (2.09); 7.4148 (2.86); 7.4110 (4.55); 7.3941 (4.71); 7.3901 (3.04); 7.3731 (2.52); 7.3581 (4.38); 7.3361 (5.35); 7.3250 (10.03); 7.3031 (10.99); 7.0071 (6.19); 6.9860 (5.62); 6.9292 (5.16); 6.9241 (2.51); 6.9113 (10.58); 6.9073 (11.20); 6.8896 (8.88); 6.8594 (2.99); 6.0694 (0.97); 6.0558 (1.97); 6.0472 (1.41); 6.0337 (2.54); 6.0256 (2.36); 6.0168 (1.28); 6.0031 (1.97); 4.8896 (0.32); 4.8834 (0.74); 4.8772 (0.76); 4.8656 (1.59); 4.8492 (4.59); 4.8436 (12.06); 4.8381 (14.93); 4.8323 (10.43); 4.8048 (0.62); 4.7986 (0.99); 4.7923 (0.83); 4.7709 (3.30); 4.7542 (0.83); 4.7321 (1.79); 4.6953 (1.81); 4.6238 (1.78); 4.5884 (0.76); 4.4207 (1.52); 4.4000 (1.80); 4.3934 (1.73); 4.0553 (0.87); 4.0376 (3.47); 4.0330 (2.34); 4.0245 (7.36); 4.0200 (5.20); 4.0159 (5.42); 4.0073 (7.33); 3.9985 (5.23); 3.9898 (3.31); 3.9811 (2.74); 3.9477 (1.45); 3.8563 (0.63); 3.8236 (0.70); 3.8067 (0.86); 3.7756 (1.65); 3.7647 (1.16); 3.7337 (2.17); 3.7023 (1.19); 3.5447 (2.02); 3.5394 (5.22); 3.5351 (8.28); 3.5292 (3.52); 3.5185 (1.34); 3.4974 (2.51); 3.4824 (3.33); 3.4765 (2.53); 3.4648 (4.49); 3.4535 (2.24); 3.4470 (3.58); 3.4292 (1.81); 3.4119 (0.33); 3.4007 (0.64); 3.3917 (1.11); 3.3816 (0.83); 3.3719 (1.35); 3.3629 (2.44); 3.3537 (1.84); 3.3270 (73.42); 3.3064 (0.72); 3.2965 (0.67); 3.2873 (0.41); 3.2150 (0.97); 3.1832 (1.71); 3.1539 (1.00); 3.1259 (0.53); 3.0951 (0.78); 3.0660 (0.44); 2.9458 (0.50); 2.8589 (0.43); 2.8419 (1.16); 2.8248 (1.83); 2.8184 (1.23); 2.8078 (2.05); 2.7794 (2.09); 2.7501 (1.64); 2.7210 (0.51); 2.6754 (0.60); 2.6709 (0.81); 2.6663 (0.59); 2.5411 (0.32); 2.5241 (2.86); 2.5107 (45.32); 2.5063 (87.61); 2.5018 (114.13); 2.4973 (83.01); 2.4929 (40.26); 2.3373 (0.35); 2.3330 (0.64); 2.3286 (0.84); 2.3241 (0.63); 2.0941 (2.96); 2.0679 (3.61); 1.9892 (9.12); 1.9618 (0.66); 1.7451 (0.50); 1.7164 (1.15); 1.6926 (1.08); 1.6868 (1.06); 1.6630 (0.48); 1.5840 (0.92); 1.5537 (1.64); 1.5224 (1.55); 1.4918 (0.83); 1.3970 (7.54); 1.3356 (7.58); 1.3299 (6.61); 1.3183 (14.57); 1.3126 (11.93); 1.3009 (7.37); 1.2952 (5.52); 1.2490 (0.42); 1.1921 (2.98); 1.1745 (12.90); 1.1567 (16.00); 1.1374 (7.43); 1.0126 (11.42); 0.9956 (11.25); 0.0079 (1.26); -0.0002 (27.88); -0.0085 (1.05)

20

実施例 I-3, 溶媒: DMSO-d₆, 分光計: 399.95 MHz

7.9542 (6.35); 7.5019 (0.97); 7.4823 (2.04); 7.4638 (0.97); 7.4485 (2.11); 7.4441 (2.24); 7.4361 (1.00); 7.4282 (2.01); 7.4200 (1.99); 7.4158 (2.15); 7.4097 (0.92); 7.3982 (1.43); 7.3944 (0.97); 7.3773 (0.73); 7.2380 (0.71); 7.2200 (0.68); 7.0109 (2.14); 6.9897 (1.93); 6.9118 (1.09); 6.8863 (1.32); 6.8649 (1.02); 6.0571 (0.93); 6.0347 (1.14); 6.0267 (1.10); 6.0041 (0.97); 4.9751 (0.54); 4.9393 (2.21); 4.8987 (2.15); 4.8847 (0.37); 4.8619 (0.69); 4.8500 (3.18); 4.8452 (4.90); 4.8404 (3.23); 4.4223 (0.59); 4.3898 (0.64); 4.0557 (1.11); 4.0379 (3.38); 4.0201 (3.44); 4.0023 (1.19); 3.9716 (0.57); 3.9378 (0.63); 3.7681 (0.61); 3.7375 (0.70); 3.7262 (0.86); 3.6955 (0.76); 3.5451 (1.35); 3.5393 (2.76); 3.5337 (1.30); 3.4808 (0.60); 3.4595 (0.60); 3.4396 (0.46); 3.4174 (0.45); 3.3913 (0.47); 3.3817 (0.33); 3.3721 (0.55); 3.3626 (0.96); 3.3535 (0.61); 3.3283 (18.68); 3.2282 (0.43); 3.1978 (0.77); 3.1681 (0.44); 2.8255 (0.39); 2.8204 (0.41); 2.7906 (0.75); 2.7627 (0.42); 2.5111 (12.72); 2.5069 (24.81); 2.5024 (32.41); 2.4980 (24.08); 2.2501 (16.00); 2.0863 (1.06); 2.0698 (1.09); 1.9895 (14.31); 1.7192 (0.49); 1.6894 (0.48); 1.5510 (0.51); 1.5202 (0.48); 1.1924 (3.91); 1.1745 (7.74); 1.1568 (3.84); -0.0002 (5.50)

