

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2022-527836

(P2022-527836A)

(43)公表日 令和4年6月6日(2022.6.6)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 8 Q 2 B 0 2 2
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	C S P 4 C 0 6 5
A 0 1 N 25/00 (2006.01)	A 0 1 P 3/00	4 C 0 8 6
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 N 25/00	1 0 2 4 H 0 1 1
A 0 1 N 53/14 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 3

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全157頁) 最終頁に続く

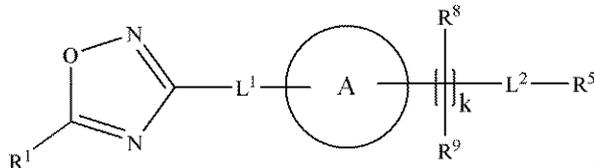
(21)出願番号	特願2021-559683(P2021-559683)	(71)出願人	519135367 ピーアイ インダストリーズ リミテッド P I I N D U S T R I E S L T D インド共和国 3 1 3 0 0 1 ラージヤ ターン, ウダイプル, ウダイサガー ロード
(86)(22)出願日	令和2年4月7日(2020.4.7)	(74)代理人	100103894 弁理士 家入 健
(85)翻訳文提出日	令和3年12月7日(2021.12.7)	(72)発明者	ブジャデ パラズ レイバン インド共和国 4 2 3 6 0 3 アフマドナ ガル- マハーラーシュトラ, アベガアン , タルカ- コパルガウン, ブジャデ バスティ, ハウス ナンバー- 1 8 9
(86)国際出願番号	PCT/IB2020/053296	(72)発明者	ナイク マルチ エヌ インド共和国 5 8 1 3 2 0 バトカル-
(87)国際公開番号	WO2020/208510		
(87)国際公開日	令和2年10月15日(2020.10.15)		
(31)優先権主張番号	201911014148		
(32)優先日	平成31年4月8日(2019.4.8)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	インド(IN)		
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA ,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く		最終頁に続く

(54)【発明の名称】 植物病原性真菌を制御又は予防するための新規オキサジアゾール化合物

(57)【要約】

本発明は、式(I)の化合物を開示する。

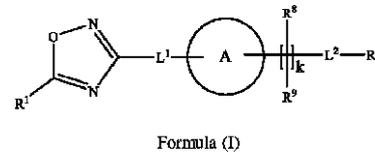
【化1】



式(I)

ここで、R¹、L¹、A、k、R⁸、R⁹、L²及びR⁵は、詳細な説明で定義されているとおりである。本発明はまた、式(I)の化合物を調製するためのプロセスを開示する。

【選択図】なし

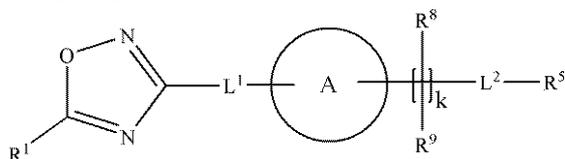


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物であって、

【化 1】



式 (I)

ここで、

R¹はC₁-C₂-ハロアルキルであり；

L¹は直接結合、-CR²R³-、-C(=W¹)-、-CR²R³C(=W¹)-、-O-、-S(=O)₀₋₂-、又は-NR^{4a}-であり、ここで、置換基の開始及び終了における表現「-」は、オキサジアゾール環又はAのいずれかへの結合点を示し；

W¹はO又はSであり；

Aは、1つ又は複数の橋頭 (bridgehead) にNを有する縮合ヘテロ二環式環であり；ここで、前記環は、任意に、1つの置換基RA又は複数の同種若しくは異種の置換基RAで置換されていてもよく；

RAは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-ジアルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、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-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-ジアルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ、C₁-C₆-ジアルキルアミノカルボニルオキシ、及び3~6員の炭素環又は複素環からなる群から選択され；ここで、前記3~6員の炭素環式又は複素環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₃-C₆-シクロアルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルアミノ、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-アルキルアミノカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ及びジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシからなる群から選択される1つ又は複数の同種の又は異種の置換基で任意に置換されていてもよく；

L²は直接結合であるか、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-S(=O)₀₋₂-、NR¹⁰-、

10

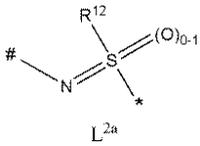
20

30

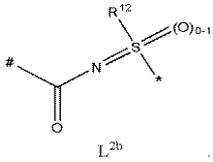
40

50

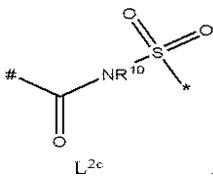
【化 2】



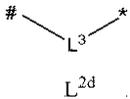
【化 3】



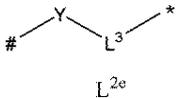
【化 4】



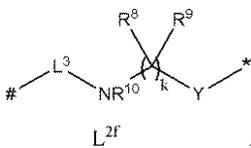
【化 5】



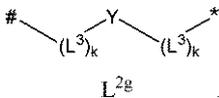
【化 6】



【化 7】



【化 8】



、-NR10-(C=W2)-NR10-、-NR10-S(=O)0-2-NR10-、-(C=W2)-NR10-NR10-、-S(=O)0-2-NR10-NR10-、-NR10-NR10-(C=W2)-、-NR10-NR10-S(=O)0-2-、-NR10-(C=W2)-NR10-NR10-、-NR10-S(=O)0-2-NR10-NR10-、-NR10-NR10-(C=W2)-NR10-、-NR10-NR10-S(=O)0-2-NR10-、-O(C=W2)-NR10-、及び-NR10-(C=W2)-O-からなる群から選択され；

Yは直接結合又は-NR10-、又は-O-、又は-S(O)0-2-又は-C(=NOR11)-であり；

kは0から4の範囲の整数であり、式「-」、「#」、及び「*」は、結合箇所を示し；

W2はO又はSであり；

10

20

30

40

50

L³は直接結合であるか、 $-CR^8aR^9a-$ 、 $-CR^8aR^9aC(=O)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-O-$ 、 $-S(=O)_{0-2}-$ 、 $-S(O)_{0-1}(=NR^{10})-$ 、 $-S(=N-CN)-$ 、 $-S(=N-NO_2)-$ 、 $-S(=N-COR^8a)-$ 、 $-S(=N-COOR^{11})-$ 、 $-S(=N-(S(=O)_2R^{12}))-$ 、 $-NR^{10}-$ 、 $-NR^{10}(C(=O))O-$ 及び $-CR^8a(=N)O-$ からなる群から選択され；

R¹⁰は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルケニル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、ピリジニル、C(=O)-(C₁-C₆-アルキル)、C(=O)-(C₁-C₆-アルコキシ)及び $-N(R^{10a})_2-$ からなる群からそれぞれ選択され；ここで、R^{10a}は、水素、ヒドロキシル、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル及びC₁-C₆-アルキルチオからなる群からそれぞれ選択され；R¹⁰の各置換基は、任意に、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₃-C₆-シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なるラジカルで置換されていてもよく；

R¹¹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₈-シクロアルケニル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロアリール-C₁-C₆-アルキル、フェニル及びナフチルからなる群から選択され；

R¹²は、水素、NR^{9R^h}からなる群から選択され、ここで、R⁹及びR^hは、水素、ヒドロキシル、シアノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₃-C₈-シクロアルキル；C(=O)-Rⁱからなる群からそれぞれ選択され、ここで、Rⁱは、水素、ハロゲン、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、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシ；C₁-8-アルキル-S(O)₀₋₂R^jからなる群から選択され、ここで、R^jは水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル；C₁-C₆-アルキル-(C=O)-Rⁱ、CRⁱ=NR^g、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-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル、C₄-C₈-シクロアルケニル、C₇-C₁₉-アラルキル、二環式C₅-C₁₂-アルキル、C₇-C₁₂-アルケニル及び縮合又は非縮合の又は二環式のC₃-C₁₈-炭素環式の環又は環系からなる群から選択され；ここで、炭素環式の環又は環系の1つ又は複数のC原子は、N、O、S(=O)₀₋₂、S(=O)₀₋₁、(=NR¹⁰)、C(=O)、C(=S)、C(=CR⁸R⁹)及びC=NR¹⁰で置換されていてもよく；

R¹²は、任意に、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、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-アルキルアミノカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ、5~11員のスピロ環、及び3~6員の炭素環又は複素環からなる群から選択される1つ又は複数の同一の又は異種の置換基で置換されていてもよく；

R⁸及びR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C

10

20

30

40

50

$1-C_6$ -アルキルチオ、 C_3-C_8 -シクロアルケニル、フェニル- C_1-C_6 -アルキル、ヘテロア
 リール- C_1-C_6 -アルキル、フェニル、ナフチル及び3～10員の飽和した又は部分的に不
 飽和である芳香族の単環式又は二環式の炭素環又は複素環からなる群からそれぞれ選択さ
 れ、ここで、ヘテロアリアル- C_1-C_6 -アルキルのヘテロアリアル及び複素環の環は、C、
 N、O及びS(O)₀₋₂で構成され；さらに、炭素環又は複素環のC環を構成する原子は、1
 つ又は複数のC(=O)及びC(=S)で置換でき；ここで、R⁸及びR⁹は、それぞれ非置換であ
 るか、1つのR^{8a}又はR^{9a}又は複数の同種の又は異種のR^{8a}又はR^{9a}で置換されており
 ；ただしここで、R^{8a}及びR^{9a}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、スルフ
 アニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C
 6 -ハロアルコキシ、 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、アミノ- C_1-C_6 -アルキル、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ、NHSO₂- C_1-C_6 -アル
 キル、-C(=O)- C_1-C_6 -アルキル、C(=O)- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスル
 ホニル、ヒドロキシ- C_1-C_6 -アルキル、-C(=O)-NH₂、C(=O)-NH(C_1-C_6 -アルキル)
 、 C_1-C_6 -アルキルチオ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルアミノ- C_1-C_6 -アルキル、
 ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ- C_1-C_6 -アルキル、アミノカルボニル- C_1-C_6 -アルキル及び
 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキルからなる群から選択され；又は
 R⁸及びR⁹は、それらが結合している原子とともに、C(=O)又はビニル基、又は飽和した
 単環式の3～7員環の複素環又は炭素環を形成し；ここで複素環の環メンバーには、C、N
 、O及びS(O)₀₋₂が含まれ；またビニル基、複素環又は炭素環は、非置換であるか、又は
 1つ又は複数の同一又は異なるR^{8b}で置換されており、R^{8b}は、ハロゲン、シアノ、ニ
 トロ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル
 、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 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、SO₂- C_1-C_6 -アルキル、NHSO₂- C_1-C_6 -アルキ
 ル、-C(=O)- C_1-C_6 -アルキル、C(=O)- C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルホ
 ニル、SO₂-C₆H₄CH₃及びSO₂-アリアルからなる群から選択され；
 R⁵は、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_3-C_8 -シクロアルキ
 ル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -
 シクロアルキル- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル- 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_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキル- C_3-C_8 -シクロアルキル
 - C_1-C_6 -アルキル、 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 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルコキシ- C_1-C_6
 -アルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキ
 ル- C_1-C_6 -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_1-C_6 -アルキルアミノ、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミ
 ノ、 C_1-C_6 -アルキルアミノ- C_1-C_6 -アルキル、ジ- C_1-C_6 -アルキルアミノ- C_1-C_6 -アル
 キル、 C_1-C_6 -ハロアルキルアミノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキルアミノ
 、 C_3-C_8 -シクロアルキルアミノ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -アルキルカルボニル、 C_1-C
 6 -ハロアルコキシ- C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ヒドロキシアルキル、 C_2-C_6 -ヒドロキシ
 アルケニル、 C_2-C_6 -ヒドロキシアルキニル、 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_6 -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 -アルキルカルボニルアルコキシ、 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、 C_1-C_6 -アルキルスル
 フィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハ
 ロアルキルスルホニル、 C_3-C_8 -シクロアルキルスルホニル、 C_3-C_8 -シクロアルキルス
 ルフィニル、トリ- C_1-C_6 -アルキルシリル、 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_1-C_6 -アルキルカルボニルチオ、 C_1-C_6 -アルキルス
 ルホニルオキシ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニルオキシ、 C_6-C_{10} -アリアルスルホニル
 オキシ、 C_6-C_{10} -アリアルスルフィニルオキシ、 C_6-C_{10} -アリアルスルホニル、 C_6-C_1

10

20

30

40

50

0-アリアルスルフィニル、C₆-C₁₀-アリアルチオ、C₁-C₆-シアノアルキル、C₂-C₆-アルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルキニル、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、C₂-C₆-アルケニルチオ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニルアミノ、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオカルボニル、C₃-C₈-シクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルケニル、C₁-C₆-アルキルチオカルボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ、ジ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニル-C₁-C₆-アルキルアミノ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニル、シアノ(C₁-C₆-アルコキシ)-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシスルホニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シク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、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆-シアノアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルカルボニルオキシ、C₂-C₆-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、C₁-C₆-シアノ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-シクロアルキル-C₁-C₆-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-C₆-アルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルスルホニルオキシ、C₁-C₆-シアノアルキルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルシクロアルキルオキシ、C₂-C₆-シアノアルケニルオキシ、C₂-C₆-シアノアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、スルフィルイミン、スルホキシミンからなる群から選択され、SF₅Z¹Q¹、R⁵は、任意に、1つ又は複数のR⁶で置換されていてもよく；

Z¹は直接結合、CR²aR³a、N、O、C(O)、C(S)、C(=CR²aR³a)又はS(O)₀₋₂であり；Q¹は、フェニル、ベンジル、ナフタレニル、5又は6員の芳香環、8~11員の芳香族多環式環系、8~11員の芳香族縮合環系、5又は6員のヘテロ芳香族環、8~11員の複素芳香族多環式環系、及び8~11員のヘテロ芳香族縮合環系からなる群から選択され；複素芳香族環のヘテロ原子は、N、O又はSから選択され、各環又は環系は、R¹³からそれぞれ選択される1つ又は複数の置換基で任意に置換されていてもよく；又は

Q¹は、3~7員の非芳香族炭素環、4、5、6又は7員の非芳香族複素環、8~15員の非芳

10

20

30

40

50

香族多環式環系、5～15員のスピロ環系、及び8～15員の非芳香族縮合環系からなる群から選択され；ここで、非芳香族環のヘテロ原子は、N、O又はS(O)₀₋₂から選択され、非芳香族炭素環又は非芳香族複素環又は環系のC環の原子は、それぞれC(O)、C(S)、C(=CR^{2b}R^{3b})又はC(=NR^{4b})で置換されていてもよく；さらに、各環又は環系は、R¹³からそれぞれ選択される1つ又は複数の置換基で任意で置換されていてもよく；

R²、R³、R^{2a}、R^{3a}、R^{2b}及びR^{3b}は、水素、ハロゲン、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、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群からそれぞれ選択され；

R²及びR³；R^{2a}及びR^{3a}；並びに/又はR^{2b}及びR^{3b}は、それらが結合している原子とともに、ハロゲン、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル又はC₁-C₂-アルコキシで任意に置換されていてもよい3～5員の非芳香族炭素環又は複素環を形成されていてもよく；

R^{4a}及びR^{4b}は、水素、シアノ、ヒドロキシ、NR^bR^c、(C=O)-R^d、S(O)₀₋₂R^e、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、トリ-C₁-C₆-アルキルアミノ及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群からそれぞれ選択され；

R^b及びR^cは、水素、ヒドロキシル、シアノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₃-C₈-ハロシクロアルキルからなる群からそれぞれ選択され；

R^dは、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、NR^bR^c、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₃-C₈-ハロシクロアルキルからなる群から選択される；

R^eは、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₃-C₈-ハロシクロアルキルからなる群から選択され；

R⁶とR¹³は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、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、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルケニル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、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-C₁-C₆-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、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ヒドロキシアルケニル、C₂-C₆-ヒドロキシアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-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-アルキルカルボニルアルコキシ、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、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、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、C₃-C₈-シクロアルキルスルフィニル、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル、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、C₁-C₆-アルキルカルボニルチオ、C₁-C₆-アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルキルスルフィニルオ

キシ、C₆-C₁₀-アリーールスルホニルオキシ、C₆-C₁₀-アリーールスルフィニルオキシ、C₆-C₁₀-アリーールスルホニル、C₆-C₁₀-アリーールスルフィニル、C₆-C₁₀-アリーールチオ、C₁-C₆-シアノアルキル、C₂-C₆-アルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルキニル、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、C₂-C₆-アルケニルチオ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニルアミノ、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオカルボニル、C₃-C₈-シクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルケニル、C₁-C₆-アルキルチオカルボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ、ジ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニル-C₁-C₆-アルキルアミノ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニル、シアノ(C₁-C₆-アルコキシ)-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシスルホニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シク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、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆-シアノアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルカルボニルオキシ、C₂-C₆-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、C₁-C₆-シアノ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-シクロアルキル-C₁-C₆-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-C₆-アルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルスルホニルオキシ、C₁-C₆-シアノアルキルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルシクロアルキルオキシ、C₂-C₆-シアノアルケニルオキシ、C₂-C₆-シアノアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、スルフィリミン、スルホキシミン及びSF₅からなる群からそれぞれ選択され；

及び/又はN-オキシド、金属錯体、異性体、多形又はそれらの農業上許容される塩である；

以下の化合物が式(I)の化合物の定義から除外されるという条件の付いている；

N-(2-メトキシエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド及びエチル6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート、

10

20

30

40

50

式 (I) の化合物。

【請求項 2】

R¹は、CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CF₂CF₃、CH₂F、CH₂CF₃、CHClCF₃、及びCCl₂CF₃からなる群から選択され、

L¹は直接結合、-CR²R³-であり；

Aは、1つ又は複数の橋頭 (bridgehead) にNを有する縮合ヘテロ二環式の環であり；ここで、前記環は、任意に、1つの置換基R^A又は複数の同種若しくは異種の置換基R^Aで置換されているもよく；

R^Aは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル及びC₁-C₆-ハロアルキルからなる群から選択され；

R⁸及びR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₁-C₆-アルキルチオからなる群からそれぞれ選択され；又は

R⁸及びR⁹は、それらが結合している原子とともに、C(=O)又はビニル基、又は飽和した単環式の3~7員の複素環又は炭素環を形成し、ここで複素環の環を構成する原子には、C、N、O及びS(O)₀₋₂が含まれ；さらにここで、ビニル基、複素環又は炭素環は、非置換であるか、又は1つの置換基R^{8b}又は複数の同種若しくは異種の置換基R^{8b}で置換されており、ここで、R^{8b}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群から選択される、

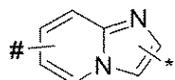
請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】

R¹は、CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CHClCF₃、及びCCl₂CF₃でからなる群から選択され、L¹は直接結合であり；

Aは、

【化 9】



であり、「#」及び「*」は付着点を示し、前記環は、任意に、1つの置換基R^A又は複数の同種若しくは異種の置換基R^Aで置換されているもよく；

R^Aは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₆-ヒドロキシアルキルからなる群から選択され；

R⁸及びR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群からそれぞれ選択され；；又は

R⁸とR⁹は、それらが結合している原子とともにC(=O)又はビニル基を形成する、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】

式 (I) の前記化合物が、

N-(3-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(4-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(p-トリル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

10

20

30

40

50

N-(ピリジン-3-イル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(3-フルオロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(ピリジン-4-イル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

アゼチジン-1-イル(7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタノン ;

N-(2-メトキシエチル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-イソブチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-ネオペンチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-イソペンチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(4-クロロベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(4-メトキシベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(3-クロロベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(3-メトキシベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(2-フルオロベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(4-(ジメチルアミノ)ベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(3,4-ジクロロベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

エチル7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸臭化水素酸塩 ;

3-(2-(((3-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

3-(2-(((4-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

3-(2-(((4-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

3-(2-(((4-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

3-(2-((フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

3-(2-(((2-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

5-(トリフルオロメチル)-3-(2-(((4-(トリフルオロメチル)フェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

3-(2-(((4-メトキシベンジル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;

10

20

30

40

50

- 3-(2-((プロピルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-クロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-メトキシフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-((フェニルスルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((2-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-メトキシベンジル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(プロピルスルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 5-(トリフルオロメチル)-3-(2-(((4-(トリフルオロメチル)フェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- モルフォリノ(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタノン ;
- N-(2-メトキシエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-イソブチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-シクロペンチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- (3-メトキシピロリジン-1-イル)(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタノン ;
- アゼチジン-1-イル(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタノン ;
- N-(シクロプロピルメチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-ベンジル-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(1-フェニルエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(1-シアノシクロプロピル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(2-メトキシエチル)-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(3-クロロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(3-メトキシベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(4-クロロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-イソブチル-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

- 6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル ;
- 3-(2-(エトキシメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- 4-メトキシ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- 4-クロロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ; 10
- 2-(4-クロロフェニル)-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)アセトアミド ;
- 3-クロロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- 3,4-ジクロロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ピコリンアミド ;
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)プロピオンアミド ; 20
- 4-(トリフルオロメトキシ)-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- 4-フルオロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- 2-フルオロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)オキサゾール-4-カルボキサミド ;
- 3-フルオロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ; 30
- 2-フェニル-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)アセトアミド ;
- 4-(ジメチルアミノ)-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- 3-メチル-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ブタンアミド ;
- 4-(トリフルオロメチル)-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ニコチンアミド ; 40
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イソニコチンアミド ;
- 3-(2-(((4-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((3-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 50

- N-(メチル(オキシ)(フェニル)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-フルオロフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ; 10
- N-((3-メトキシフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(ジメチル(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(1-オキシドテトラヒドロ-2H-1 6-チオピラン-1-イリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-クロロフェニル)(2-メトキシエチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ; 20
- N-(イソプロピル(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-メトキシフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(メチル(オキシ)(4-(トリフルオロメチル)フェニル)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ; 30
- N-((3,5-ジクロロフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(1-オキシドテトラヒドロ-1 6-チオフェン-1-イリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-プロモフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ; 40
- N-((3,4-ジクロロフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(4-オキシド-1,4 6-オキサチアン-4-イリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((2-メトキシフェニル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-メトキシピリジン-2-イル)(メチル)(オキシ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2- 50

イル)アセトアミド ;

N-((4-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;

N-(メチル(オキソ)(o-トリル)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;

N-((3-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;

(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ブチルアミド ;

イミノ(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ピバルアミド ;

4-メトキシ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

4-クロロ-2-フルオロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

3-フルオロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

3-クロロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

4-クロロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアミド ;

N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド ;

N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)-3-(トリフルオロメチル)ベンズアミド ;

2-フルオロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;

イミノ(フェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

イミノ(4-メトキシフェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

10

20

30

40

50

- (4-クロロフェニル)(イミノ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- (4-フルオロフェニル)(イミノ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(4-メトキシベンジル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- (4-クロロベンジル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ; 10
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(フェニル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(4-フルオロフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ; 20
- tert-ブチル((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(3,3,3-トリフルオロプロピル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)ジメチル- 6-スルファノン ; 30
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(シクロプロピルメチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(2,6-ジクロロフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- (2-クロロ-4-フルオロフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- (2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ; 40
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(4-メチルベンジル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(4-メトキシフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ベンジル((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ; 50

- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(イソオキサゾール-4-イルメチル)(メチル)- 6-スル
ファノン ;
- ((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-
オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)
- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(オキサゾール-4-イルメチル)- 6-スルファ
ノン ; 10
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(チアゾール-4-イルメチル)- 6-スルファノ
ン ;
- (2-クロロ-6-メトキシフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジア
ゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)- 6-スル
ファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(ピリミジン-5-yl)- 6-スルファノン ;
- (3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-
オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)
- 6-スルファノン ; 20
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(エチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ
[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(2-メトキシエチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
ピリジン-2-イル)-N-((4-メトキシベンジル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン
)アセトアミド ; 30
- N-((4-クロロベンジル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジ
フルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)
アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
ピリジン-2-イル)-N-(メチル((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)(オキ
ソ)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(フェニル)- 6-スルファンイリデン)アセトアミ
ド ; 40
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
ピリジン-2-イル)-N-((2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリ
デン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
ピリジン-2-イル)-N-((4-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン
)アセトアミド ;
- N-(tert-ブチル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオ
ロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセト
アミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a] 50

- ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)- 6-スルファンイ
 リデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(メチル((1-メチル-1H-イミダゾール-4-イル)メチル)(オキソ)-
 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(ジメチル(オキソ)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-((シクロプロピルメチル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデ
 ン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-((2,6-ジクロロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデ
 ン)アセトアミド ;
- N-((2-クロロ-4-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(7-(
 5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジ
 ン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリ
 デン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[
 1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)- 6-スルフ
 ファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(メチル(4-メチルベンジル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)ア
 セトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-((4-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン
)アセトアミド ;
- N-(ベンジル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメ
 チル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミ
 ド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリジン-3-イル)- 6-スルファンイリデン)アセ
 トアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-((イソオキサゾール-4-イルメチル)(メチル)(オキソ)- 6-スルフ
 ファンイリデン)アセトアミド ;
- N-(((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデ
 ン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,
 2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキサゾール-4-イルメチル)(オキソ)- 6-スルファンイ
 リデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]
 ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(チアゾール-4-イルメチル)- 6-スルファンイリ
 デン)アセトアミド ;
- N-((2-クロロ-6-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(7-(
 5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジ
 ン-2-イル)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]

- ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリミジン-5-イル)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- N-((3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(イソプロピル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(エチル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-((2-メトキシエチル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)アセトアミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(フェニル)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((4-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((4-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(m-トリル)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((3-(ジメチルアミノ)フェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(ジメチル(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(エチル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(tert-ブチル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((シクロプロピルメチル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(ベンジル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリミジン-5-イル)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(

- ピリダジン-4-イル)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピラジン-2-イル)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリジン-4-イル)- 6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(4-メトキシベンジル)(メチル)- 6-スルファノン ; 10
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- (4-クロロベンジル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(フェニル)- 6-スルファノン ; 20
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(4-フルオロフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- tert-ブチル((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(3,3,3-トリフルオロプロピル)- 6-スルファノン ; 30
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)ジメチル- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(シクロプロピルメチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(2,6-ジクロロフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- (2-クロロ-4-フルオロフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ; 40
- (2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(4-メチルベンジル)- 6-スルファノン ; 50

- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(4-メトキシフェニル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ベンジル((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(ピリジン-3-yl)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(イソオキサゾール-4-イルメチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(オキサゾール-4-イルメチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(チアゾール-4-イルメチル)- 6-スルファノン ;
- (2-クロロ-6-メトキシフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(ピリミジン-5-yl)- 6-スルファノン ;
- (3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(エチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(2-メトキシエチル)(メチル)- 6-スルファノン ;
- (4-メトキシベンジル)(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- メチル((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- (4-クロロベンジル)(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- メチル((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- メチル((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(フェニル)- 6-スルファノン ;
- (2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- (4-フルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- tert-ブチル(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

- (2-メトキシエチル)(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- (イソプロピルイミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((シクロプロピルメチル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((イソオキサゾール-4-イルメチル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((2-メトキシエチル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)(メチルイミノ)- 6-スルファノン ;
- (エチルイミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)イミノ)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)((3,3,3-トリフルオロプロピル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- ((4-メトキシベンジル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)イミノ)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((4-クロロベンジル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)イミダゾ)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)(フェニルイミノ)- 6-スルファノン ;
- ((2,4-ジフルオロフェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((4-フルオロフェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- (tert-ブチルイミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)(ピリジン-3-イリミノ)- 6-スルファノン ;
- (ベンジルイミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- ((4-メトキシフェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)- 6-スルファノン ;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)((4-メチルベンジル)イミノ)- 6-スルファノン ;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)((4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)イミノ)- 6-スルファノン ;

10

20

30

40

50

- ((2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-6-スルファノン;
- ((2-クロロ-4-フルオロフェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-6-スルファノン;
- ((2,6-ジクロロフェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-6-スルファノン;
- ((2-クロロ-6-メトキシフェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-6-スルファノン 10
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)((チアゾール-4-イルメチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)((オキサゾール-4-イルメチル)イミノ)-6-スルファノン;
- ((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)イミノ)((メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-6-スルファノン;
- メチル(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)(ピリミジン-5-イリミノ)-6-スルファノン 20
- ((3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)イミノ)(メチル)(2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)-6-スルファノン;
- (イソプロピルイミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- ((シクロプロピルメチル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- ((イソオキサゾール-4-イルメチル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン 30
- ((2-メトキシエチル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- メチル(メチルイミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- (エチルイミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- メチル(((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- メチル((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)((3,3,3-トリフルオロプロピル)イミノ)-6-スルファノン 40
- ((4-メトキシベンジル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- メチル(((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- ((4-クロロベンジル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- メチル(((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン 50

ル)- 6-スルファノン ;

メチル(フェニルイミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((2,4-ジフルオロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((4-フルオロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

(tert-ブチルイミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

メチル(ピリジン-3-イリミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

(ベンジルイミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((4-メトキシフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

メチル((4-メチルベンジル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

メチル((4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((2-クロロ-4-フルオロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((2,6-ジクロロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((2-クロロ-6-メトキシフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

メチル((チアゾール-4-イルメチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

メチル((オキサゾール-4-イルメチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

メチル(ピリミジン-5-イリミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

((3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)- 6-スルファノン ;

N-(メチル(オキソ)(フェニル)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-((4-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-((4-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサ

10

20

30

40

50

ミド ;

N-(メチル(オキソ)(m-トリル)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-((2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-((3-(ジメチルアミノ)フェニル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

10

N-(ジメチル(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(エチル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(tert-ブチル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-((シクロプロピルメチル)(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

20

N-(ベンジル(メチル)(オキソ)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(メチル(オキソ)(ピリミジン-5-イル)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(メチル(オキソ)(ピリダジン-4-イル)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

N-(メチル(オキソ)(ピラジン-2-イル)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

30

N-(メチル(オキソ)(ピリジン-4-イル)- 6-スルファンイリデン)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;

メチル(フェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

(4-クロロフェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

(4-メトキシフェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

メチル(m-トリル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

40

(2-フルオロフェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

(2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

(3-(ジメチルアミノ)フェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

ジメチル((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)- 6-スルファノン ;

エチル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダ

50

ル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 ベンジル(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミ
 ダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 (4-メトキシフェニル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール
 -3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 メチル(4-メチルベンジル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-
 イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 メチル(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキ
 サジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファ
 ノン ;
 (2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1
 ,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-
 スルファノン ;
 (2-クロロ-4-フルオロフェニル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサ
 ジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノ
 ン ;
 (2,6-ジクロロフェニル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾー
 ル-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 (2-クロロ-6-メトキシフェニル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサ
 ジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノ
 ン ;
 メチル(チアゾール-4-イルメチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾ
 ール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 メチル(オキサゾール-4-イルメチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジア
 ザール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン ;
 ((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2
 ,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-ス
 ルファノン ;
 メチル(ピリミジン-5-イル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-
 イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン及び
 (3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)(((6-(5-(トリフルオロメチル)-1
 ,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-
 スルファノンから選択される、

10

20

30

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】

前記化合物が殺菌剤として使用される、

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物と、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、生物農薬
 、除草剤、保護剤、植物成長調節剤、抗生物質、肥料と栄養素からなる群から選択される
 少なくとも 1 つのさらなる殺虫活性物質とを含む、
 組み合わせ。

40

【請求項 7】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物及び少なくとも 1 つの農薬学的に許容される補助剤を
 含む、植物病害を防除又は予防するための、
 組成物。

【請求項 8】

前記組成物が、少なくとも 1 つの追加の活性成分をさらに含んでいてもよい、
 請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