30

40

実施例 I-4, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.9541 (4.56); 7.4349 (0.46); 7.4130 (2.11); 7.3972 (1.13); 7.3933 (0.72); 7.3762 (0.52); 7.3518 (0.76); 7.3325 (0.92); 7.1471 (0.94); 7.1284 (0.78); 7.0095 (1.47); 6.9883 (1.33); 6.9105 (0.74); 6.8852 (0.91); 6.8637 (0.69); 6.0562 (0.54); 6.0339 (0.68); 6.0262 (0.65); 6.0034 (0.56); 5.7593 (2.88); 4.9251 (0.42); 4.8892 (1.54); 4.8423 (4.60); 4.8048 (0.46); 4.4214 (0.40); 4.3913 (0.45); 4.0553 (0.49); 4.0375 (1.49); 4.0197 (1.55); 4.0019 (0.81); 3.9619 (0.44); 3.7305 (0.47); 3.5436 (0.89); 3.5378 (1.80); 3.5321 (0.84); 3.4860 (0.65); 3.4635 (0.65); 3.4431 (0.50); 3.4211 (0.49); 3.3685 (0.39); 3.3592 (0.66); 3.3498 (0.42); 3.3270 (13.45); 3.1941 (0.53); 2.8901 (1.43); 2.7854 (0.52); 2.7310 (1.19); 2.5105 (11.52); 2.5063 (22.30); 2.5018 (29.06); 2.4973 (21.43); 2.4931 (10.72); 2.2184 (10.46); 2.2101 (16.00); 2.0946 (0.80); 2.0695 (0.81); 1.9892 (6.42); 1.7172 (0.34); 1.6895 (0.33); 1.5506 (0.35); 1.5203 (0.34); 1.1921 (1.74); 1.1743 (3.47); 1.1565 (1.71); -0.0002 (6.69)

実施例 I-5, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.9523 (6.32); 7.6893 (1.32); 7.6698 (1.71); 7.5807 (2.39); 7.5613 (1.28); 7.5412 (2.22); 7.5213 (1.15); 7.4361 (0.74); 7.4188 (1.57); 7.4151 (2.00); 7.3983 (2.20); 7.3774 (1.00); 7.0114 (2.15); 6.9902 (1.94); 6.9109 (1.08); 6.8854 (1.35); 6.8640 (1.02); 6.0567 (0.92); 6.0343 (1.13); 6.0264 (1.10); 6.0037 (0.96); 5.7598 (1.88); 4.9935 (0.58); 4.9577 (2.20); 4.9145 (2.12); 4.8908 (0.35); 4.8797 (0.65); 4.8505 (3.16); 4.8457 (4.91); 4.8408 (3.18); 4.4224 (0.61); 4.3902 (0.67); 4.0560 (0.79); 4.0382 (2.41); 4.0204 (2.45); 4.0026 (0.85); 3.9687 (0.59); 3.9353 (0.66); 3.7654 (0.64); 3.7334 (0.72); 3.7233 (0.90); 3.6918 (0.79); 3.5457 (1.30); 3.5399 (2.71); 3.5342 (1.28); 3.4790 (0.55); 3.4564 (0.55); 3.4410 (0.42); 3.4139 (0.41); 3.3912 (0.48); 3.3814 (0.36); 3.3717 (0.57); 3.3623 (0.97); 3.3532 (0.61); 3.3429 (0.45); 3.3286 (11.09); 3.2288 (0.44); 3.1983 (0.80); 3.1689 (0.44); 2.8263 (0.47); 2.8214 (0.43); 2.7907 (0.79); 2.7622 (0.44); 2.5251 (0.45); 2.5073 (19.73); 2.5028 (25.92); 2.4984 (19.39); 2.2689 (16.00); 2.1042 (1.05); 2.0709 (1.17); 1.9897 (10.36); 1.7171 (0.52); 1.6895 (0.50); 1.5492 (0.53); 1.5205 (0.50); 1.3969 (2.38); 1.1926 (2.89); 1.1748 (5.76); 1.1570 (2.84); -0.0002 (6.56); -0.0084 (0.35)

実施例 I-6, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.7705 (0.42); 8.0099 (3.69); 7.4036 (1.92); 7.3536 (0.94); 7.3499 (0.82); 7.3340 (1.13); 7.3301 (1.00); 7.1772 (2.14); 7.1651 (2.47); 7.1611 (2.22); 7.1538 (1.50); 7.1340 (1.17); 7.0888 (0.77); 7.0667 (0.89); 5.8531 (0.60); 5.8355 (0.71); 5.8255 (0.74); 5.8078 (0.62); 4.9178 (0.40); 4.8774 (4.12); 4.8717 (4.06); 4.8408 (1.59); 4.8165 (0.33); 4.8050 (0.44); 4.4103 (0.40); 4.3795 (0.46); 4.0558 (0.43); 4.0380 (1.31); 4.0202 (1.34); 4.0023 (0.51); 3.9802 (0.41); 3.9468 (0.46); 3.9011 (0.54); 3.8735 (0.56); 3.8579 (0.65); 3.8304 (0.54); 3.6078 (0.75); 3.6020 (1.51); 3.5968 (0.75); 3.3502 (0.40); 3.3408 (0.75); 3.3282 (13.10); 3.3124 (0.41); 3.2678 (0.69); 3.2503 (0.67); 3.2245 (0.70); 3.2073 (0.72); 3.1835 (0.56); 3.1533 (0.35); 2.7724 (0.55); 2.7438 (0.35); 2.5246 (0.64); 2.5112 (11.67); 2.5070 (22.74); 2.5025 (29.67); 2.4982 (21.87); 2.2281 (3.23); 2.2182 (16.00); 2.2074 (13.09); 2.1996 (2.30); 2.1902 (0.67); 2.0916 (0.70); 2.0820 (0.72); 2.0499 (0.83); 1.9897 (5.58); 1.9092 (1.42); 1.7042 (0.33); 1.6968 (0.34); 1.6732 (0.34); 1.5307 (0.33); 1.5202 (0.35); 1.5001 (0.34); 1.4907 (0.34); 1.3969 (4.19); 1.1925 (1.54); 1.1747 (3.02); 1.1569 (1.51); -0.0002 (6.53)

実施例 I-7, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

12.9922 (0.38); 8.7715 (0.37); 8.6617 (1.17); 8.0222 (3.57); 8.0128 (9.56); 7.9937 (0.35); 7.3508 (1.87); 7.3231 (7.08); 7.3012 (7.21); 7.1746 (6.71); 7.1621 (7.00); 7.1585 (6.15); 7.0890 (2.56); 7.0861 (2.56); 7.0636 (2.71); 6.9204 (3.70); 6.9137 (6.26); 6.8981 (4.17); 6.8921 (5.48); 5.8648 (0.63); 5.8525 (1.65); 5.8357 (2.26); 5.8251 (1.92); 5.8076 (1.59); 4.8718 (11.07); 4.8662 (10.08); 4.8259 (3.15); 4.8014 (0.46); 4.7948 (0.36); 4.7674 (3.06); 4.7309 (1.39); 4.6919 (1.12); 4.6139 (1.01); 4.5791 (0.47); 4.4126 (1.20); 4.4035 (1.23); 4.3825 (1.37); 4.0563 (0.82); 4.0470 (1.50); 4.0386 (2.60); 4.0305 (4.26); 4.0211 (3.54); 4.0130 (4.45); 4.0056 (3.60); 3.9955 (1.88); 3.9881 (2.69); 3.9706 (1.68); 3.9259 (1.56); 3.9044 (1.84); 3.8977 (1.24); 3.8820 (1.30); 3.8765 (1.96); 3.8611 (2.11); 3.8552 (1.16); 3.8334 (1.85); 3.8136 (0.48); 3.6065 (2.67); 3.6008 (5.18); 3.5953 (2.56); 3.5802 (0.39); 3.4978 (0.71); 3.4801 (1.85); 3.4623 (2.60); 3.4445 (2.00); 3.4340 (0.43); 3.4268 (0.82); 3.3819 (0.51); 3.3731 (0.82); 3.3635 (0.69); 3.3535 (1.10);

10

20

30

3.3442 (2.07); 3.3304 (20.08); 3.3156 (1.38); 3.3057 (1.23); 3.2835 (1.13); 3.2674 (2.56); 3.2501 (1.95); 3.2403 (0.91); 3.2242 (2.21); 3.2069 (2.25); 3.1709 (1.36); 3.1419 (0.82); 3.1111 (0.45); 3.0754 (0.71); 3.0483 (0.44); 3.0138 (0.53); 2.9472 (0.39); 2.8372 (0.51); 2.8205 (0.92); 2.8016 (1.01); 2.7648 (1.65); 2.7342 (1.22); 2.7036 (0.40); 2.6771 (0.33); 2.6724 (0.45); 2.5080 (36.63); 2.5036 (46.90); 2.4992 (34.39); 2.3305 (0.33); 2.0721 (2.16); 2.0460 (2.77); 1.9904 (5.45); 1.9584 (0.71); 1.9316 (0.42); 1.7294 (0.39); 1.7003 (0.88); 1.6773 (0.85); 1.6485 (0.39); 1.5890 (0.35); 1.5595 (0.97); 1.5289 (1.45); 1.4981 (1.32); 1.4631 (0.69); 1.4041 (11.07); 1.3961 (3.74); 1.3397 (7.11); 1.3224 (16.00); 1.3052 (11.20); 1.2880 (2.43); 1.2491 (0.35); 1.2342 (0.35); 1.1932 (1.83); 1.1753 (10.41); 1.1572 (12.78); 1.1348 (7.30); 1.0097 (5.45); 0.9929 (5.28); 0.0079 (0.57); -0.0002 (12.39); -0.0085 (0.54)

実施例 I-8, 溶媒: CD3CN, 分光計: 399.95 MHz

10.1384 (4.87); 7.9635 (1.51); 7.9450 (1.44); 7.6833 (2.36); 7.6811 (2.86); 7.6714 (3.22); 7.6684 (1.83); 7.6487 (5.99); 7.5976 (0.76); 7.5861 (1.11); 7.5783 (0.82); 7.5664 (0.76); 7.5568 (0.48); 6.4608 (1.02); 6.4443 (1.03); 6.4329 (1.06); 6.4162 (1.04); 4.6285 (2.33); 4.6116 (2.40); 4.4785 (0.38); 4.4512 (0.39); 4.3267 (0.42); 4.0990 (1.23); 4.0864 (0.94); 4.0686 (2.80); 4.0554 (1.49); 4.0507 (2.75); 4.0329 (0.94); 4.0275 (1.36); 3.9830 (0.37); 3.9498 (0.40); 3.3104 (0.47); 3.2908 (0.48); 3.2811 (0.95); 3.2712 (0.51); 3.2524 (0.50); 3.1672 (1.48); 3.1505 (1.74); 3.1236 (1.53); 3.1069 (1.36); 2.7614 (0.48); 2.1913 (0.46); 2.1898 (0.51); 2.1692 (146.43); 2.1651 (275.77); 2.1639 (218.61); 2.1469 (1.17); 2.1323 (0.61); 2.1199 (0.97); 2.1139 (1.36); 2.1076 (1.38); 2.1015 (1.04); 2.0954 (0.76); 2.0812 (0.94); 1.9721 (12.09); 1.9645 (14.96); 1.9584 (2.42); 1.9526 (40.42); 1.9464 (79.16); 1.9402 (115.91); 1.9340 (78.66); 1.9279 (39.79); 1.9150 (0.58); 1.8888 (0.58); 1.8536 (15.08); 1.8373 (0.55); 1.8175 (0.82); 1.8083 (16.00); 1.7748 (0.55); 1.7686 (0.77); 1.7623 (0.56); 1.7565 (0.44); 1.7305 (0.37); 1.6986 (0.38); 1.6154 (0.35); 1.5913 (0.33); 1.5812 (0.32); 1.3349 (0.33); 1.2218 (3.22); 1.2040 (6.45); 1.1861 (3.15); -0.0002 (1.13)

10

実施例 I-9, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0327 (6.22); 7.5906 (0.54); 7.5747 (0.64); 7.5696 (1.15); 7.5538 (1.19); 7.5487 (0.76); 7.5329 (0.70); 7.3481 (0.81); 7.3300 (2.48); 7.3238 (1.11); 7.3092 (1.66); 7.3025 (0.75); 6.0465 (0.62); 6.0230 (0.78); 6.0166 (0.74); 5.9930 (0.65); 5.0844 (0.38); 5.0466 (1.73); 5.0071 (1.67); 4.9696 (0.39); 4.3987 (0.40); 4.3659 (0.43); 4.0380 (0.51); 4.0202 (0.52); 3.8983 (0.43); 3.8942 (0.40); 3.8679 (0.49); 3.8636 (0.49); 3.8550 (0.59); 3.8506 (0.60); 3.8242 (0.85); 3.8205 (0.87); 3.7880 (0.43); 3.5470 (16.00); 3.5275 (0.76); 3.5040 (0.72); 3.4826 (0.57); 3.4598 (0.56); 3.3900 (0.34); 3.3702 (0.45); 3.3613 (0.73); 3.3519 (0.42); 3.3245 (11.87); 3.1663 (0.53); 2.7902 (0.52); 2.5245 (0.41); 2.5197 (0.70); 2.5112 (8.64); 2.5067 (17.31); 2.5021 (22.66); 2.4974 (16.20); 2.4929 (7.58); 2.0999 (0.80); 2.0945 (0.84); 2.0629 (15.57); 1.9891 (2.31); 1.7285 (0.35); 1.6980 (0.32); 1.5563 (0.33); 1.5271 (0.32); 1.2496 (0.35); 1.1924 (0.64); 1.1746 (1.29); 1.1568 (0.62); 0.0080 (0.52); -0.0002 (14.82); -0.0086 (0.44)

20

実施例 I-10, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0469 (5.74); 7.5142 (0.80); 7.5100 (0.92); 7.4931 (1.33); 7.4682 (0.81); 7.4637 (0.99); 7.4529 (2.98); 7.4486 (3.63); 7.4345 (0.58); 7.4232 (1.09); 7.4170 (0.76); 7.4070 (0.65); 7.4046 (0.79); 7.4015 (0.59); 7.3979 (0.57); 7.3893 (0.39); 7.3827 (0.36); 6.0059 (0.79); 5.9865 (0.93); 5.9780 (0.90); 5.9586 (0.81); 5.0803 (0.36); 5.0426 (1.65); 5.0030 (1.60); 4.9651 (0.36); 4.3930 (0.37); 4.3602 (0.40); 4.0381 (0.64); 4.0203 (0.65); 3.9914 (0.81); 3.9634 (0.95); 3.9479 (1.06); 3.9200 (0.87); 3.8135 (0.36); 3.7798 (0.40); 3.5526 (16.00); 3.3767 (0.36); 3.3561 (1.28); 3.3483 (0.78); 3.3367 (1.27); 3.3240 (8.73); 3.3126 (1.08); 3.2932 (0.91); 3.1569 (0.50); 2.7799 (0.48); 2.5247 (0.40); 2.5199 (0.61); 2.5113 (8.66); 2.5067 (17.70); 2.5021 (23.44); 2.4975 (16.86); 2.4930 (7.97); 2.0767 (0.90); 2.0611 (14.17); 2.0522 (1.34); 1.9892 (2.84); 1.2495 (0.33); 1.1927 (0.79); 1.1749 (1.58); 1.1571 (0.78); 0.0080 (0.43); -0.0002 (14.15); -0.0085 (0.45)