50

前記組成物が種子に適用され、前記組成物中の式 (I) の化合物の量が、種子 100 kg あたり 0.1 g a.i. から 10 kg a.i. の範囲である、
請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記植物病害は、*Hemileia vastatrix* (コーヒーさび病)、*Uromyces appendiculatus/fabae/phaseoli* (豆のさび病)、小麦、大麦又はライ麦に対する *P. tritricina* (赤さび病 (brown or leaf rust))、*P. striiformis* (黄さび病 (stripe or yellow rust))、*P. Hordei* (矮性さび病 (dwarf rust))、*P. graminis* (黒さび病 (stem or black rust)) 及び *P. recondita* (赤さび病 (brown or leaf rust)) から選択されるさまざまな植物の *Puccinia* 属 (さび病)、並びに、さまざまな植物に対する *Phakopsora* 属 (*Phakopsora* spp.)、特に大豆に対する *Phakopsora pachyrhizi* 及び *P. meibomia* (大豆さび)、からなる群から選択されるさび病病原体によって引き起こされる、

10

請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 11】

植物病原性真菌を制御又は予防するための方法であって、真菌又は真菌の攻撃から保護されるべき材料、植物、植物部分、その場所、土壌若しくは種子を、有効量の、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物の少なくともいずれか又は請求項 6 に記載の組み合わせ、又は請求項 7 に記載の組成物で処理することを含む、

20

方法。

【請求項 12】

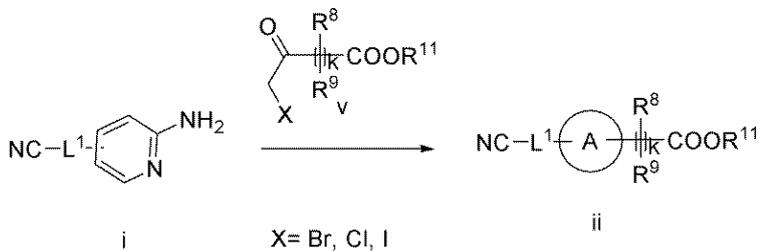
農作物及び / 又は園芸作物における植物病原性微生物による植物の寄生を制御又は防止するための方法であって、有効量の、請求項 1 に記載の式 (I) の少なくともいずれか又は請求項 6 に記載の組み合わせ又は請求項 7 に記載の組成物が、植物の種子に施用される、

【請求項 13】

以下の工程を含む、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法であって；

a) 式 i の化合物を式 v の α -ハロカルボニル化合物と反応させて、式 ii の化合物を得て；

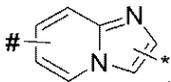
【化 10】



30

ここで、L¹ は直接結合であり、A は

【化 11】

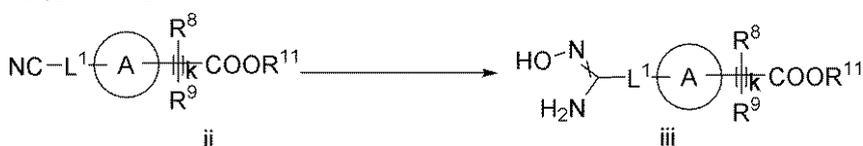


40

であり；

b) 式 ii の化合物をヒドロキシルアミンと反応させて式 iii の化合物を得て；

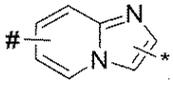
【化 12】



ここで、L¹ は直接結合であり、A は

50

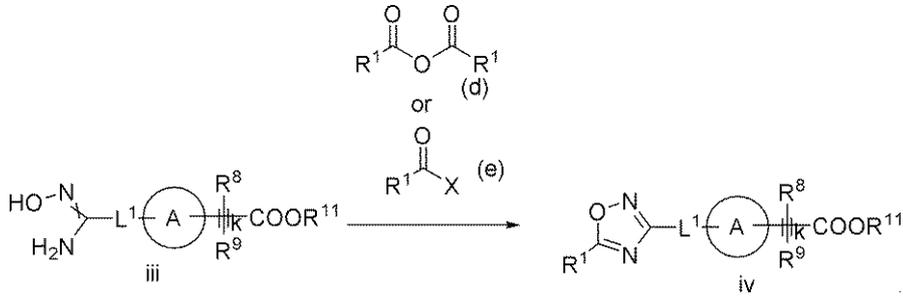
【化 1 3】



であり、

c) 式 iii の化合物を式 (d) の酸無水物又は式 (e) の酸塩化物化合物と反応させて、式 iv の化合物を得て；

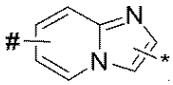
【化 1 4】



10

ここで、L1 は直接結合であり、A は

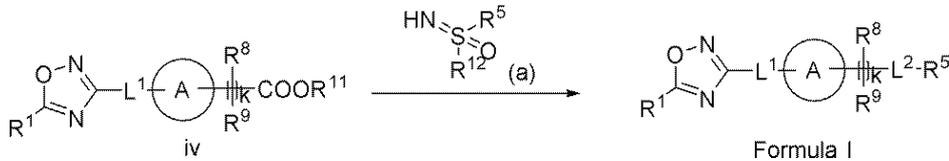
【化 1 5】



であり、さらにXはCl、Br又はIであり；

d) 式 iv の化合物を式 (a) のスルホキシミン化合物と反応させて式 (I) (Formula I) の化合物を得る；

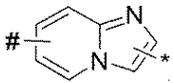
【化 1 6】



30

ここで、L1 は直接結合であり、A は

【化 1 7】



である、

方法。

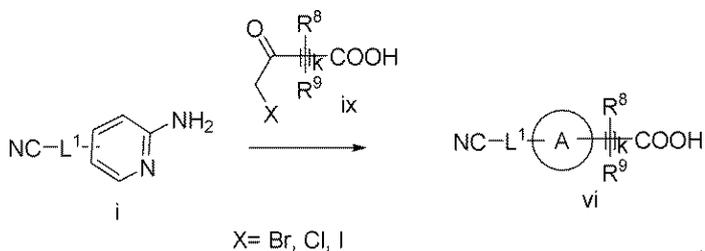
【請求項 1 4】

以下の工程を含む、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法：

40

a) 式 i の化合物を式 ix の化合物と反応させて式 vi の化合物を得て；

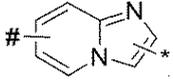
【化 1 8】



ここで、L1 は直接結合であり、A は

50

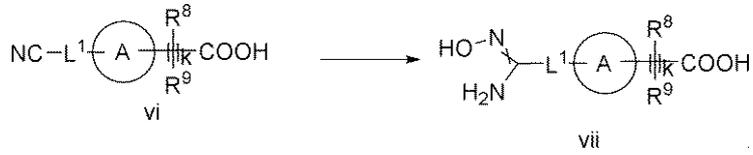
【化 1 9】



であり、

b) 式viの化合物をヒドロキシルアミンと反応させて、式viiの化合物を得て；

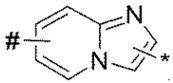
【化 2 0】



10

ここで、L1は直接結合であり、Aは

【化 2 1】

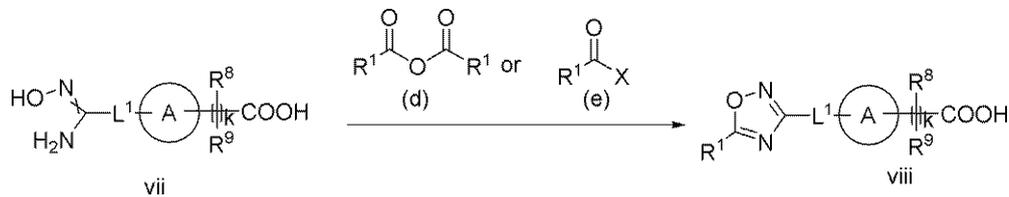


であり、

c) 式viiの化合物を式(d)の酸無水物又は式(e)の酸塩化物化合物と反応させて、式viiiの化合物を得て；

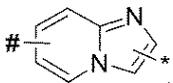
20

【化 2 2】



ここで、L1は直接結合であり、Aは

【化 2 3】

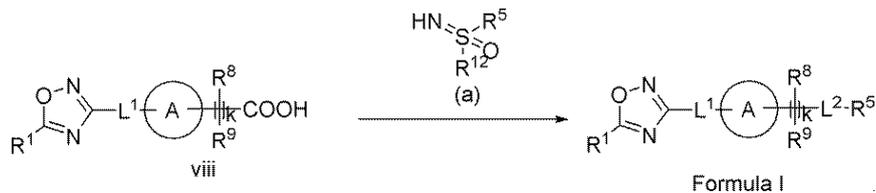


であり、さらにXはCl、Br又はIであり；

d) 式viiiの化合物を式(a)の化合物と反応させて式(I) (Formula I)の化合物を得る；

30

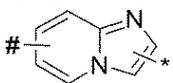
【化 2 4】



40

ここで、L1は直接結合であり、Aは

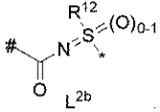
【化 2 5】



であり、さらにL2は

50

【化 2 6】



である、
方法。

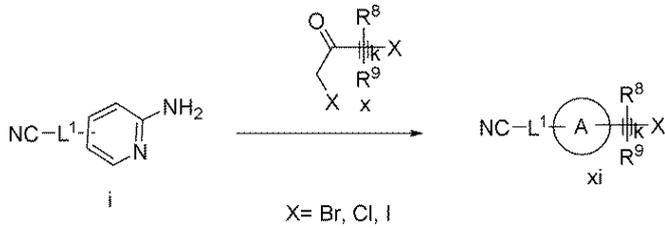
【請求項 1 5】

以下の工程を含む、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法であって；

a) 式 i の化合物を式 x の化合物と反応させて、式 xi の化合物を得て；

10

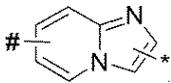
【化 2 7】



ここで、L1 は直接結合であり、A は

【化 2 8】

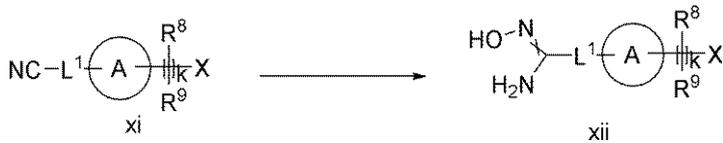
20



であり、

b) 式 xi の化合物をヒドロキシルアミンと反応させて、式 xii の化合物を得て；

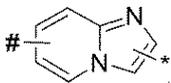
【化 2 9】



30

ここで、L1 は直接結合であり、A は

【化 3 0】

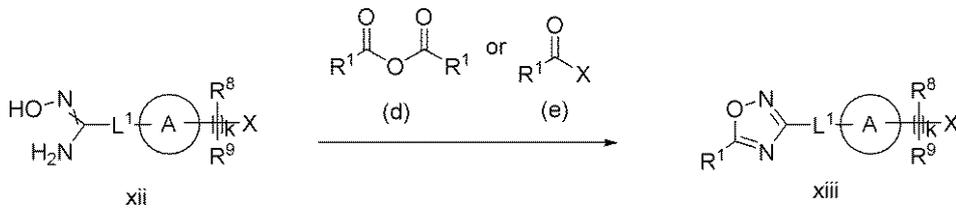


であり、さらに X は Cl、Br 又は I であり；

c) 式 xii の化合物を式 (d) の酸無水物又は式 (e) の酸塩化物化合物と反応させて、式 xiii の化合物を得て；

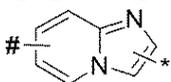
【化 3 1】

40



ここで、L1 は直接結合であり、X は Cl、Br 又は I であり、A は

【化 3 2】

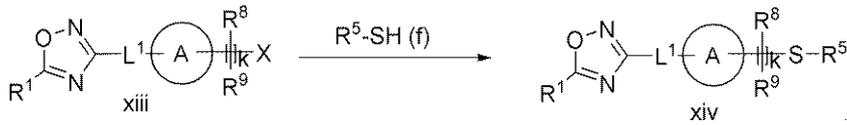


50

であり；

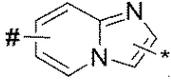
d) 式xiiiの化合物を式(f)の化合物と反応させて、式xivの化合物を得て；

【化33】



ここで、L1は直接結合であり、Aは

【化34】

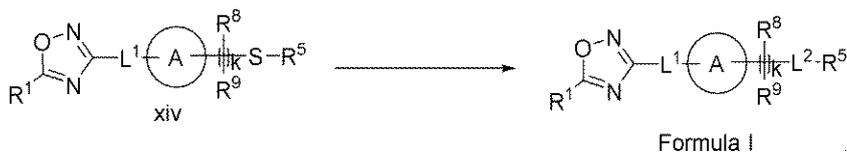


であり、

さらにXはCl、Br又はIであり；

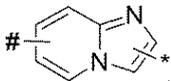
e) 式xivの化合物を適切な酸化剤で酸化して式(I) (Formula I)を得る；

【化35】



ここで、L1は直接結合であり、Aは

【化36】



であり、L2は-S(=O)0-2-である；

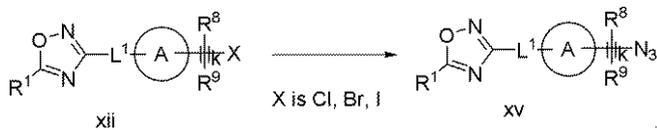
方法。

【請求項16】

以下の工程を含む、請求項1に記載の式(I)の化合物を調製する方法であって；

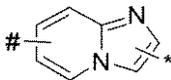
a) 式xiiの化合物を適切なアルカリ金属アジド化合物と反応させて、式xvの化合物を得て；

【化37】



ここで、L1は直接結合であり、Aは

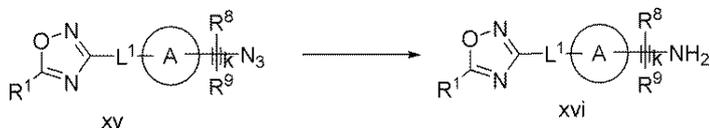
【化38】



であり；

b) 式xvの化合物を適切な還元剤と反応させて、式xviの化合物を得て；

【化39】



ここで、L1は直接結合であり、Aは

10

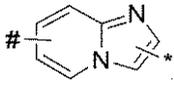
20

30

40

50

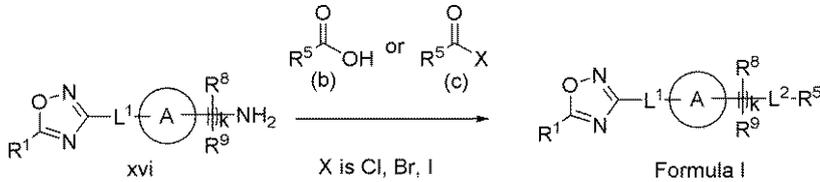
【化 4 0】



であり；

c) 式 xvi の化合物を式 (b) のカルボン酸又は式 (c) のカルボン酸塩化物化合物と反応させて、式 (I) (Formula I) の化合物を得る；

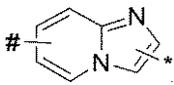
【化 4 1】



10

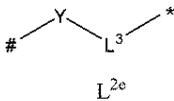
ここで、L1 は直接結合であり、A は

【化 4 2】



であり、L2 は

【化 4 3】



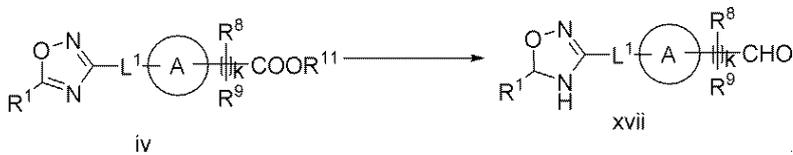
であり、ただし Y は -NR¹⁰ であり、L³ は C(=O)- である；
方法。

【請求項 17】

以下の工程を含む、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物を調製する方法であって；

a) 式 iv の化合物を適切な還元試薬と反応させて、式 xvii の化合物を得て；

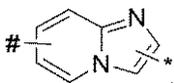
【化 4 4】



30

ここで、L1 は直接結合であり、A は

【化 4 5】



であり、

b) 式 xvii の化合物を適切な酸化剤と反応させて、式 xviii の化合物を得て；

【化 4 6】

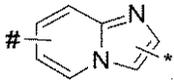


ここで、L1 は直接結合であり、A は

40

50

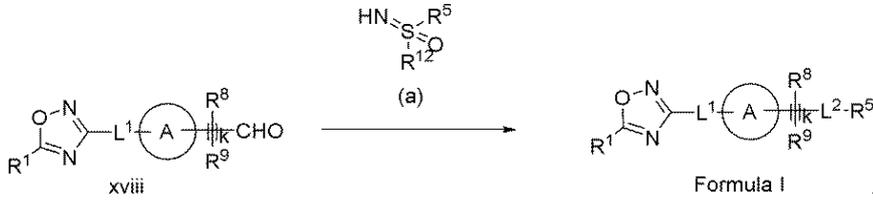
【化 4 7】



であり、

c) 式 xviii の化合物を式 (a) のスルホキシミン化合物と反応させて、式 (I) (Formula I) の化合物を得る；

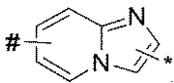
【化 4 8】



10

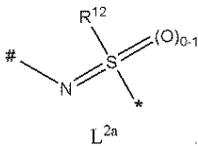
ここで、L1 は直接結合であり、A は

【化 4 9】



であり、L2 は

【化 5 0】



20

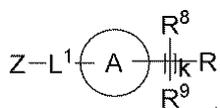
である、

方法。

【請求項 1 8】

式 (B) の化合物；

【化 5 1】



30

式 (B)