30

実施例 I-11, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.9982 (5.94); 7.3449 (0.52); 7.3407 (0.70); 7.3199 (1.87); 7.3060 (0.69); 7.3018 (1.61); 7.2985 (1.84); 7.1486 (1.75); 7.1285 (1.48); 7.0156 (0.96); 6.9981 (1.67); 6.9795 (0.77); 5.8806 (0.85); 5.8628 (0.97); 5.8529 (0.94); 5.8350 (0.86); 5.7577 (1.13); 4.8781 (4.66); 4.8722 (4.67); 4.6666

(2.44); 4.6483 (2.43); 4.5951 (0.67); 4.3878 (0.43); 4.3549 (0.47); 4.0557 (0.38); 4.0379 (1.14); 4.0201 (1.16); 4.0023 (0.39); 3.9284 (0.41); 3.8900 (1.26); 3.8621 (1.05); 3.8470 (1.15); 3.8192 (0.96); 3.5879 (1.22); 3.5821 (2.71); 3.5762 (1.21); 3.3571 (0.39); 3.3375 (0.56); 3.3240 (19.15); 3.3094 (0.40); 3.2993 (0.51); 3.2588 (1.16); 3.2409 (1.12); 3.2158 (1.04); 3.1981 (1.00); 3.1408 (0.57); 2.7458 (0.55); 2.5243 (0.43); 2.5194 (0.75); 2.5108 (10.95); 2.5064 (22.13); 2.5018 (29.24); 2.4973 (21.30); 2.4928 (10.34); 2.0607 (0.89); 2.0308 (1.05); 1.9891 (5.09); 1.8288 (15.58); 1.8235 (1.85); 1.8196 (1.01); 1.7932 (16.00); 1.7823 (0.95); 1.6664 (0.46); 1.6433 (0.37); 1.6320 (0.39); 1.5163 (0.36); 1.5084 (0.38); 1.4872 (0.37); 1.4792 (0.35); 1.1924 (1.33); 1.1746 (2.66); 1.1568 (1.31); -0.0002 (2.35)

実施例 I-12, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0416 (5.69); 7.5142 (0.85); 7.5102 (0.98); 7.4930 (1.44); 7.4727 (0.34); 7.4683 (0.84); 7.4638 (1.03); 7.4530 (3.23); 7.4486 (3.86); 7.4344 (0.68); 7.4234 (1.18); 7.4173 (0.86); 7.4048 (0.89); 7.4018 (0.70); 7.3983 (0.66); 7.3896 (0.45); 7.3830 (0.41); 6.0049 (0.84); 5.9855 (1.01); 5.9772 (0.97); 5.9577 (0.88); 5.7581 (0.70); 4.6691 (2.29); 4.6515 (2.34); 4.3911 (0.40); 4.3593 (0.44); 4.0558 (0.32); 4.0380 (0.93); 4.0202 (0.95); 4.0024 (0.35); 3.9909 (0.84); 3.9629 (1.00); 3.9474 (1.24); 3.9323 (0.43); 3.9196 (1.13); 3.8993 (0.45); 3.5533 (16.00); 3.3691 (0.43); 3.3555 (1.19); 3.3501 (0.58); 3.3360 (1.53); 3.3254 (14.63); 3.3120 (1.37); 3.2927 (0.98); 3.1461 (0.53); 2.7512 (0.53); 2.5247 (0.41); 2.5198 (0.67); 2.5113 (7.79); 2.5068 (15.48); 2.5023 (20.20); 2.4977 (14.58); 2.4932 (6.96); 2.0677 (0.85); 2.0372 (0.99); 1.9893 (4.12); 1.8296 (14.61); 1.8187 (0.70); 1.7936 (15.22); 1.7815 (0.68); 1.6721 (0.35); 1.6676 (0.35); 1.6494 (0.33); 1.6417 (0.33); 1.5159 (0.35); 1.4932 (0.33); 1.1925 (1.10); 1.1747 (2.18); 1.1569 (1.07); -0.0002 (1.61)

10

実施例 I-13, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0271 (6.25); 7.5903 (0.53); 7.5745 (0.62); 7.5694 (1.14); 7.5535 (1.18); 7.5484 (0.76); 7.5326 (0.69); 7.3484 (0.80); 7.3297 (2.54); 7.3243 (1.19); 7.3088 (1.66); 7.3029 (0.80); 6.0454 (0.63); 6.0220 (0.78); 6.0155 (0.75); 5.9920 (0.66); 4.6725 (2.29); 4.6557 (2.27); 4.3964 (0.39); 4.3649 (0.42); 4.0379 (0.66); 4.0201 (0.66); 3.9404 (0.38); 3.8978 (0.69); 3.8939 (0.59); 3.8672 (0.49); 3.8630 (0.49); 3.8543 (0.58); 3.8499 (0.59); 3.8238 (0.49); 3.8197 (0.51); 3.5471 (16.00); 3.5264 (0.76); 3.5028 (0.73); 3.4818 (0.56); 3.4586 (0.56); 3.3817 (0.36); 3.3623 (0.42); 3.3528 (0.77); 3.3433 (0.46); 3.3250 (15.50); 3.1551 (0.51); 2.7608 (0.50); 2.5245 (0.34); 2.5197 (0.56); 2.5111 (7.41); 2.5066 (14.97); 2.5020 (19.76); 2.4974 (14.25); 2.4929 (6.74); 2.0859 (0.82); 2.0555 (0.94); 1.9891 (2.95); 1.8325 (15.49); 1.7955 (15.54); 1.6908 (0.33); 1.6698 (0.34); 1.6620 (0.32); 1.5326 (0.33); 1.1924 (0.80); 1.1745 (1.59); 1.1568 (0.78); -0.0002 (1.73)

20

実施例 I-14, 溶媒: CDCl₃, 分光計: 250.13 MHz

7.6093 (1.70); 7.5932 (0.43); 7.5684 (0.47); 7.5599 (0.47); 7.4024 (0.76); 7.3874 (1.25); 7.3561 (0.38); 7.3447 (0.46); 7.2658 (5.88); 7.2635 (5.81); 6.0595 (0.34); 6.0271 (0.40); 6.0145 (0.39); 5.9817 (0.38); 5.3038 (3.98); 5.3015 (3.99); 4.7093 (1.76); 4.7048 (1.79); 3.9822 (0.33); 3.9378 (0.34); 3.9131 (0.46); 3.8680 (0.42); 3.4797 (0.45); 3.4464 (0.43); 3.4092 (0.35); 3.3769 (0.35); 3.2957 (0.33); 3.2640 (5.71); 3.2621 (5.51); 2.8063 (0.39); 2.1921 (0.35); 2.1471 (0.46); 1.8761 (0.37); 1.8514 (5.47); 1.8494 (5.40); 1.7818 (0.42); 1.7665 (0.44); 1.7310 (0.37); 1.7150 (0.36); 1.6003 (5.45); 1.2560 (0.32); 1.0915 (16.00); 1.0898 (15.63); 0.0020 (3.70); -0.0002 (3.83)

実施例 XVI-81, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0023 (2.21); 7.3274 (0.63); 7.3094 (0.52); 7.3064 (0.61); 7.1559 (0.55); 7.1361 (0.48); 7.0063 (0.54); 4.8848 (1.59); 4.8789 (1.58); 4.0457 (0.33); 4.0280 (0.46); 3.8681 (0.37); 3.8529 (0.41); 3.8252 (0.34); 3.5917 (0.42); 3.5858 (0.91); 3.5799 (0.39); 3.3325 (21.59); 3.2674 (0.44); 3.2496 (0.49); 3.2243 (0.41); 3.2066 (0.40); 2.5323 (0.43); 2.5275 (0.67); 2.5189 (7.55); 2.5144 (15.19); 2.5098 (20.02); 2.5052 (14.38); 2.5006 (6.78); 2.0156 (0.36); 1.9968 (1.09); 1.5688 (0.37); 1.5590 (0.33); 1.5375 (0.32); 1.4130 (16.00); 1.4055 (4.84); 1.3983 (0.54); 1.1828 (0.57)

30

実施例 XVI-96, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

10.1331 (1.80); 7.9900 (2.32); 7.8225 (0.80); 7.5122 (0.57); 7.5092 (0.58); 7.4848 (0.99); 7.4649 (0.42); 6.3801 (0.33); 6.3686 (0.33); 4.0440 (0.39); 4.0162 (0.67); 4.0004 (0.66); 3.9728

(0.57); 3.3355 (5.02); 3.2206 (0.32); 3.1791 (0.44); 3.1628 (0.41); 3.1354 (0.38); 3.1192 (0.38); 2.5121 (5.31); 2.5077 (10.74); 2.5032 (14.32); 2.4987 (10.76); 2.4943 (5.47); 2.3956 (3.63); 2.0202 (0.40); 1.9900 (0.60); 1.5485 (0.36); 1.5391 (0.41); 1.5179 (0.35); 1.5082 (0.34); 1.4022 (16.00); 1.3969 (13.31); 1.3823 (0.80); -0.0002 (6.28)

実施例 XVI-99, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

10.1791 (1.59); 8.0298 (0.44); 8.0257 (0.50); 8.0094 (0.57); 8.0067 (0.52); 7.9879 (2.03); 7.7141 (0.51); 7.6953 (0.37); 7.6920 (0.34); 7.6213 (0.41); 7.6054 (0.91); 7.5869 (0.61); 4.0770 (0.34); 4.0490 (0.43); 4.0400 (0.56); 4.0332 (0.54); 4.0222 (0.72); 4.0050 (0.74); 3.9820 (0.36); 3.3146 (76.20); 3.2228 (0.38); 3.2155 (0.57); 3.1993 (0.48); 3.1719 (0.40); 3.1557 (0.39); 2.5109 (4.05); 2.5066 (7.25); 2.5021 (9.26); 2.4977 (6.41); 2.4933 (3.09); 2.0288 (0.39); 1.9877 (2.29); 1.5561 (0.38); 1.5457 (0.37); 1.5242 (0.34); 1.4203 (0.57); 1.4095 (3.12); 1.4028 (16.00); 1.3837 (0.49); 1.1936 (0.57); 1.1758 (1.11); 1.1580 (0.55); -0.0002 (0.49)

実施例 XVI-142, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0379 (2.21); 7.5135 (0.38); 7.5098 (0.43); 7.4923 (0.63); 7.4673 (0.37); 7.4629 (0.44); 7.4520 (1.34); 7.4477 (1.52); 7.4226 (0.47); 7.4165 (0.33); 7.4040 (0.37); 6.0031 (0.35); 5.9837 (0.42); 5.9753 (0.40); 5.9558 (0.36); 4.0252 (0.33); 3.9887 (0.66); 3.9606 (0.44); 3.9452 (0.47); 3.9173 (0.39); 3.5512 (6.33); 3.3554 (0.46); 3.3357 (0.63); 3.3237 (9.19); 3.3121 (0.51); 3.2926 (0.41); 3.2460 (0.35); 2.5108 (5.80); 2.5066 (10.93); 2.5021 (14.10); 2.4976 (10.36); 2.4933 (5.17); 2.0453 (0.42); 2.0403 (0.42); 2.0134 (0.49); 1.5667 (0.40); 1.5584 (0.44); 1.5366 (0.40); 1.5274 (0.37); 1.4061 (16.00); 1.0435 (0.44); 1.0283 (0.43)

10

実施例 XVI-405, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.9403 (2.52); 7.4067 (0.50); 7.3861 (0.88); 7.3654 (0.70); 7.1577 (0.74); 7.1497 (0.90); 7.1364 (0.57); 7.1297 (0.75); 7.1275 (0.53); 6.2254 (0.35); 6.2008 (0.46); 6.1946 (0.42); 6.1699 (0.36); 4.7922 (0.79); 4.7859 (1.02); 4.7840 (0.98); 4.7776 (0.78); 4.0380 (1.03); 4.0202 (0.99); 4.0024 (0.55); 3.7230 (0.34); 3.7118 (0.48); 3.6810 (0.39); 3.5723 (0.44); 3.5476 (0.44); 3.4430 (0.48); 3.4371 (1.11); 3.4312 (0.46); 3.3224 (6.80); 2.5112 (3.77); 2.5066 (7.61); 2.5020 (10.08); 2.4974 (7.28); 2.4929 (3.45); 2.0660 (0.34); 2.0609 (0.36); 2.0341 (0.41); 2.0288 (0.39); 1.9887 (3.52); 1.5770 (0.32); 1.4097 (16.00); 1.1930 (0.97); 1.1752 (1.92); 1.1573 (0.95); -0.0002 (0.69)

20

実施例 XVI-411, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.9551 (2.65); 7.4104 (0.46); 7.3936 (0.47); 7.0086 (0.64); 6.9874 (0.58); 6.9077 (0.32); 6.8862 (0.35); 6.8829 (0.37); 6.0427 (0.34); 6.0346 (0.32); 4.8486 (0.94); 4.8431 (1.62); 4.8375 (0.91); 3.5414 (0.53); 3.5355 (1.20); 3.5296 (0.51); 3.5158 (0.33); 3.4932 (0.33); 3.3217 (3.50); 3.2549 (0.33); 2.8906 (0.76); 2.7311 (0.48); 2.5109 (3.82); 2.5064 (7.66); 2.5018 (10.06); 2.4972 (7.17); 2.4926 (3.38); 2.0629 (0.34); 2.0576 (0.35); 2.0311 (0.41); 2.0258 (0.40); 1.5840 (0.32); 1.5741 (0.35); 1.5532 (0.33); 1.4094 (16.00); 1.3974 (4.87); -0.0002 (7.08)