ここで、

Z は

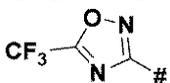
【化 5 2】



40

であり、又は

【化 5 3】



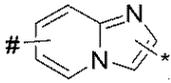
であり；ここで、「#」は L1 への接続点を示であり；

L1 は直接結合であり、

A は

50

【化 5 4】



であり、ここで、「#」はL1への接続点を示であり；

R⁸及びR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル及びC₃-C₈-シクロアルキル；
からなる群からそれぞれ選択され；

kは0から1の範囲の整数であり；

Rは水素、アジド、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、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、アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、NH₂SO₂-C₁-C₆-アルキル、-S(=O)(=NH)-C₁-C₆-アルキル；-C(=O)-C₁-C₆-アルキル、C(=O)-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルスルホニル、ヒドロキシ-C₁-C₆-アルキル、-C(=O)-NH₂、C(=O)-NH(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル及びC₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルからなる群から選択され；

ただし以下の化合物が式(I)の化合物の定義から除外されるという条件の付く；

エチル(Z)-2-(6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート、6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸及びエチル(Z)-2-(7-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート、

式(B)の化合物。

【請求項19】

式(B)の前記化合物が、

7-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸；

エチル 2-(7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾール[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート；

7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸；

7-(5-(トリフルオロメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

7-(5-(トリフルオロメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド；

3-(2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール；

3-(2-(アジドメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール；

エチル2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート；

6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸；

エチル2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート；

6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

6-(5-(トリフルオロメチル)-4,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

3-(2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-

4-オキサジアゾール；

2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド；

3-(2-(アジドメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール及び

イミノ(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノンから選択される、

請求項1に記載の式(B)の化合物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、植物病原性真菌と戦うのに有用な新規オキサジアゾール化合物、それらの組み合わせ、及び新規オキサジアゾール化合物を含む組成物に関する。本発明はまた、植物病原性真菌を制御又は予防するための方法に関する。

【背景技術】

【0002】

オキサジアゾールはすでに文献に開示されている。例えば、JPS5665881, JPS63162680, JPS6296480, JPS6051188, WO2005051932, EP3165093, EP3167716, EP3165093, WO2017076740, WO2017102006, WO2017110861, WO2017110862, WO2017110864, WO2017157962, WO2017174158, WO2017198852, WO2017207757, WO2017211650, WO2017211652, WO2017220485, WO2017072247, WO2017076742, WO2017076757, WO2017076935, WO2018015447, WO2018065414, WO2018118781, WO2018187553及びWO2018202491など様々なオキサジアゾールが開示されている。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

上記の文献で報告されているオキサジアゾール化合物は、特定の面で不利な点がある。例えば、適用範囲が狭いことや、特に低い適用率で十分な殺菌活性がないことなどが挙げられる。

【0004】

したがって、本発明の目的は、植物病原性真菌に対して改善された/増強された活性及び/又はより広い活性スペクトルを有する化合物を提供することである。

【0005】

この目的は、植物病原性真菌を制御又は予防するための本発明の式(I)の化合物を使用することによって達成される。

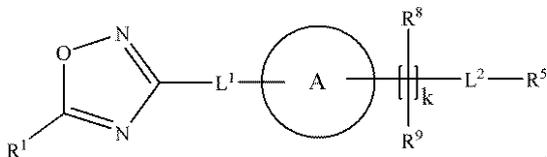
【課題を解決するための手段】

【0006】

本発明は、式Iの新規オキサジアゾールに関する。

【0007】

【化1】



式(I)

R¹, L¹, A, k, R⁸, R⁹, L²及びR⁵は、詳細な説明で定義されている通りである。本発明はまた、式(I)の化合物を調製するためのプロセスに関する。

【0008】

式(I)の化合物は、改善された殺菌活性、より広いスペクトルの生物学的活性、より低

10

20

30

40

50

い適用率、より好ましい生物学的又は環境的特性、又は増強された植物適合性のいずれかにおいて、文献に報告された化合物よりも有利であることが見出された。

【0009】

本発明はさらに、本発明の式(I)の化合物と、戦うことが困難な植物病原性真菌を効果的に制御又は防止するための少なくとも1つのさらなる殺虫活性物質とを含む組み合わせに関する。

【0010】

本発明はさらに、式(I)の化合物又は式(I)の化合物をさらなる殺虫活性物質と組み合わせて含む組成物に関する。

【0011】

本発明はさらに、植物病害、特に植物病原性真菌を制御及び/又は予防するための式(I)の化合物、それらの組み合わせ又は組成物の方法及び使用に関する。

【発明を実施するための形態】

【0012】

定義

【0013】

本開示で使用される用語について本明細書で提供される定義は、例示のみを目的とし、本開示で開示される本発明の範囲を限定するものではない。

【0014】

本明細書で使用する用語「を含む」、「含む」、「含めている」、「含まれている」、「有する」、「有している」、「含有する」、「含有している」、「によって特徴付けられる」、又はそれらの他の変形は、意図されている明示的に示された制限を条件として、非独占的な包含をカバーする。例えば、要素のリストを含む構成、混合、プロセス、又は方法は、必ずしもそれらの要素だけに限られず、そのような構成、混合、プロセス、又は方法に明示的にリスト又は固有でない他の要素を含む場合がある。

【0015】

移行語句「からなる」は、指定されていない要素、工程、又は成分を除外する。特許請求に記載されている場合、通常、それに関連する不純物を除いて、濃縮されたもの以外の材料を含めることに対するクレームが終了される。「からなる」という語句が前文の直後に続くのではなく、特許請求の本文の語句に現れているとき、その語句に記載されている要素のみを制限する。他の要素は、全体として特許請求から除外されない。

【0016】

「から本質的になる」という移行語句は、文字通り開示されたものに加えて、材料、工程、特徴、コンポーネント又は要素を含む組成又は方法を定義するために使用される。ただし、これらの追加の材料、工程、機能、成分、又は要素は、クレームされた発明の基本的かつ新規な特性に実質的に影響を与えないものとする。「から本質的になる」という用語は、「含む」と「からなる」の間の中間的な位置を占める。

【0017】

また、そうではないと明示的に記載していない限り、「又は」は包括的な「又は」を指し、排他的な「又は」を指すものではない。例えば、条件A「又は」Bは、次のいずれかによって満たされる。条件A「又は」Bは、Aが正しく(又は存在し)、Bが誤っている(又は存在しない)、Aが誤っていて(又は存在しない)、Bが正しい(又は存在し)、及びAとBの両方が正しい(又は存在する)ことを表す。

【0018】

本開示において言及されるように、「無脊椎動物害虫」という用語は、害虫として経済的に重要な節足動物、腹足類及び線虫を含む。「節足動物」という用語には、昆虫、ダニ、クモ、サソリ、ムカデ、ヤスデ、オカダンゴムシ、コムカデ類が含まれる。「腹足類」という用語には、カタツムリ、ナメクジ、その他のマイマイが含まれる。「線虫」という用語は、線虫門の生物を指す。「蠕虫」という用語には、回虫、フィラリア、植物食性線虫(線虫)、吸虫(テマトダ)、鉤頭動物、糸虫(サナダムシ)が含まれる。

10

20

30

40

50

【0019】

本開示の文脈において、「無脊椎動物の害虫駆除」は、無脊椎動物の害虫の発生の阻害（死亡率、摂食の減少、及び/又は交尾の混乱を含む）を意味し、関連する表現は同様に定義される。

【0020】

「農業」という用語は、食品、飼料、繊維などの畑作物の生産を指し、トウモロコシ、大豆、その他のマメ科植物、米、穀物（小麦、オート麦、大麦、ライ麦、米、トウモロコシなど）、葉の多い野菜（レタス、キャベツ、その他のトウモロコシ作物など）、結実野菜（トマト、コショウ、ナス、アブラナ科植物、キュウリなど）、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿、木の実（ナシ状果、核果、柑橘類）、小さな果物（ベリー、チェリー）及び他の特殊作物（例えば、セイヨウアブラナ（canola）、ヒマワリ、オリーブ）の栽培を含む。

10

【0021】

「非農業」という用語は、園芸作物（例えば、畑で栽培されていない温室、苗床又は観賞植物）、住宅、農業、商業及び工業構造、芝（例えば、芝地、牧草地、ゴルフコース、芝生、運動場など）、木製品、貯蔵製品、農林及び植生管理、公衆衛生（すなわち人間）及び動物の健康（例えば、ペット、家畜及び家禽などの家畜、そのような非家畜野生生物として）

【0022】

非農業的用途には、保護される動物に、典型的には獣医用に処方された組成物の形態で、寄生虫的に有効な（すなわち生物学的に有効な）量の本発明の化合物を投与することによって無脊椎動物の寄生害虫から動物を保護することが含まれる。本開示及び特許請求の範囲で言及されるように、「寄生虫駆除」及び「寄生虫駆除的に」という用語は、害虫から動物を保護するための無脊椎動物の寄生害虫に対する観察可能な効果を指す。寄生虫駆除効果は、通常、標的となる無脊椎動物の寄生害虫の発生又は活動の減少に関連している。害虫に対するそのような影響には、壊死、死、成長の遅延、移動性の低下又は宿主動物上又は宿主動物内に留まる能力の低下、摂食の低下及び繁殖の阻害が含まれる。無脊椎動物の寄生害虫に対するこれらの効果は、動物の寄生虫の侵入又は感染の制御（予防、減少又は排除を含む）を提供する。

20

【0023】

本開示の化合物は、純粋な形態で、又は立体異性体又は構造異性体などの異なる可能な異性体形態の混合物として存在し得る。さまざまな立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、キラル異性体、アトロプ異性体、配座異性体、回転異性体、トートマー、光学異性体、多形体、及び幾何異性体が含まれる。これらの異性体の任意の所望の混合物は、本開示の特許請求の範囲内に入る。当業者は、1つの立体異性体が、他の異性体と比較して濃縮されたとき、又は他の異性体から分離されたときに、より活性であり得、及び/又は有益な効果を示し得ることを理解するであろう。さらに、当業者は、前記異性体を分離、濃縮、及び/又は選択的に調製するためのプロセス又は方法又は技術を知っている。

30

【0024】

ここで、説明に使用される様々な用語の意味を説明する。

40

【0025】

単独で、又は「アルキルチオ」又は「ハロアルキル」又は-N（アルキル）又はアルキルカルボニルアルキル又はアルキルホスホニルアミノなどの複合語で使用される「アルキル」という用語は、直鎖又は分岐C1からC24アルキル、好ましくはC1からC15アルキルより好ましくはC1からC10アルキル、最も好ましくはC1からC6アルキルが含まれる。アルキルの非限定的な例には、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

50

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-メチルプロピル又は異なる異性体が含まれる。例えばアルキルシクロアルキルのように、アルキルが複合置換基の末端にある場合、開始点の複合置換基の一部、例えばシクロアルキルは、アルキルによって同一又は異なって独立して一置換又は多置換され得る。同じことが、他のラジカル、例えば、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシル、ハロゲン、カルボニル、カルボニルオキシなどが末端にある複合置換基にも当てはまる。

【0026】

単独で又は複合語で使用される「アルケニル」という用語は、直鎖又は分岐C2からC24アルケン、好ましくはC2からC15アルケン、より好ましくはC2からC10アルケン、最も好ましくはC2からC6アルケンを含む。アルケンの非限定的な例には、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-プロペニル及び異なる異性体。が含まれる。「アルケニル」には、1,2-プロパジエニル及び2,4-ヘキサジエニルなどのポリエンも含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルケニル、例えばハロアルケニルなどにも適用される。

【0027】

アルキンの非限定的な例には、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-ジメチル-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-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、3,3-ジメチル-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-プロピニル及び異なる異性体が含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルキニル、例えばハロ

10

20

30

40

50

アルキニルなどにも適用される。「アルキニル」という用語はまた、2,5-ヘキサジイニルなどの複数の三重結合から構成される部分を含むことができる。

【0028】

「シクロアルキル」という用語は、閉環して環を形成するアルキルを意味する。非限定的な例には、シクロプロピル、シクロペンチル及びシクロヘキシルが含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのシクロアルキル、例えばシクロアルキルアルキルなどにも適用される。

【0029】

「シクロアルケニル」という用語は、単環式の部分的に不飽和のヒドロカルビル基を含む環を形成するために閉じられたアルケニルを意味する。非限定的な例には、シクロプロベニル、シクロペンテニル及びシクロヘキセニルが含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのシクロアルケニル、例えばシクロアルケニルアルキルなどにも適用される。

10

【0030】

「シクロアルキニル」という用語は、単環式の部分的に不飽和の基を含む環を形成するために閉じたアルキニルを意味する。非限定的な例には、シクロプロピニル、シクロペンチニル及びシクロヘキシニルが含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのシクロアルキニル、例えばシクロアルキニルアルキルなどにも適用される。

【0031】

「シクロアルコキシ」、「シクロアルケニルオキシ」などの用語は、同様に定義される。シクロアルコキシの非限定的な例には、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が含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのシクロアルコキシ、例えばシクロアルコキシアルキルなどにも適用される。

20

【0032】

「ハロゲン」という用語は、単独で、又は「ハロアルキル」などの複合語で、フッ素、塩素、臭素、又はヨウ素を含む。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で使用される場合、前記アルキルは、同じであっても異なってもよいハロゲン原子で部分的又は完全に置換されていてもよい。「ハロアルキル」の非限定的な例には、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-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、1,1-ジクロロ-2,2,2-トリフルオロエチル、及び1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イルが含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのハロアルキル、例えばハロアルキルアミノアルキルなどにも適用される。

30

【0033】

「ハロアルケニル」、「ハロアルキニル」という用語は、アルキル基の代わりに、アルケニル及びアルキニル基が置換基の一部として存在することを除いて、同様に定義される。

40

【0034】

「ハロアルコキシ」という用語は、直鎖又は分岐アルコキシ基を意味し、これらの基の水素原子の一部又はすべては、上記で指定されたようにハロゲン原子で置換され得る。ハロアルコキシの非限定的な例には、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

50

-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-2-オキシが含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのハロアルコキシ、例えばハロアルコキシアルキルなどにも適用される。

【0035】

「ハロアルキルチオ」という用語は、直鎖又は分岐アルキルチオ基を意味し、これらの基の水素原子の一部又はすべては、上記で指定されたようにハロゲン原子で置換され得る。ハロアルキルチオの非限定的な例には、クロロメチルチオ、ブromo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romo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-2-イルチオが含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、ハロアルキルチオが複合置換基の一部である場合にも適用される。例えば、ハロアルキルチオアルキルなど。

10

【0036】

「ハロアルキルスルフィニル」の非限定的な例には、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 及び $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ が含まれる。「ハロアルキルスルホニル」の非限定的な例には、 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 及び $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ が含まれる。

20

【0037】

「ヒドロキシ」という用語は、 $-\text{OH}$ を意味し、アミノは $-\text{NR}_2$ を意味し、ここで、Rは、H又はアルキルなどの任意の可能な置換基であり得る。カルボニルは $-\text{C}(=\text{O})-$ を意味し、カルボニルオキシは $-\text{OC}(=\text{O})-$ を意味し、スルフィニルは SO を意味し、スルホニルは $\text{S}(\text{O})_2$ を意味する。