実施例 XVI-412, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0235 (2.59); 7.5685 (0.48); 7.5526 (0.49); 7.3468 (0.35); 7.3290 (0.99); 7.3225 (0.47); 7.3083 (0.67); 6.0203 (0.33); 4.0380 (0.97); 4.0202 (0.94); 4.0024 (0.54); 3.5455 (6.73); 3.5261 (0.33); 3.3235 (9.89); 3.2588 (0.34); 2.5195 (0.38); 2.5111 (4.57); 2.5066 (9.08); 2.5020 (11.93); 2.4975 (8.59); 2.4930 (4.09); 2.0632 (0.36); 2.0576 (0.37); 2.0310 (0.42); 1.9889 (3.21); 1.5730 (0.32); 1.4085 (16.00); 1.1928 (0.84); 1.1750 (1.67); 1.1572 (0.82); -0.0002 (1.02)

30

実施例 XIIIa-81, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 250.13 MHz

8.0476 (3.47); 7.3672 (0.36); 7.3353 (1.41); 7.3054 (1.33); 7.1686 (0.81); 7.1370 (0.63); 7.0414 (0.47); 7.0114 (0.78); 6.9820 (0.33); 5.9127 (0.37); 5.8843 (0.48); 5.8686 (0.45); 5.8401 (0.38); 4.8933 (2.26); 4.8838 (2.22); 3.9297 (0.40); 3.8852 (0.47); 3.8609 (0.55); 3.8164 (0.46); 3.6534 (0.50); 3.6266 (0.34); 3.6146 (0.78); 3.6053 (1.72); 3.5958 (0.80); 3.5776 (16.00); 3.4196 (0.66); 3.4064 (0.47); 3.3943 (0.67); 3.3770 (0.53); 3.3618 (0.48); 3.3296 (0.55); 3.2946 (0.60); 3.2661 (0.51); 3.2261 (0.44); 3.1973 (0.43); 3.0480 (0.41); 3.0062 (0.39); 2.5269 (2.31); 2.5197 (4.97); 2.5123 (6.87); 2.5050 (4.89); 2.4977 (2.22); 2.2226 (0.38); 2.1762 (0.54); 1.9494 (0.44); 1.9198 (0.45); 1.9077 (0.37)

実施例 XIIIa-99, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

10.1852 (0.84); 8.0314 (1.21); 7.6096 (0.56); 7.5908 (0.35); 4.9198 (0.83); 3.5685 (16.00); 2.5153 (1.65); 2.5110 (3.07); 2.5066 (4.02); 2.5022 (2.88); 2.4979 (1.45)

実施例 XIIIa-142, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0794 (1.10); 7.4568 (0.52); 7.4530 (0.70); 3.5680 (16.00); 3.5561 (3.16); 3.3620 (0.33); 3.3187 (0.33); 2.5122 (3.27); 2.5077 (6.64); 2.5031 (8.90); 2.4985 (6.58); 2.4940 (3.22); 1.5955 (0.36)

実施例 XIIIa-236, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

10.0393 (1.14); 10.0353 (1.07); 8.0737 (1.13); 8.0695 (1.10); 7.9323 (0.83); 7.9014 (0.45); 7.8983 (0.42); 7.8826 (0.51); 7.7509 (0.36); 7.7316 (0.53); 7.6643 (0.37); 7.6455 (0.55); 6.1538 (0.93); 5.8819 (0.37); 3.5694 (16.00); 3.5671 (12.49); 3.5649 (15.32); 3.4501 (0.42); 3.4466 (0.44); 3.4306 (0.45); 3.4269 (0.47); 3.4123 (0.43); 3.4073 (0.49); 3.3878 (0.48); 3.3347 (0.59); 3.3038 (0.70); 3.0320 (0.55); 3.0039 (0.53); 2.5163 (4.08); 2.5125 (5.39); 2.5084 (4.95); 2.2135 (0.49); 2.1809 (0.67); 2.0048 (0.54); 1.9753 (0.48); -0.0002 (0.36); -0.0047 (0.34)

10

実施例 XIIIa-349, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

10.0194 (2.71); 8.0738 (3.28); 7.9545 (1.88); 7.9378 (0.78); 7.9339 (2.11); 7.6260 (1.88); 7.6055 (1.65); 5.8958 (0.45); 5.8766 (0.52); 5.8683 (0.50); 5.8490 (0.45); 3.9953 (0.51); 3.9675 (0.57); 3.9521 (0.66); 3.9244 (0.56); 3.5689 (16.00); 3.4221 (0.79); 3.4095 (0.55); 3.4028 (0.83); 3.3915 (0.34); 3.3792 (0.76); 3.3597 (0.82); 3.3475 (0.61); 3.3157 (0.71); 3.0334 (0.58); 3.0066 (0.56); 2.5679 (0.44); 2.5157 (4.27); 2.5113 (8.22); 2.5068 (10.52); 2.5022 (7.51); 2.4978 (3.56); 2.2079 (0.52); 2.1829 (0.68); 2.1792 (0.69); 1.9731 (0.55); 1.9474 (0.49); 1.3565 (0.95); 0.0079 (0.43); -0.0002 (10.08); -0.0085 (0.34)

実施例 XIIIa-405, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.9866 (2.24); 7.4120 (0.45); 7.3913 (0.91); 7.3707 (0.66); 7.1635 (0.77); 7.1531 (0.89); 7.1425 (0.65); 7.1331 (0.74); 6.2352 (0.36); 6.2106 (0.47); 6.2044 (0.43); 6.1797 (0.37); 4.7980 (0.90); 4.7920 (1.02); 4.7883 (1.01); 4.7821 (0.87); 3.7339 (0.37); 3.7229 (0.50); 3.6921 (0.42); 3.5774 (0.70); 3.5680 (16.00); 3.5532 (0.52); 3.5356 (0.34); 3.5111 (0.34); 3.4624 (0.59); 3.4567 (1.14); 3.4508 (0.58); 3.4175 (0.36); 3.3598 (0.44); 3.3279 (0.54); 3.0421 (0.44); 3.0155 (0.43); 2.5130 (3.61); 2.5087 (7.01); 2.5042 (9.07); 2.4996 (6.63); 2.4953 (3.26); 2.2274 (0.40); 2.1984 (0.54); 1.9769 (0.40); 1.9498 (0.38); -0.0002 (5.24)