【0038】

単独で又は複合語で使用される「アルコキシ」という用語は、C1からC24アルコキシ、好ましくはC1からC15アルコキシ、より好ましくはC1からC10アルコキシ、最も好ましくはC1からC6アルコキシを含む。アルコキシの例には、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-ジメチルエトキシ、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-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、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-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、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-メチルプロポキシとさまざまな異性体が含まれる。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルコキシ、例えばハロアルコキシ、アルキルアルコキシなどにも適用される。

30

40

【0039】

「アルコキシアルキル」という用語は、アルキル上のアルコキシ置換を意味する。「アルコキシアルキル」の非限定的な例には、 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が含まれる。

【0040】

「アルコキシアルコキシ」という用語は、アルコキシ上のアルコキシ置換を意味する。

【0041】

「アルキルチオ」という用語は、以下のような分岐又は直鎖アルキルチオ部分を含む。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

50

チルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ、1,1-ジメチルエチルチオ、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-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1,1-ジメチルプロピルチオ、1,2-ジメチルプロピルチオ、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-ジメチルブチルチオ、1,2-ジメチルブチルチオ、1,3-ジメチルブチルチオ、2,2-ジメチルブチルチオ、2,3-ジメチルブチルチオ、3,3-ジメチルブチルチオ、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及びさまざまな異性体。

【0042】

ハロシクロアルキル、ハロシクロアルケニル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルコキシアルキル、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、ハロアルキルカルボニル、シクロアルキルカルボニル、ハロアルコキシアルキルなどは、上記の例と同様に定義される。

【0043】

「アルキルチオアルキル」という用語は、アルキル上のアルキルチオ置換を意味する。「アルキルチオアルキル」の非限定的な例には $-\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{H}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ が含まれる。「アルキルチオアルコキシ」は、アルコキシ上のアルキルチオ置換を意味する。「シクロアルキルアルキルアミノ」という用語は、アルキルアミノ上のシクロアルキル置換を意味する。

【0044】

「アルコキシアルコキシアルキル」、「アルキルアミノアルキル」、「ジアルキルアミノアルキル」、「シクロアルキルアミノアルキル」、「シクロアルキルアミノカルボニル」などの用語は、「アルキルチオアルキル」又は「シクロアルキルアルキルアミノ」と同様に定義される。

【0045】

「アルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル基($-\text{CO}-$)を介して骨格に結合したアルコキシ基である。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルコキシカルボニル、例えばシクロアルキルアルコキシカルボニルなどにも適用される。

【0046】

「アルコキシカルボニルアルキルアミノ」という用語は、アルキルアミノ上のアルコキシカルボニル置換を意味する。「アルキルカルボニルアルキルアミノ」は、アルキルアミノ上のアルキルカルボニル置換を意味する。アルキルチオアルコキシカルボニル、シクロアルキルアルキルアミノアルキルなどの用語は、同様に定義される。

【0047】

「アルキルスルフィニル」の非限定的な例には、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、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

10

20

30

40

50

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及び異なる異性体が含まれる。「アリアルスルフィニル」という用語は、Ar-S(O)を含み、ここで、Arは、任意のカルボキシル又はヘテロ環であり得る。この定義は、他に特に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルキルスルフィニル、例えばハロアルキルスルフィニルなどにも適用される。

【0048】

「アルキルスルホニル」の非限定的な例には、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及び異なる異性体が含まれる。「アリアルスルホニル」という用語は、Ar-S(O)₂を含み、ここで、Arは、任意のカルボキシル又はヘテロ環であり得る。この定義は、他に定義されていない限り、複合置換基の一部としてのアルキルスルホニル、例えばアルキルスルホニルアルキルなどにも適用される。

10

20

【0049】

「アルキルアミノ」、「ジアルキルアミノ」などは、上記の例と同様に定義される。

【0050】

「炭素環又は炭素環式」という用語は、「芳香族炭素環系」及び「非芳香族炭素環系」又は多環式又は二環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）環化合物を含む。ここで、環は芳香族又は非芳香族でありえる（芳香族はヒュッケル則が満たされていることを示し、非芳香族はヒュッケル則が統計化されていないことを示す）。

【0051】

「複素環又は複素環式」という用語は、「芳香族複素環又はヘテロアリアル環系」及び「非芳香族複素環系」、又は環が芳香族又は非芳香族であり得る多環式又は二環式（スピロ、縮合、架橋、非縮合）環化合物を含む。ここで、複素環は、N、O、S(O)₀₋₂から選択される少なくとも1つのヘテロ原子を含み、又は複素環のC環メンバーは、C(=O)、C(=S)、C(=CR^{*}R^{*})及びC=NR^{*}、で置換できる。^{*}は整数を示す。

30

【0052】

「非芳香族複素環」又は「非芳香族複素環式」という用語は、酸素、窒素及び硫黄の群からの1~4個のヘテロ原子を含む、3~15員、好ましくは3~12員の飽和又は部分不飽和複素環、炭素環員に加えて、1~3個の窒素原子及び/又は1個の酸素又は硫黄原子又は1又は2個の酸素及び/又は硫黄原子を含む単環式、二環式又は三環式複素環を意味する。環に複数の酸素原子が含まれている場合、それらは直接隣接していない。非限定的な例には以下が含まれる。オキセタニル、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、1-ピロリジニル、2-ピロリジニル、3-ピロリジニル、3-イソキサゾリジニル、4-イソキサゾリジニル、5-イソキサゾリジニル、3-イソチアゾリ 4-イソチアゾリジニル、5-イソチアゾリジニル、1-ピラゾリジニル、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、1-イミダゾリジニル、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-

40

50

イル、1, 2, 4-トリアゾリジン-1-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-1-イ
 ル、1, 3, 4-トリアゾリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-2-イル、2, 3-ジヒドロフル-3-
 イル、2, 4-ジヒドロフル-2-イル、2, 4-ジヒドロフル-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、ピロリニル、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-イソキサゾリン-3-イル、3-イソキサゾリン-3-イル、4-イソキサ
 サゾリン-3-イル、2-イソキサゾリン-4-イル、3-イソキサゾリン-4-イル、4-イソキサ
 ザリン-4-イル、2-イソキサゾリン-5-イル、3-イソキサゾリン-5-イル、4-イソチアゾ
 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、ピペ
 リジニル、2-ピペリジニル、3-ピペリジニル、4-ピペリジニル、ピラジニル、モルホリ
 ニル、チオモルフリニル、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
 、1, 2, 4-ヘキサヒドロトリアジン-3-イル、シクロセリン、2, 3, 4, 5-テトラヒドロ[1H]
 アゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、3, 4, 5, 6-テトラヒド
 ロ[2H]アゼピン-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、2, 3, 4, 7-テトラヒド
 ロ[1H]アゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、2, 3, 6, 7-テ
 トラヒドロ[1H]アゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は-7-イル、ヘキ
 サヒドロアゼピン-1-又は-2-又は-3-又は-4-イル、テトラ-及びヘキサヒドロオキセピン
 、例えば2, 3, 4, 5-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又は
 -7-イル、2, 3, 4, 7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-又
 は-7-イル、2, 3, 6, 7-テトラヒドロ[1H]オキセピン-2-又は-3-又は-4-又は-5-又は-6-
 又は-7-イル、ヘキサヒドロアゼパン-1-又は-2-又は-3-又は-4-イル、テトラ-及びヘキ
 サヒドロ-1, 3-ジアゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-ジアゼピニル、テトラ-及
 びヘキサヒドロ-1, 3-オキサゼピニル、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-オキサゼピニル、
 テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 3-ジオキセピン、テトラ-及びヘキサヒドロ-1, 4-ジオキセ
 ピニル。この定義は、他の場所で特に定義されていない限り、複合置換基の一部としての
 ヘテロシクリル、例えばヘテロシクリルアルキルなどにも適用される。

【0053】

「ヘテロアリアル」又は「芳香族複素環式」という用語は、酸素、窒素及び硫黄の群から
 の1から4個のヘテロ原子を含む5員又は6員の完全に不飽和の単環式環系を意味する。
 環に複数の酸素原子が含まれている場合、それらは直接隣接していない；1~4個の窒素
 原子又は1~3個の窒素原子と1個の硫黄又は酸素原子を含む5員ヘテロアリアル。炭素原
 子に加えて、環員として1~4個の窒素原子又は1~3個の窒素原子及び1個の硫黄又は酸
 素原子を含み得る5員ヘテロアリアル基、非限定的な例は、フリル、チエニル、ピロリル
 、イソキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾ

リル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,3,4-トリアゾリル、テトラゾリル；1～4個の窒素原子を含む窒素結合した5員ヘテロアリアル又は、1～3個の窒素原子を含むベンゾ縮合窒素結合5員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、環メンバーとして1～4個の窒素原子又は1～3個の窒素原子を含み得る、2つの隣接する炭素環メンバー又は1つの窒素及び1つの隣接する炭素環メンバーは、1つ又は2つの炭素原子を窒素原子で置換できるブタ-1,3-ジエン-1,4-ジイル基によって架橋され得る5員ヘテロアリアル基であり、これらの環は、窒素環メンバーの1つを介して骨格に結合しているが、非限定的な例は、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-イルである。

10

【0054】

1～4個の窒素原子を含む6員ヘテロアリアル：炭素原子に加えて、環員としてそれぞれ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、非限定的な例：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；1～3個の窒素原子又は1個の窒素原子と1個の酸素又は硫黄原子を含むベンゾ縮合5員ヘテロアリアル：非限定的な例はインドール-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、ベンズイミダゾ-1-イル、ベンズイミダゾ-2-イル、ベンズイミダゾ-4-イル、ベンズイミダゾ-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-ベンゾオキサゾール-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；1～3個の窒素原子を含むベン

20

30

【0055】

「トリアルキシルシリル」という用語は、トリメチルシリル、トリエチルシリル、及びt-ブチル-ジメチルシリルなどのシリコン原子に結合し、それらを介して連結された3つの分岐及び/又は直鎖アルキルラジカルを含む。「ハロトリアルキシルシリル」は、3つのアルキルラジカルのうちの少なくとも1つが、同じであっても異なってもよいハロゲン原子で部分的又は完全に置換されていることを意味する。「アルコキシトリアルキシルシリル」という用語は、3つのアルキルラジカルのうちの少なくとも1つが、同じであっても異なってもよい1つ以上のアルコキシラジカルで置換されていることを意味する。「トリアルキシルシリルオキシ」という用語は、酸素を介して結合したトリアルキシルシリル部分を意味する。

40

【0056】

「アルキルカルボニル」の非限定的な例には、 $C(=O)CH_3$ 、 $C(=O)CH_2CH_2CH_3$ 及び $C(=O)CH(CH_3)_2$ が含まれる。「アルコキシカルボニル」の非限定的な例には、 $CH_3OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2OC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$ 、 $(CH_3)_2CHOC(=O)$ 及び異なるプトキシ又はペントキシカルボニル異性体が含まれる。「アルキルアミノカルボニル」の非限定的な例には、 $CH_3NHC(=O)$ 、 $CH_3CH_2NHC(=O)$ 、 $CH_3CH_2CH_2NHC(=O)$ 、 $(CH_3)_2C$

50

HNHC(=O)及び異なるブチルアミノ-又はペンチルアミノカルボニル異性体。が含まれる。「ジアルキルアミノカルボニル」の非限定的な例には、 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 及び $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})$ である。「アルコキシアルキルカルボニル」の非限定的な例には、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{C}(=\text{O})$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ が含まれる。「アルキルチオアルキルカルボニル」の非限定的な例には、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{C}(=\text{O})$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ が含まれる。ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、アルキルスルホニルアミノカルボニル、アルキルチオアルコキシカルボニル、アルコキシカルボニルアルキルアミノなどの用語は、同様に定義される。

10

【0057】

「アルキルアミノアルキルカルボニル」の非限定的な例には、 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{C}(=\text{O})$ 及び $\text{H}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ が含まれる。

【0058】

「アミド」という用語は、 $\text{A-R}'\text{C}=\text{ONR}''-\text{B}$ を意味し、ここで、 R' 及び R'' は置換基を示し、A及びBは任意の基を示す。

【0059】

「チオアミド」という用語は、 $\text{A-R}'\text{C}=\text{SNR}''-$ を意味し、ここで、 R' 及び R'' は置換基を示し、A及びBは任意の基を示す。

20

【0060】

置換基の炭素原子の総数は、「 C_i-C_j 」という接頭辞で示され、ここでiとjは1から21までの数字である。例えば、 C_1-C_3 アルキルスルホニルは、メチルスルホニルからプロピルスルホニルを示し、 C_2 アルコキシアルキルは CH_3OCH_2 を示し； C_3 アルコキシアルキルは、例えば、 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ or $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ を示す。 C_4 アルコキシアルキルは、合計4個の炭素原子を含むアルコキシ基で置換されたアルキル基の様々な異性体を示す。例には、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 及び $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ が含まれる。上記の朗読において、式Iの化合物が1つ以上の複素環から構成される場合、すべての置換基は、利用可能な炭素又は窒素を介して、前記炭素又は窒素上の水素の置換によってこれらの環に結合する。

30

【0061】

化合物が、前記置換基の数が1を超えることができることを示す下付き文字を有する置換基で置換される場合、前記置換基（それらが1を超える場合）は、定義された置換基の群から独立して選択される。さらに、 $(\text{R})_m$ の添え字mが、例えば0から4の範囲の整数を示す場合、置換基の数は、0から4までの整数から選択することができる。

【0062】

基が水素でありうる置換基を含む場合、この置換基を水素とすると、その基は置換されていないことが認識される。

【0063】

本明細書の実施形態及びその様々な特徴及び有利な詳細は、説明中の非限定的な実施形態を参照して説明される。本明細書の実施形態を不必要に不明瞭にしないために、周知の構成要素及び処理技術の説明は省略されている。本明細書で使用される例は、本明細書の実施形態が実施され得る方法の理解を容易にし、当業者が本明細書の実施形態を実施することをさらに可能にすることを単に意図している。したがって、実施例は、本明細書の実施形態の範囲を限定するものとして解釈されるべきではない。

40

【0064】

特定の実施形態の説明は、本明細書の実施形態の一般的な性質を完全に明らかにするので、他の人は、現在の知識を適用することによって、一般的な概念から逸脱することなく、そのような特定の実施形態のような様々な用途に容易に修正及び/又は適応することができる

50

きる。したがって、そのような適合及び修正は、開示された実施形態の同等物の意味及び範囲内で理解されるべきであり、理解されることを意図している。本明細書で使用される用語又は用語は、説明を目的とするものであり、限定するものではないことを理解されたい。したがって、本明細書の実施形態は好ましい実施形態に関して説明されてきたが、当業者は、本明細書の実施形態が、本明細書に記載の実施形態の精神及び範囲内で修正して実施できることを認識するであろう。

【0065】

本明細書に含まれている文書、行為、材料、装置、記事などの議論は、開示の文脈を提供することのみを目的としている。これらの事項のいずれか又はすべてが先行技術の基盤の一部を形成すること、又は本出願の優先日より前に存在していたため、開示に関連する分野の一般的な知識であったことを認めるものと見なされるべきではない。

10

【0066】

説明及び説明/特許請求の範囲に記載された数値は、本発明の重要な部分を形成する可能性があるが、そのような数値からの逸脱は、その逸脱が本発明に開示された本発明のそれと同じ科学的原理に従う場合、依然として本発明の範囲内にあるものとする。

【0067】

本発明の化合物は、適切な場合、異なる可能な異性体形態、特に立体異性体、例えばE及びZ、スレオ及びエリスロ、ならびに光学異性体の混合物として存在し得るが、適切な場合には互変異性体もまた存在し得る。E及びZ異性体の両方、ならびにスレオ及びエリスロ異性体、ならびに光学異性体、これらの異性体の任意の所望の混合物、及び可能な互変異性形態が開示及び請求される。

20

【0068】

本開示の目的のための「害虫」という用語は、真菌、ストラメノパイル（異性体）、細菌、線虫、ダニ、マダニ、昆虫、げっ歯を含む。ただし、これらに限定されない。

【0069】

「植物」という用語は、ここでは、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（天然に存在する作物植物を含む）などのすべての植物及び植物集団を意味すると理解される。作物植物は、従来 of 育種及び最適化方法によって、又は生物工学的及び遺伝子工学的な方法又はこれらの方法の組み合わせによって得ることができる植物であり得、トランスジェニック植物及び植物育種者の権利によって保護可能及び保護不可能な植物栽培品種を含む。