20

実施例 XIIIa-411, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0015 (2.35); 7.4157 (0.58); 7.3985 (0.55); 7.0128 (0.89); 6.9917 (0.82); 6.9107 (0.47); 6.8864 (0.61); 6.8637 (0.43); 6.0736 (0.39); 6.0514 (0.48); 6.0436 (0.47); 6.0210 (0.41); 5.7614 (0.38); 4.8476 (2.03); 3.7794 (0.35); 3.7680 (0.43); 3.7375 (0.39); 3.5680 (16.00); 3.5655 (11.38); 3.5537 (1.28); 3.5212 (0.47); 3.4989 (0.47); 3.4787 (0.37); 3.4564 (0.44); 3.4173 (0.45); 3.3537 (0.58); 3.3226 (0.71); 3.0381 (0.58); 3.0107 (0.56); 2.8913 (0.38); 2.7306 (0.35); 2.5089 (10.65); 2.5049 (14.30); 2.2234 (0.55); 2.1921 (0.72); 1.9766 (0.58); 1.9481 (0.51); -0.0002 (3.54); -0.0027 (2.58)

実施例 XIIIa-412, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

8.0656 (0.97); 7.3355 (0.35); 3.5681 (16.00); 3.5526 (2.63); 2.5128 (2.19); 2.5085 (4.36); 2.5039 (5.79); 2.4994 (4.34); 2.4951 (2.19)

30

実施例 VIIa-a-143, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

13.7691 (1.28); 8.0269 (0.33); 7.8403 (1.07); 7.8195 (1.73); 7.8042 (2.66); 7.7584 (2.21); 7.7381 (1.42); 6.1631 (0.88); 6.1492 (0.57); 6.1423 (1.04); 6.1335 (0.98); 6.1126 (0.91); 6.1064 (0.46); 5.6296 (0.44); 5.6015 (0.41); 5.0141 (1.08); 4.9727 (4.57); 4.9653 (2.84); 4.9504 (4.46); 4.9090 (1.05); 4.2764 (1.13); 3.8091 (1.02); 3.7793 (1.13); 3.7648 (1.26); 3.7351 (1.12); 3.6493 (16.00); 3.5693 (3.62); 3.3743 (5.39); 3.1903 (1.20); 3.1695 (1.19); 3.1460 (1.06); 3.1253 (1.05); 2.5114 (7.75); 2.5070 (10.22); 2.5027 (7.52)

実施例 VIIIa-a-81, 溶媒: DMSO-d6, 分光計: 399.95 MHz

7.3037 (0.63); 7.2995 (0.72); 7.2809 (1.24); 7.2646 (0.85); 7.2604 (1.00); 7.2462 (1.33); 7.2423 (1.23); 7.2273 (1.52); 7.2234 (1.28); 7.0579 (1.80); 7.0379 (1.52); 6.9489 (0.97); 6.9473 (0.98); 6.9303 (1.69); 6.9287 (1.66); 6.9116 (0.81); 6.9100 (0.78); 5.8459 (0.94); 5.8251 (1.09); 5.8160 (1.08); 5.7952 (0.98); 4.7535 (4.77); 4.7476 (4.83); 3.5303 (1.35); 3.5244 (2.79); 3.5186 (1.36); 3.4687 (1.12); 3.4387 (1.19); 3.4251 (1.39); 3.3952 (1.25); 3.2600 (4.66); 2.9524 (1.32); 2.9315 (1.30); 2.9089 (1.14); 2.8880 (1.13); 2.4336 (5.79); 2.4292 (7.64); 2.4248 (5.66); 2.3714 (16.00)

40

【 0 3 1 0 】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ (cm) と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種

50

類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0311】

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

【0312】

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

10

【0313】

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

【0314】

溶媒及び/又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、1H NMRピークの本発明者らによるリストは、溶媒の通常のピーク、例えば、DMSO-D₆中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【0315】

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

20

【0316】

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

【0317】

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

30

【0318】

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

【0319】

使用実施例

フィットフトラ (Phytophthora) 試験 (トマト) / 保護

40

溶媒: 49重量部のN,N-ジメチルホルムアミド

乳化剤: 1重量部のアルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性成分の適切な製剤を製造するために、1重量部の活性成分を上記量の溶媒及び乳化剤と混合し、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0320】

保護効力について試験するために、トマト幼植物に、活性成分の該製剤を記載されている施用量で噴霧する。その処理の1日後、該植物に、フィットフトラ・インフェスタンス (Phytophthora infestans) の胞子の懸濁液を用いて接種し、次いで、その植物を、相対湿度100%、22で24時間放置する。次いで、その植物を、相対空気湿度約96%で温度約20の人工気象室の中に置く。

50

【0321】

評価は、上記接種の7日後に行う。0%は、対照の効力に相当する効力を意味し、100%の効力は、感染が観察されないことを意味する。

【0322】

この試験において、以下の本発明化合物は、活性成分の濃度100ppmで、70%以上の効力を示す：

【表8】

実施例	効力 (%)
I-1	94
I-2	89
I-3	83
I-4	78
I-8	89

10

20

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2012/076585

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D261/08 C07D419/14 A01N43/32 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2010/065579 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]) 10 June 2010 (2010-06-10) cited in the application Seite 56, Zeilen 36,37; Seiten 72 und 73, Schemata 19 und 20;; page 2, line 2 - page 2, line 4; claims; tables 1-6 -----	1,2,9-16
A	WO 2011/018415 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; SULZER SARAH [CH]; LAMBERTH CLEMENS []) 17 February 2011 (2011-02-17) cited in the application page 1, line 2 - page 1, line 9; claims; examples 1-192 -----	1,2,9-16
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C.		<input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.
* Special categories of cited documents : "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family
Date of the actual completion of the international search		Date of mailing of the international search report
25 February 2013		11/07/2013
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016		Authorized officer Schmid, Arnold

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2012/076585

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2010065579 A2	10-06-2010	AR 074411 A1	12-01-2011
		AU 2009322486 A1	10-06-2010
		CN 102227423 A	26-10-2011
		EP 2358709 A2	24-08-2011
		JP 2012510520 A	10-05-2012
		KR 20110091798 A	12-08-2011
		TW 201036966 A	16-10-2010
		US 2011224258 A1	15-09-2011
		UY 32285 A	30-06-2010
		WO 2010065579 A2	10-06-2010
		WO 2011018415 A2	17-02-2011
AU 2010283767 A1	23-02-2012		
CA 2768636 A1	17-02-2011		
CN 102471277 A	23-05-2012		
CR 20120064 A	22-03-2012		
EA 201200259 A1	28-09-2012		
EP 2464630 A2	20-06-2012		
JP 2013501745 A	17-01-2013		
KR 20120048010 A	14-05-2012		
TW 201114755 A	01-05-2011		
US 2012142698 A1	07-06-2012		
US 2013144064 A1	06-06-2013		
UY 32840 A	31-03-2011		
WO 2011018415 A2	17-02-2011		

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2012/076585

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

- 1. Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

- 2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

- 3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

See supplemental sheet

- 1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
- 2. As all searchable claims could be searched without effort justifying additional fees, this Authority did not invite payment of additional fees.
- 3. As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

- 4. No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
1, 2, 9-16

- Remark on Protest
- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, the payment of a protest fee.
 - The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
 - No protest accompanied the payment of additional search fees.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No. PCT/EP2012/076585
--

The International Searching Authority has determined that this international application contains multiple (groups of) inventions, as follows:

1. Claims 1, 2, 9-16

Compounds of formula (I), the use thereof and seeds containing same

2. Claim 3

Compounds of formulae VIIIa and VIIIb

3. Claim 4

Compounds of formulae VIIa and VIIb

4. Claim 5

Compounds of formula XVII

5. Claim 6

Compounds of formula Xa

6. Claim 7 (in part)

Compounds of formula XXVII

7. Claim 7 (in part)

Compounds of formula XXX

8. Claim 7 (in part)

Compounds of formula XIII

9. Claim 8

Compounds of formulae XXXIa, XXXIb and XXXIc

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/076585

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES		
INV. C07D261/08 C07D419/14 A01N43/32 ADD.		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE		
Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) C07D A01N		
Recherchierte, aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	
	Betr. Anspruch Nr.	
A	WO 2010/065579 A2 (DU PONT [US]; PASTERIS ROBERT JAMES [US]) 10. Juni 2010 (2010-06-10) in der Anmeldung erwähnt Seite 56, Zeilen 36,37; Seiten 72 und 73, Schemata 19 und 20;; Seite 2, Zeile 2 - Seite 2, Zeile 4; Ansprüche; Tabellen 1-6 -----	1,2,9-16
A	WO 2011/018415 A2 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; SULZER SARAH [CH]; LAMBERTH CLEMENS []) 17. Februar 2011 (2011-02-17) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Zeile 2 - Seite 1, Zeile 9; Ansprüche; Beispiele 1-192 -----	1,2,9-16
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen <input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :		
"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist		
"E" frühere Anmeldung oder Patent, die bzw. das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)		
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht		
"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist		
"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist		
"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden		
"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist		
"Z" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts	
25. Februar 2013	11/07/2013	
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Schmid, Arnold	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2012/076585

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 2010065579 A2	10-06-2010	AR 074411 A1	12-01-2011
		AU 2009322486 A1	10-06-2010
		CN 102227423 A	26-10-2011
		EP 2358709 A2	24-08-2011
		JP 2012510520 A	10-05-2012
		KR 20110091798 A	12-08-2011
		TW 201036966 A	16-10-2010
		US 2011224258 A1	15-09-2011
		UY 32285 A	30-06-2010
		WO 2010065579 A2	10-06-2010
		WO 2011018415 A2	17-02-2011
AU 2010283767 A1	23-02-2012		
CA 2768636 A1	17-02-2011		
CN 102471277 A	23-05-2012		
CR 20120064 A	22-03-2012		
EA 201200259 A1	28-09-2012		
EP 2464630 A2	20-06-2012		
JP 2013501745 A	17-01-2013		
KR 20120048010 A	14-05-2012		
TW 201114755 A	01-05-2011		
US 2012142698 A1	07-06-2012		
US 2013144064 A1	06-06-2013		
UY 32840 A	31-03-2011		
WO 2011018415 A2	17-02-2011		

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2012/076585**Feld Nr. II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)**

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein internationaler Recherchenbericht erstellt:

1. Ansprüche Nr. _____
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche diese Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich _____

2. Ansprüche Nr. _____
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, dass eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich _____

3. Ansprüche Nr. _____
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefasst sind.

Feld Nr. III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Diese Internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.

2. Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung solcher Gebühren aufgefordert.

3. Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr. _____

4. Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Dieser internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfasst:
1, 2, 9-16

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

- Der Anmelder hat die zusätzlichen Recherchegebühren unter Widerspruch entrichtet und die gegebenenfalls erforderliche Widerspruchsgebühr gezahlt.
- Die zusätzlichen Recherchegebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt, jedoch wurde die entsprechende Widerspruchsgebühr nicht innerhalb der in der Aufforderung angegebenen Frist entrichtet.
- Die Zahlung der zusätzlichen Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

Internationales Aktenzeichen PCT/ EP2012/ 076585

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1, 2, 9-16

Verbindungen der Formel (I), ihre Verwendung sowie Saatgut
enthaltend diese

2. Anspruch: 3

Verbindungen der Formeln VIIIA und VIIIB

3. Anspruch: 4

Verbindungen der Formeln VIIA und VIIb

4. Anspruch: 5

Verbindungen der Formel XVII

5. Anspruch: 6

Verbindungen der Formel Xa

6. Anspruch: 7(teilweise)

Verbindungen der Formel XXVII

7. Anspruch: 7(teilweise)

Verbindungen der Formel XXX

8. Anspruch: 7(teilweise)

Verbindungen der Formel XIII

9. Anspruch: 8

Verbindungen der Formeln XXXIa, XXXIb und XXXIc

フロントページの続き

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 0 1 N 43/40 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 P
A 0 1 N 43/78 (2006.01)	A 0 1 N 43/78	B
A 0 1 N 43/80 (2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 1
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	
A 0 1 N 25/00 (2006.01)	A 0 1 N 25/00	1 0 2

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

(74) 代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74) 代理人 230105223

弁護士 城山 康文

(72) 発明者 土屋 知己

フランス国、エフ - 6 9 0 0 9 ・ リヨン、リュ・ジャン・マリー・ルクレール・1 6

(72) 発明者 バスナイレ, ピエール

ドイツ国、4 0 2 2 5 ・ デュツセルドルフ、クリストフシュトラッセ・5 5

(72) 発明者 ホフマン, セバスチアン

ドイツ国、4 1 4 7 0 ・ ノイス、ツュブレツセンヴェーク・1 2

(72) 発明者 ザイツ, トーマス

ドイツ国、4 0 7 6 4 ・ ランゲンフェルト、リーテルバツハ・1 0 ・ ベー

(72) 発明者 ヒルブランド, シュテファン

ドイツ国、4 1 4 6 2 ・ ノイス、ローリンガー・シュトラッセ・2 2

(72) 発明者 ベンテイング, ユルゲン

ドイツ国、4 2 7 9 9 ・ ライヒリンゲン、アムセルシュトラッセ・7

(72) 発明者 シュミット, ジャン - ペーター

アメリカ合衆国、9 5 6 3 0 ・ カリフォルニア、フォルサム、プロスペクター・コート・1 3 0

(72) 発明者 クリストー, ピエール

フランス国、エフ - 6 9 0 0 9 ・ リヨン、リュ・マリートン・4

F ターム(参考) 4C054 AA02 CC04 DD01 EE01 FF31 FF38

4C056 AA01 AB01 AC01 AD01 AE02 AF06 FA09 FA11 FA13 FB01
FC01

4C063 AA03 AA05 BB01 BB07 CC62 CC81 DD10 EE01 EE03

4C086 AA01 AA02 AA03 BC82 GA02 GA07 GA09 GA10 MA01 MA04
NA14 ZB35 ZC61

4H011 AA01 BA01 BB09 BB10 BC01 BC03 BC06 BC07 BC17 BC20

DA02 DA15 DA16 DA17 DC05 DD03 DD04