30

【0070】

本開示の目的のために、「植物」という用語は、樹木、低木、草本、草、シダ、及びコケによって例示される種類の生物を含み、これらは通常、ある場所で成長し、それらの根を通して水及び必要な物質を吸収し、光合成によって葉の栄養素を合成するものである。

【0071】

本発明の目的のための「植物」の例には、小麦、ライ麦、大麦、ライコムギ、オーツ麦又はイネ、ビート、例：テンサイ又は飼料用ビート；ナシ状果、核果、又は柔らかい果物などの果物及び果樹例えばリンゴ、ナシ、プラム、ピーチ、アーモンド、サクランボ、イチゴ、ラズベリー、ブラックベリー、又はグーズベリー；レンズ豆、エンドウ豆、アルファルファ、大豆などのマメ科植物；菜種、マスタード、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、ココア豆、ヒマシ油植物、アブラヤシ、落花生又は大豆などの油性植物；スカッシュ、キュウリ、メロンなどのウリ；綿、亜麻、麻、ジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ、みかんなどの柑橘系の果物や柑橘類の木；ほうれん草、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ、ウリ、パプリカなどの園芸植物、野菜；アボカドなどの月桂樹植物、シナモン又は樟腦、ウリ科；油性植物；穀物、トウモロコシ、大豆、その他のマメ科植物、菜種、サトウキビ、アブラヤシなどのエネルギー及び原材料の植物；タバコ；ナッツ；コーヒー；お茶；カカオ；バナナ；ペッパー；ブドウの木（テーブルグレープとグレープジュースブドウのつる）；ホップ；芝；甘い葉（ステビアとも呼ばれる）；花、低木、広葉樹、常緑樹などの天然ゴム植物又

40

50

は観賞用及び林業用植物；針葉樹；種子などの植物繁殖材料、及びこれらの植物の作物材料などの農作物が含まれるが、これらに限定されない。

【0072】

好ましくは、本発明の目的のための植物は、穀物、トウモロコシ、米、大豆及び他の合法植物、果物及び果樹、ブドウ、ナッツ及びナッツの木、柑橘類及び柑橘類の木、任意の園芸植物、キュウリ科、油性植物、タバコ、コーヒー、茶、カカオ、テンサイ、サトウキビ、綿、ジャガイモ、トマト、タマネギ、コショウと野菜、装飾品、園芸植物、及び人間と動物が使用するその他の植物を含むがこれらに限定されない。

【0073】

「植物の部分」という用語は、地上及び地下の植物のすべての部分及び器官を意味すると理解されている。本開示の目的のために、植物部分という用語は、切穂 (cuttings)、葉、小枝、塊茎、花、種子、枝、直根を含む根、側根、根毛、根尖、根冠、根茎、挿木 (slips)、芽、果実、果実体、樹皮、茎、芽、補助芽、成長点 (meristem)、節及び節間を含むが、これらに限定されない。

【0074】

「その遺伝子座」という用語は、土壌、植物又は植物部分の周囲、ならびに植物又は植物部分の播種/植え付けの前、最中、又は後に使用される機器又は道具を含む。

【0075】

本開示の化合物又は任意選択で他の適合性化合物を含む組成物中の本開示の化合物の植物又は植物材料又はその遺伝子座への適用は、当業者に知られている技術による適用を含むが、噴霧、コーティング、浸漬、燻蒸、含浸、注入及びダスティングが含まれるが、これらに限定されない。

【0076】

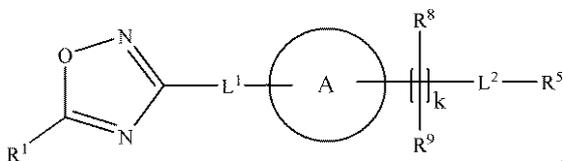
「適用される」という用語は、含浸を含む物理的又は化学的に植物又は植物部分に付着することを意味する。

【0077】

上記を考慮して、本発明は、化合物式 (I) を提供し、

【0078】

【化2】



式 (I)

【0079】

ここで、

【0080】

R¹はC₁-C₂-ハロアルキルである。

【0081】

L¹は直接結合、-CR²R³-、-C(=W¹)-、-CR²R³C(=W¹)-、-O-、-S(=O)₀₋₂-、又は-NR^{4a}-である。ここで、置換基の開始及び終了における表現「-」は、オキサジアゾール環又はAのいずれかへの結合点を示す。

【0082】

W¹はO又はSである。

【0083】

Aは、1つ又は複数の橋頭 (bridgehead) にNを有する縮合ヘテロ二環式環である。ここで、前記環は、任意選択で、1つの置換基R^A又は複数の同種若しくは異種の置換基R^Aで置換されている。

【0084】

30

40

50

RAは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-ジアルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、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-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-ジアルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ又はC₁-C₆-ジアルキルアミノカルボニルオキシ、及び3~6員の炭素環式又は複素環式環からなる群から選択される。ここで、前記3~6員の炭素環式又は複素環式環は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシアルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₃-C₆-シクロアルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₆-シクロアルキルアミノ、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-アルキルアミノカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ及びジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ;からなる群から選択される1つ以上の同一又は異なる置換基で任意選択で置換され得る。

10

20

【0085】

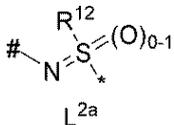
L²は直接結合であるか、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-S(=O)₀₋₂-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-

【0086】

S(=O)₀₋₂-、-NR¹⁰-、

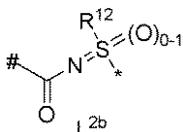
【0087】

【化3】



【0088】

【化4】



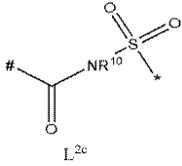
【0089】

30

40

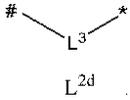
50

【化5】



【0090】

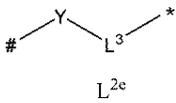
【化6】



10

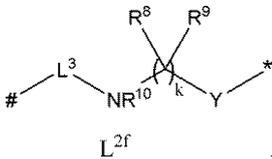
【0091】

【化7】



【0092】

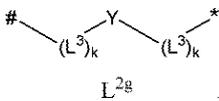
【化8】



20

【0093】

【化9】



30

【0094】

、-NR10-(C=W2)-NR10-、-NR10-S(=O)0-2-NR10-、-(C=W2)-NR10-NR10-、-S(=O)0-2-NR10-NR10-、-NR10-NR10-(C=W2)-、-NR10-NR10-S(=O)0-2-、-NR10-(C=W2)-NR10-NR10-、-NR10-S(=O)0-2-NR10-NR10-、-NR10-NR10-(C=W2)-NR10-、-NR10-NR10-S(=O)0-2-NR10-、-O(C=W2)-NR10-、及び-NR10-(C=W2)-O-からなる群から選択される。

【0095】

Yは直接結合又は-NR10-、又は-O-、又は-S(O)0-2-又は-C(=NOR11)-である。

40

【0096】

kは0から4の範囲の整数である。式「-」、「#」、及び「*」は、結合箇所を示す。

【0097】

W2はO又はSである。

【0098】

L3は直接結合であるか、-CR8aR9a-、-CR8aR9aC(=O)-、-C(=O)-、-C(=S)-、-O-、-S(=O)0-2-、-S(O)0-1(=NR10)-、-S(=N-CN)-、-S(=N-NO2)-、-S(=N-COR8a)-、-S(=N-COOR11)-、-S(=N-(S(=O)2R12))-、-NR10-、-NR10(C(=O))O-及び-CR8a(=N)O-からなる群から選択される。

【0099】

50

R¹⁰は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルケニル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、フェニル、ピリジニル、C(=O)-(C₁-C₆-アルキル)、C(=O)-(C₁-C₆-アルコキシ)及び-N(R^{10a})₂-からなる群から選択される。；ここで、R^{10a}は、水素、ヒドロキシル、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル及びC₁-C₆-アルキルチオからなる群から選択される。R¹⁰の各基は、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソ、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ及びC₃-C₆-シクロアルキルからなる群から選択される同一又は異なるラジカルで任意選択で置換される。

10

【0100】

R¹¹は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₈-シクロアルケニル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロアリール-C₁-C₆-アルキル、フェニル及びナフチルからなる群から選択され；

【0101】

R¹²は、水素NR₉R^hからなる群から選択される。ここで、R₉及びR^hは、水素、ヒドロキシル、シアノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₃-C₈-シクロアルキル；C(=O)-Rⁱ、ここで、Rⁱは、水素、ハロゲン、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、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ及びC₁-8-アルキル-S(O)₀₋₂R^jからなる群から選択される。ここで、R^jは、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₆-アルキル-C(=O)-Rⁱ、CRⁱ=NR₉、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-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル、C₄-C₈-シクロアルケニル、C₇-C₁₉-アラルキル、二環式C₅-C₁₂-アルキル、C₇-C₁₂-アルケニル及び縮合又は非縮合又は二環式C₃-C₁₈-炭素環式環又は環系からなる群から選択される。ここで、炭素環又は環系の1つ又は複数のC原子は、N、O、S(=O)₀₋₂、S(=O)₀₋₁、(=NR¹⁰)、C(=O)、C(=S)、C(=CR⁸R⁹)及びC=NR¹⁰；で置換できる。

20

30

【0102】

R¹²は、必要に応じて、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、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-アルキルアミノカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ、ジC₁-C₆-アルキルアミノカルボニルオキシ、5~11員のスピロ環及び3~6員の炭素環又は複素環からなる基から選択される1つ又は複数の同一又は異なる置換基で置換することができる。

40

【0103】

R⁸とR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₁-C₆-アルキルチオ、C₃-C₈-シクロアルケニル、フェニル-C₁-C₆-アルキル、ヘテロア

50

リール-C₁-C₆-アルキル、フェニル、ナフチル及び3~10員の飽和、部分的に不飽和又は芳香族の単環式又は二環式炭素環又は複素環からなる群から独立して選択される。ここで、ヘテロアリーール-C₁-C₆-アルキルのヘテロアリーールの環メンバー及び複素環には、C、N、O及びS(O)₀₋₂が含まれ、炭素環又は複素環のC環メンバーは、1つ又は複数のC(=O)及びC(S)で置換できる。ここで、R⁸及びR⁹は、任意選択で、1つ又は複数の同一又は異なるR^{8a}又はR^{9a}で置換されている。ここで、R^{8a}及びR^{9a}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、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、アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、NH₂SO₂-C₁-C₆-アルキル、-C(=O)-C₁-C₆-アルキル、C(=O)-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルスルホニル、ヒドロキシ-C₁-C₆-アルキル、-C(=O)-NH₂、C(=O)-NH(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル及びC₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルからなる群から選択され；

【0104】

R⁸及びR⁹は、それらが結合している原子とともに、C(=O)又はビニル基、又は飽和した単環式の3~7員環の複素環式環又は炭素環式環を形成する。ここで、複素環の環メンバーには、C、N、O及びS(O)₀₋₂が含まれる。ここで、ビニル基、複素環又は炭素環は、非置換であるか、1つ又は複数の同一又は異なるR^{8b}で置換されており、ここで、R^{8b}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、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、SO₂-C₁-C₆-アルキル、NH₂SO₂-C₁-C₆-アルキル、-C(=O)-C₁-C₆-アルキル、C(=O)-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルスルホニル、SO₂-C₆H₄CH₃及びSO₂-アリーールからなる群から選択され；

【0105】

R⁵は、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、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルケニル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、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-C₁-C₆-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、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂-C₆-ヒドロキシアルケニル、C₂-C₆-ヒドロキシアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-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-アルキルカルブオニルアルコキシ、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、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、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、C₃-C₈-シクロアルキルスルフィニル、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル、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、C₁-C₆-アルキルカルボニルチオ、C₁-C₆-アルキ

ルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルキルスルフィニルオキシ、C₆-C₁₀-アリールスルホニルオキシ、C₆-C₁₀-アリールスルフィニルオキシ、C₆-C₁₀-アリールスルホニル、C₆-C₁₀-アリールスルフィニル、C₆-C₁₀-アリールチオ、C₁-C₆-シアノアルキル、C₂-C₆-アルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルキニル、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、C₂-C₆-アルケニルチオ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニルアミノ、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルコキシカルボニルアルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルチオカルボニル、C₃-C₈-シクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルケニル、C₁-C₆-アルキルチオカルボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)アミノ、ジ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルアミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニル-C₁-C₆-アルキルアミノ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニル、シアノ(C₁-C₆-アルコキシ)-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシスルホニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シク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、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニル、C₁-C₆-シアノアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルカルボニルオキシ、C₂-C₆-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、C₁-C₆-シアノ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-C₆-アルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルスルホニルオキシ、C₁-C₆-シアノアルキルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルシクロアルキルオキシ、C₂-C₆-シアノアルケニルオキシ、C₂-C₆-シアノアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、スルフィリミン、スルホキシミンからなる群から選択される。SF₅又はZ¹Q¹；R⁵は、任意選択で、1つ又は複数のR⁶で置換できる。

10

20

30

40

50

【0106】

Z¹は直接結合、CR^{2a}R^{3a}、N、O、C(O)、C(S)、C(=CR^{2a}R^{3a})又はS(O)₀₋₂である。

【0107】

Q¹は、フェニル、ベンジル、ナフタレニル、5又は6員芳香環、8~11員芳香族多環式環

系、8～11員芳香族縮合環系、5員又は6員のヘテロ芳香族環、8～11員のヘテロ芳香族多環式環系、及び8～11員のヘテロ芳香族縮合環系からなる群から選択される。ここで、ヘテロ芳香族環のヘテロ原子は、N、O又はSから選択され、各環又は環系は、R¹³から独立して選択される1つ又は複数の置換基で任意選択で置換され得る。又は

【0108】

Q¹は、3～7員の非芳香族炭素環、4、5、6、又は7員の非芳香族複素環、8～15員の非芳香族多環環状環系、5～15員のスピロ環系、及び8～15員の非芳香族縮合環系からなる群から選択される。ここで、非芳香族環のヘテロ原子は、N、O又はS(O)₀₋₂から選択され、非芳香族炭素環式又は非芳香族複素環式環又は環系のC環メンバーは、C(O)、C(S)、C(=CR^{2b}R^{3b})又はC(=NR^{4b})で、及び各環又は環系は、任意選択で、R¹³から独立して選択される1つ又は複数の置換基で置換することができる。

10

【0109】

R²、R³、R^{2a}、R^{3a}、R^{2b}及びR^{3b}は、水素、ハロゲン、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、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシからなる群から独立して選択され；

【0110】

R²及びR³；R^{2a}及びR^{3a}；及び/又はR^{2b}及びR^{3b}は、それらが結合している原子とともに、ハロゲン、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル又はC₁-C₂-アルコキシで任意に置換され得る3～5員の非芳香族炭素環又は複素環を形成されていてもよく；

20

【0111】

R^{4a}及びR^{4b}は、水素、シアノ、ヒドロキシ、NR^bR^c、(C=O)-R^d、S(O)₀₋₂R^e、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、トリ-C₁-C₆-アルキルアミノ及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

【0112】

R^b及びR^cは、水素、ヒドロキシル、シアノ、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₃-C₈-ハロシクロアルキルからなる群から選択される。

【0113】

R^dは、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、NR^bR^c、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₃-C₈-ハロシクロアルキルからなる群から選択され；

30

【0114】

R^eは、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ及びC₃-C₈-シクロアルキル及びC₃-C₈-ハロシクロアルキルからなる群から選択される。

【0115】

R⁶とR¹³は、水素、ハロゲン、

ヒドロキシ、シアノ、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、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルケニル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、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-C₁-C₆-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、C₁-C₆-アルキルアミノ、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルア

40

50

ミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロ
 アルキルアミノ、C₃-C₈-シクロアルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルカル
 ボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ヒドロキシアルキル、C₂
 -C₆-ヒドロキシアルケニル、C₂-C₆-ヒドロキシアルキニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコ
 キシ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-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-アルキルカルボニルアルコキシ、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、C₁-C₆-アル
 キルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C
 1-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、C₃-C₈-シクロアル
 キルスルフィニル、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル、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、C₁-C₆-アルキルカルボニルチオ、C₁-C₆-
 アルキルスルホニルオキシ、C₁-C₆-アルキルスルフィニルオキシ、C₆-C₁₀-アリー
 ルスルホニルオキシ、C₆-C₁₀-アリールスルフィニルオキシ、C₆-C₁₀-アリールスルホニ
 ル、C₆-C₁₀-アリールスルフィニル、C₆-C₁₀-アリールチオ、C₁-C₆-シアノアルキル
 、C₂-C₆-アルケニルカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルチオ、C₁
 -C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルカルボニルオキシ、C₁-
 C₆-アルコキシカルボニル-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルキニル
 、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、C₂-C₆-アルケニルチオ、C₁-C₆-アルコ
 キシ-C₁-C₆-アルキルカルボニル、C₁-C₆-ハロアルコキシカルボニルアミノ、ジ(C₁-
 C₆-ハロアルキル)アミノ-C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルケニルオキシ-C₁-
 C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ(C₁-C₆-アルキル)アミノカルボニル、C₁-C₆-ハロ
 アルキルスルホニルアミノカルボニル、C₁-C₆-アルキルスルホニルアミノカルボニル、
 C₁-C₆-アルコキシカルボニルアルコキシ、C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミ
 ノ、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキ
 ルチオカルボニル、C₃-C₈-シクロアルケニルオキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコ
 キシ-C₁-C₆-アルコキシカルボニル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノチオカルボニルアミノ
 、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアル
 コキシ、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ
 カルボニルアミノ、C₁-C₆-アルコキシ-C₂-C₆-アルケニル、C₁-C₆-アルキルチオカル
 ボニルオキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキルスル
 ホニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、ジ(C₁-C₆-ハロアルキル)
 アミノ、ジ-C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニルア
 ミノ、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルキルアミノカルボニ
 ル-C₁-C₆-アルキルアミノ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニルオキシ、
 トリ-C₁-C₆-アルキルシリルオキシ、トリ-C₁-C₆-アルキルシリル-C₂-C₆-アルキニル
 、シアノ(C₁-C₆-アルコキシ)-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-
 アルキル、C₁-C₆-アルコキシスルホニル、C₃-C₈-ハロシクロアルコキシカルボニル、C
 1-C₆-アルキル-C₃-C₈-シク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、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニル、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニル、C₁
 -C₆-シアノアルコキシカルボニル、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルコキシカルボニ
 ル、C₂-C₆-アルキニルカルボニルオキシ、C₂-C₆-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、C₁-C₆-シアノ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-シクロアルキル-C₁-C₆-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-C₆-アルケニルスルホニルオキシ、C

10

20

30

40

50

2-C₆-アルキニルスルホニルオキシ、C₁-C₆-シアノアルキルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルケニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキニルスルホニルオキシ、C₂-C₆-ハロアルキルスルホニルオキシ、C₆-アルキニルシクロアルキルオキシ、C₂-C₆-シアノアルケニルオキシ、C₂-C₆-シアノアルキニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルケニルオキシカルボニルオキシ、C₂-C₆-アルキニルオキシカルボニルオキシ、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキルカルボニルオキシ、スルフィリミン、スルホキシミン及びSF₅からなる群から独立して選択され；

【0116】

及び/又はN-オキシド、金属錯体、異性体、多形又はそれらの農業的に許容される塩；

【0117】

ただし、以下の化合物は式(I)の化合物の定義から除外される；

【0118】

N-(2-メトキシエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド及びエチル6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート。

【0119】

一実施形態では、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、

【0120】

R¹は、CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CF₂CF₃、CH₂F、CH₂CF₃、CHClCF₃及びCCl₂CF₃からなる群から選択され；

【0121】

L¹は直接結合、-CR²R³-である。

【0122】

Aは、1つ又は複数の橋頭にNを有する縮合ヘテロ二環式環である。ここで、前記環は、任意選択で、1つの置換基RA又は複数の同種若しくは異種の置換基RAで置換され、

【0123】

RAは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル及びC₁-C₆-ハロアルキルからなる群から選択され；

【0124】

R⁸及びR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル及びC₁-C₆-アルキルチオからなる群から独立して選択され；又は

【0125】

R⁸及びR⁹は、それらが結合している原子とともに、C(=O)又はビニル基、又は飽和した単環式の3~7員の複素環式又は炭素環式環を形成する。ただし複素環式の環員にはC、N、O及びS(O)₀₋₂が含まれる；ここで、ビニル基、複素環又は炭素環は、非置換であるか、又は1つ又は複数の同一又は異なるR^{8b}で置換されており、ここで、R^{8b}は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシル、スルファニル、アミノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群から選択される。

【0126】

別の実施形態において、本発明は、式(I)の化合物を提供し、ここで、

【0127】

R¹は、CF₃、CHF₂、CF₂Cl、CHClCF₃、及びCCl₂CF₃からなる群から選択される。

【0128】

L¹は直接結合である。

【0129】

Aは

【0130】

10

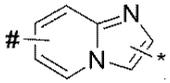
20

30

40

50

【化10】



であり、「#」及び「*」は付着点を示し、前記環は、任意に1つの置換基RA又は複数の同種又は異種の置換基RAで置換されていてもよい。

【0131】

RAは、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、ヒドロキシ、SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキルアルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル及びC₁-C₆-ヒドロキシアルキルからなる群から選択され；

【0132】

R⁸及びR⁹は、水素、ハロゲン、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群から独立して選択される。；又は

【0133】

R⁸とR⁹は、それらが結合している原子とともにC(=O)又はビニル基を形成する。

【0134】

好ましい実施形態では、式(I)の化合物は、

N-(3-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(4-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(p-トリル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(3-フルオロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(2,4-ジフルオロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(4-クロロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(2-フルオロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(ピリジン-3-イル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-ベンジル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(ピリジン-4-イル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(4-クロロフェニル)-N-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-メチル-N-(2-フェノキシエチル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(4-シアノフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-(3-メトキシフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

- イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(2-フルオロベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(4-(ジメチルアミノ)ベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(3,4-ジクロロベンジル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル臭化水素酸塩 ;
 3-(2-(3-メトキシフェニル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 10
 3-(2-(4-クロロフェニル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(4-フルオロフェニル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(4-メトキシフェニル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(フェニルチオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(2-フルオロフェニル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 20
 5-(トリフルオロメチル)-3-(2-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(4-メトキシベンジル)チオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(プロピルチオ)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(4-クロロフェニル)スルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(4-メトキシフェニル)スルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 30
 3-(2-(4-フルオロフェニル)スルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(フェニルスルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(2-フルオロフェニル)スルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(4-メトキシベンジル)スルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-(プロピルスルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 40
 5-(トリフルオロメチル)-3-(2-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)スルホニル)メチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル) -1,2,4-オキサジアゾール ;
 6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 モルフォリノ(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタノン ;
 N-(2-メトキシエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-イソブチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミ 50

- ダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-シクロペンチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)
 イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 (3-メトキシピロリジン-1-イル) (6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジア
 ザール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メタノン ;
 アゼチジン-1-イル (6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル
) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メタノン ;
 N-(シクロプロピルメチル)-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール
 -3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-ベンジル-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) 10
 イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(1-フェニルエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-
 イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(1-シアノシクロプロピル)-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾー
 ル-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(2-メトキシエチル)-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジア
 ザール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(3-クロロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-
 イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(3-メトキシベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3 20
 -イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-(4-クロロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-
 イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 N-イソブチル-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-
 イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
 6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピ
 リジン-2-カルボン酸エチル ;
 3-(2-(エトキシメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチ
 ル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1, 30
 2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 4-メトキシ-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)
 イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 4-クロロ-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イ
 ミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 2-(4-クロロフェニル)-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾー
 ル-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) アセトアミド ;
 3-クロロ-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イ
 ミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 3,4-ジクロロ-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル 40
) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,
 2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ピコリンアミド ;
 N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,
 2-a]ピリジン-2-イル) メチル) プロピオンアミド ;
 4-(トリフルオロメトキシ)-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジア
 ザール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 4-フルオロ-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)
 イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド ;
 2-フルオロ-N-(6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) 50

- イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
 N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)オキサゾール-4-カルボキサミド ;
 3-フルオロ-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
 2-フェニル-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)アセトアミド ;
 4-(ジメチルアミノ)-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
 3-メチル-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ブタンアミド ; 10
 4-(トリフルオロメチル)-N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド ;
 N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ニコチンアミド ;
 N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イソニコチンアミド ;
 3-(2-((4-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 20
 3-(2-((4-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((3-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((3-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((4-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((2-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 30
 3-(2-((プロピルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((ベンジルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((4-メトキシベンジル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((3,4-ジクロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((3,5-ジクロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ; 40
 3-(2-((イソブチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((シクロペンチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((シクロヘキシルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((2-エチルフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
 3-(2-((フェニルスルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(ト 50

- リフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((3,4-ジクロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((3-クロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-クロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((3-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-メトキシベンジル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-((シクロヘキシルスルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((2-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((4-メトキシフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((3,4-ジクロロフェニル)スルフィニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((3-クロロフェニル)スルフィニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- 3-(2-(((2-フルオロフェニル)スルフィニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール ;
- N-(メチル(オキソ)(フェニル)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((3-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(ジメチル(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(1-オキシドテトラヒドロ-2H-1,4-チオピラン-1-イリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-((4-クロロフェニル)(2-メトキシエチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド ;
- N-(イソプロピル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリ

- フルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((4-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-(メチル(オキソ)(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((3,5-ジクロロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド; 10
- N-(1-オキシドテトラヒドロ-1,6-チオフェン-1-イリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((4-プロモフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((3,4-ジクロロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド; 20
- N-(4-オキシド-1,4,6-オキサチアン-4-イリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((2-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((4-メトキシピリジン-2-イル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((4-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド; 30
- N-(メチル(オキソ)(o-トリル)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- N-((3-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- (3-フルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)-6-スルファノン; 40
- N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ブチルアミド;
- イミノ(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン;
- N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ピバルアミド;
- 4-メトキシ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデ 50

- ン)ベンズアミド ;
- N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;
- 4-クロロ-2-フルオロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;
- 3-フルオロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;
- 3-クロロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;
- 4-クロロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;
- N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンズアミド ;
- N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド ;
- N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)-3-(トリフルオロメチル)ベンズアミド ;
- 2-フルオロ-N-(メチル(オキソ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド ;
- イミノ(フェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン ;
- イミノ(4-メトキシフェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン ;
- (4-クロロフェニル)(イミノ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン ;
- (4-フルオロフェニル)(イミノ)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(4-メトキシベンジル)(メチル)-6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)-6-スルファノン ;
- (4-クロロベンジル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)-6-スルファノン ;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(フェニル)-6-スルファノン

10

20

30

40

50

- ;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (2,4-ジフルオロフェニル) (メチル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (4-フルオロフェニル) (メチル) - 6-スルファノン;
- tert-ブチル ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) - 6-スルファノン
- ;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) (3,3,3-トリフルオロプロピル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) ((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) ジメチル- 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (シクロプロピルメチル) (メチル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (2,6-ジクロロフェニル) (メチル) - 6-スルファノン;
- (2-クロロ-4-フルオロフェニル) ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) - 6-スルファノン;
- (2-クロロ-4- (トリフルオロメチル) フェニル) ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) (4- (トリフルオロメトキシ) フェニル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) (4-メチルベンジル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (4-メトキシフェニル) (メチル) - 6-スルファノン;
- ベンジル ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) (ピリジン-3-yl) - 6-スルファノン;
- ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (イソオキサゾール-4-イルメチル) (メチル) - 6-スルファノン;
- ((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) メチル) ((7- (5- (クロロジフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) -2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) (メチル) - 6-スルファノン;

10

20

30

40

50

- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(オキサゾール-4-イルメチル)-6-スルファノン;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(チアゾール-4-イルメチル)-6-スルファノン;
- (2-クロロ-6-メトキシフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)(ピリミジン-5-yl)-6-スルファノン; 10
- (3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)-6-スルファノン;
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(エチル)(メチル)-6-スルファノン; 20
- ((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)(2-メトキシエチル)(メチル)-6-スルファノン;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(4-メトキシベンジル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- N-(4-クロロベンジル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド; 30
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(フェニル))-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(4-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド; 40
- N-(tert-ブチル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(3,3,3-トリフルオロプロピル))-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド; 50

- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(ジメチル(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(シクロプロピルメチル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(2,6-ジクロロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- N-(2-クロロ-4-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド; 10
- N-(2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(4-メチルベンジル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド; 20
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(4-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- N-(ベンジル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリジン-3-イル)-6-スルファンイリデン)アセトアミド; 30
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(イソオキサゾール-4-イルメチル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- N-(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキサゾール-4-イルメチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(チアゾール-4-イルメチル)-6-スルファンイリデン)アセトアミド; 40
- N-(2-クロロ-6-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリミジン-5-イル)-6-スルファンイリデン)アセトアミド;
- N-(3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3 50

- イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(イソプロピル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(エチル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) アセトアミド ;
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(2-メトキシエチル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) アセトアミド ; 10
- 2-(7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)-N-(メチル((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) アセトアミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(フェニル)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((4-クロロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((4-メトキシフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ; 20
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(m-トリル)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ; 30
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((3-(ジメチルアミノ)フェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(ジメチル(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(エチル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(tert-ブチル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ; 40
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-((シクロプロピルメチル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- N-(ベンジル(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)-7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド ;
- 7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリミジン-5-イル)-6-スルファンイリデン) イミダゾ[1,2-a]ピリジン- 50

2-カルボキサミド；

7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリダジン-4-イル)-6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピラジン-2-イル)-6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(メチル(オキソ)(ピリジン-4-イル)-6-スルファンイリデン)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(4-メトキシベンジル)(メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)-6-スルファノン；

(4-クロロベンジル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(フェニル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(4-フルオロフェニル)(メチル)-6-スルファノン；

tert-ブチル((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)ジメチル-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(シクロプロピルメチル)(メチル)-6-スルファノン；

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(2,6-ジクロロフェニル)(メチル)-6-スルファノン；

(2-クロロ-4-フルオロフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル

10

20

30

40

50

) - 6-スルファノン ;

(2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(4-メチルベンジル)-6-スルファノン ;

10

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(4-メトキシフェニル)(メチル)-6-スルファノン ;

ベンジル((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(ピリジン-3-yl)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(イソオキサゾール-4-イルメチル)(メチル)-6-スルファノン ;

20

(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(オキサゾール-4-イルメチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(チアゾール-4-イルメチル)-6-スルファノン ;

30

(2-クロロ-6-メトキシフェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)(ピリミジン-5-yl)-6-スルファノン ;

(3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(メチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(イソプロピル)(メチル)-6-スルファノン ;

40

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(エチル)(メチル)-6-スルファノン ;

((7-(5-(クロロジフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(2-メトキシエチル)(メチル)-6-スルファノン ;

(4-メトキシベンジル)(メチル)((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)-6-スルファノン ;

50

- メチル ((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- (4-クロロベンジル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- メチル ((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- メチル ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (フェニル) - 6-スルファノン ;
- (2,4-ジフルオロフェニル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- (4-フルオロフェニル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- tert-ブチル (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- メチル ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (3,3,3-トリフルオロプロピル) - 6-スルファノン ;
- メチル ((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- ジメチル ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- (シクロプロピルメチル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- (2,6-ジクロロフェニル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- (2-クロロ-4-フルオロフェニル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- (2-クロロ-4- (トリフルオロメチル) フェニル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- メチル ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (4- (トリフルオロメトキシ) フェニル) - 6-スルファノン ;
- メチル ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (4-メチルベンジル) - 6-スルファノン ;
- (4-メトキシフェニル) (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;
- ベンジル (メチル) ((2-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

メチル ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

(イソオキサゾール-4-イルメチル) (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル) (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

メチル ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (オキサゾール-4-イルメチル) - 6-スルファノン ;

10

メチル ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (チアゾール-4-イルメチル) - 6-スルファノン ;

(2-クロロ-6-メトキシフェニル) (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

メチル ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) (ピリミジン-5-イル) - 6-スルファノン ;

20

(3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル) (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

イソプロピル (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

エチル (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

(2-メトキシエチル) (メチル) ((2-メチル-7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ) - 6-スルファノン ;

30

(イソプロピルイミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

(シクロプロピルメチル)イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

(イソオキサゾール-4-イルメチル)イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

((2-メトキシエチル)イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

40

メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) (メチルイミノ) - 6-スルファノン ;

(エチルイミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

メチル ((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)イミノ) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;

メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)

50

- イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) ((3,3,3-トリフルオロプロピル) イミノ) - 6-スルファノン ;
- ((4-メトキシベンジル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- メチル ((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) メチル) イミノ) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- ((4-クロロベンジル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ; 10
- メチル ((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル) メチル) イミダゾ (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) (フェニルイミノ) - 6-スルファノン ;
- ((2,4-ジフルオロフェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- ((4-フルオロフェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ; 20
- (tert-ブチルイミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) (ピリジン-3-イリミノ) - 6-スルファノン ;
- (ベンジルイミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- ((4-メトキシフェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ; 30
- メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) ((4-メチルベンジル) イミノ) - 6-スルファノン ;
- メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) ((4-(トリフルオロメトキシ)フェニル) イミノ) - 6-スルファノン ;
- ((2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ; 40
- ((2-クロロ-4-フルオロフェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- ((2,6-ジクロロフェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- ((2-クロロ-6-メトキシフェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン ;
- メチル (2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) 50

- イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) ((チアゾール-4-イルメチル) イミノ) - 6-スルファノン;
- メチル (2-メチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) ((オキサゾール-4-イルメチル) イミノ) - 6-スルファノン;
- (((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) メチル) イミダゾ) (メチル) (2-メチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン;
- メチル (2-メチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) (ピリミジン-5-イリミノ) - 6-スルファノン; 10
- ((3-クロロ-4- (トリフルオロメチル) フェニル) イミノ) (メチル) (2-メチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) - 6-スルファノン;
- (イソプロピルイミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- ((シクロプロピルメチル) イミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- ((イソオキサゾール-4-イルメチル) イミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン; 20
- ((2-メトキシエチル) イミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- メチル (メチルイミノ) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- (エチルイミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- メチル (((1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル) メチル) イミノ) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン; 30
- メチル ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ((3,3,3-トリフルオロプロピル) イミノ) - 6-スルファノン;
- ((4-メトキシベンジル) イミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- メチル (((1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル) メチル) イミノ) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン; 40
- ((4-クロロベンジル) イミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- メチル (((1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル) メチル) イミノ) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- メチル (フェニルイミノ) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-スルファノン;
- ((2,4-ジフルオロフェニル) イミノ) (メチル) ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - 6-ス 50

ルファノン；

((4-フルオロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

(tert-ブチルイミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

メチル(ピリジン-3-イリミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

(ベンジルイミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

10

((4-メトキシフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

メチル((4-メチルベンジル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

メチル((4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

((2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

20

((2-クロロ-4-フルオロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

((2,6-ジクロロフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

((2-クロロ-6-メトキシフェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

30

メチル((チアゾール-4-イルメチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

メチル((オキサゾール-4-イルメチル)イミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

(((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

40

メチル(ピリミジン-5-イリミノ)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

((3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)イミノ)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) - 6-スルファノン；

N-(メチル(オキソ)(フェニル) - 6-スルファンイリデン) - 7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-((4-クロロフェニル)(メチル)(オキソ) - 6-スルファンイリデン) - 7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-

50

カルボキサミド；

N-（（4-メトキシフェニル）（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（メチル（オキソ）（m-トリル）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（（2-フルオロフェニル）（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（（2,4-ジフルオロフェニル）（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（（3-（ジメチルアミノ）フェニル）（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（ジメチル（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（エチル（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（tert-ブチル（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（（シクロプロピルメチル）（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（ベンジル（メチル）（オキソ）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（メチル（オキソ）（ピリミジン-5-イル）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（メチル（オキソ）（ピリダジン-4-イル）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（メチル（オキソ）（ピラジン-2-イル）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

N-（メチル（オキソ）（ピリジン-4-イル）- 6-スルファンイリデン）-7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；

メチル（フェニル）（（7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）イミノ）- 6-スルファノン；

（4-クロロフェニル）（メチル）（（7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）イミノ）- 6-スルファノン；

（4-メトキシフェニル）（メチル）（（7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）イミノ）- 6-スルファノン；

メチル（m-トリル）（（7-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）イミノ）- 6-スルファノン；

10

20

30

40

50

(2-フルオロフェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;
 (2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

(3-(ジメチルアミノ)フェニル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

ジメチル((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

エチル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

tert-ブチル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

(シクロプロピルメチル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

ベンジル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリミジン-5-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリダジン-4-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピラジン-2-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリジン-4-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(フェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(3-メチルベンジル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリジン-4-イルメチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリミジン-4-イルメチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリジン-3-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル(ピリジン-2-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

メチル((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)-6-スルファノン;

(5-メトキシピリジン-2-イル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル))-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;

10

20

30

40

50

- (5-フルオロピリジン-2-イル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(ピリミジン-5-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(ピリダジン-4-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- イソオキサゾール-4-イル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (2-メトキシチアゾール-4-イル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- ジメチル((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- エチル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- tert-ブチル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (シクロプロピルメチル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-6-スルファノン;
- (2-メトキシエチル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- ベンジル(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (3-メトキシベンジル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (3-フルオロベンジル)(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- イソプロピル(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (シクロプロピルメチル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (イソオキサゾール-4-イルメチル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (2-メトキシエチル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサ

- ジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- ジメチル((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- エチル(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(1-メチル-1H-イミダゾ-4-イル)メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)(3,3,3-トリフルオロプロピル)-6-スルファノン;
- (4-メトキシベンジル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(1-メチル-1H-ピラゾール-4-イル)メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (4-クロロベンジル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(1-メチル-1H-1,2,4-トリアゾール-3-イル)メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(フェニル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (2,4-ジフルオロフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (4-フルオロフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- tert-ブチル(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(ピリジン-3-イル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- ベンジル(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (4-メトキシフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(4-メチルベンジル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- メチル(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン;
- (2-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メ

チル)イミノ)- 6-スルファノン;

(2-クロロ-4-フルオロフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン;

(2,6-ジクロロフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン;

(2-クロロ-6-メトキシフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン;

メチル(チアゾール-4-イルメチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン;

メチル(オキサゾール-4-イルメチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン;

((1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)メチル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン;

メチル(ピリミジン-5-イル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノン及び

(3-クロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- 6-スルファノンから選択される。

【0135】

本発明の化合物は、1つ又は複数の立体異性体として存在することができる。さまざまな立体異性体には、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体、及び幾何異性体が含まれる。当業者は、1つの立体異性体が、他の立体異性体と比較して濃縮された場合、又は他の立体異性体から分離された場合、より活性であり得、及び/又は有益な効果を示し得ることを理解するであろう。さらに、当業者は、前記立体異性体を分離、濃縮、及び/又は選択的に調製する方法を知っている。本発明の化合物は、立体異性体、個々の立体異性体の混合物として、又は光学活性形態として存在し得る。

【0136】

式(I)の化合物がカチオン性であるか、又はカチオンを形成することができる場合の塩のアニオン部分は、無機又は有機であり得る。又は、式(I)の化合物がアニオン性であるか、又はアニオンを形成することができる場合の塩のカチオン部分は、無機又は有機であり得る。塩の無アニオン部分の例には、塩化物、臭化物、ヨウ化物、フッ化物、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩、亜硝酸塩、炭酸水素塩、硫酸水素塩が含まれるが、これらに限定されない。塩の有機アニオン部分の例には、ギ酸塩、アルカノエート、炭酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、トリクロロ酢酸塩、プロピオン酸塩、グリコレート、チオシアン酸塩、乳酸塩、コハク酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、桂皮酸塩、シュウ酸塩、アルキル硫酸塩、アルキルスルホン酸塩が含まれるが、これらに限定されない。アリールスルホン酸塩アリールジスルホン酸塩、アルキルホスホネート、アリールホスホネート、アリールジホスホネート、p-トルエンスルホン酸塩、及びサリチル酸塩。塩の無機カチオン部分の例には、アルカリ及びアルカリ土類金属が含まれるが、これらに限定されない。塩の有機カチオン部分の例には、ピリジン、メチルアミン、イミダゾ、ベンズイミダゾ、ヒチジン、ホスファゼン、テトラメチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、コリン及びトリメチルアミンが含まれるが、これらに限定されない。

【0137】

10

20

30

40

50

式 (I) の化合物の金属錯体中の金属イオンは、特に、第 2 の主族の元素、特にカルシウム及びマグネシウム、第 3 及び第 4 の主族、特にアルミニウム、スズ及び鉛のイオンであり、また、1 番目から 8 番目の遷移群、特にクロム、マンガン、鉄、コバルト、ニッケル、銅、亜鉛など。第 4 周期及び第 1 から第 8 遷移基の元素の金属イオンが特に優先される。ここで、金属は、それらが想定できるさまざまな原子価で存在する可能性がある。

【 0 1 3 8 】

式 (I) から選択される化合物 (すべての立体異性体、N - オキシド、及びそれらの塩を含む) は、通常、複数の形態で存在し得る。したがって、式 I は、式 (I) が表す化合物のすべての結晶形態及び非結晶形態を含む。非結晶形態には、ワックスやガムなどの固体である実施形態、ならびに溶液や溶融物などの液体である実施形態が含まれる。結晶形には、本質的に単結晶タイプを表す実施形態と、多形の混合物 (すなわち、異なる結晶タイプ) を表す実施形態が含まれる。「多形」という用語は、異なる結晶形態で結晶化することができる化合物の特定の結晶形態を指し、これらの形態は、結晶格子内の分子の異なる配置及び / 又は立体配座を有する。多形体は同じ化学組成を持つことができるが、格子内で弱く又は強く結合する可能性のある共結晶水又は他の分子の有無により、組成が異なる場合もある。多形体は、結晶形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、感受性、溶解速度、生物学的利用可能性などの化学的、物理的、生物学的特性が異なる場合がある。当業者は、式 (I) によって表される化合物の多形が、別の多形又は同じ化合物の多形の混合物と比較して有益な効果 (例えば、有用な製剤の調製への適合性、改善された生物学的性能) を示し得ることを理解するであろう。式 (I) で表される。式 (I) によって表される化合物の特定の多形の調製及び単離は、例えば、選択された溶媒及び温度を使用する結晶化を含む、当業者に知られている方法によって達成することができる。

10

20

【 0 1 3 9 】

一実施形態では、本発明は、式 (I) の化合物を調製するためのプロセスを提供する。

【 0 1 4 0 】

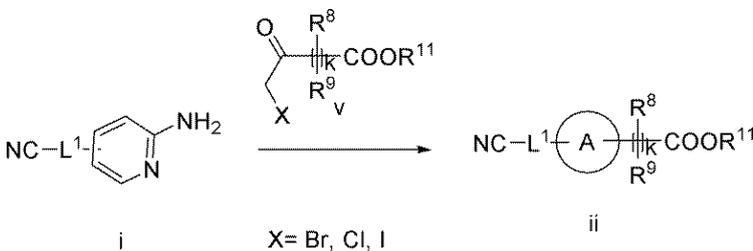
一実施形態では、本発明は、以下の工程を含む式 (I) の化合物を調製するためのプロセスを提供する。

【 0 1 4 1 】

a) 式 i の化合物を式 v の α -ハロカルボニル化合物と反応させて、式 ii の化合物を得る。

【 0 1 4 2 】

【 化 1 1 】



30

【 0 1 4 3 】

b) 式 ii の化合物をヒドロキシルアミンと反応させて式 iii の化合物を得る。

【 0 1 4 4 】

【 化 1 2 】



40

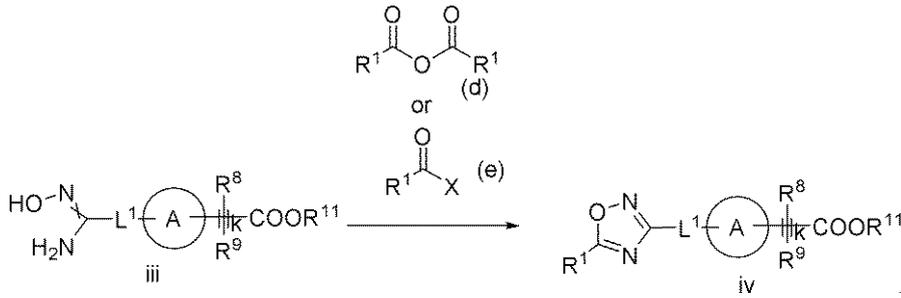
【 0 1 4 5 】

c) 式 iii の化合物を式 (d) の酸無水物又は式 (e) の酸塩化物化合物と反応させて、式 iv の化合物を得る。

【 0 1 4 6 】

50

【化 1 3】



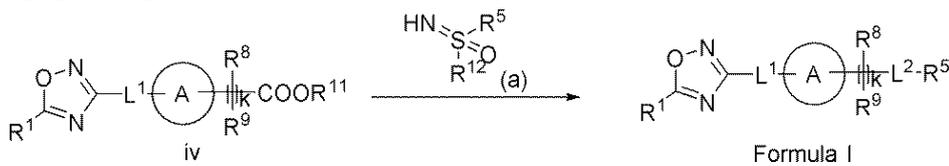
10

【 0 1 4 7】

d) 式 iv の化合物を式 (a) のスルホキシミン化合物と反応させて式 (I) の化合物を得る。

【 0 1 4 8】

【化 1 4】



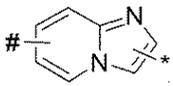
20

【 0 1 4 9】

ここで、L¹ は直接結合であり、A は

【 0 1 5 0】

【化 1 5】



であり；R¹、k、R⁸、R⁹、L²、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【 0 1 5 1】

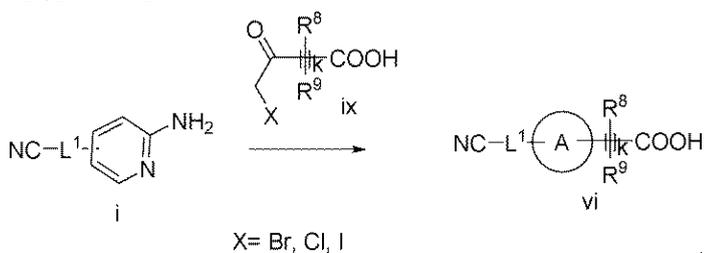
別の実施形態において、本発明は、以下の工程を含む式 (I) の化合物の調製のためのプロセスを提供する。

【 0 1 5 2】

a) 式 i の化合物を式 ix の化合物と反応させて式 vi の化合物を得る。

【 0 1 5 3】

【化 1 6】



40

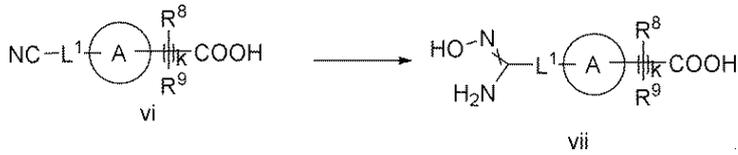
【 0 1 5 4】

b) 式 vi の化合物をヒドロキシルアミンと反応させて、式 vii の化合物を得る。

【 0 1 5 5】

50

【化17】

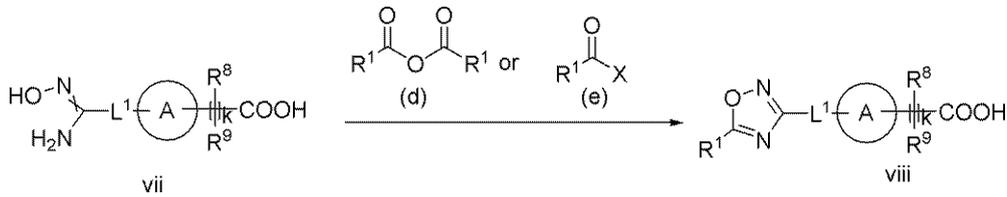


【0156】

c) 式viiの化合物を式(d)の酸無水物又は式(e)の酸塩化物化合物と反応させて、式viiiの化合物を得る。

【0157】

【化18】



【0158】

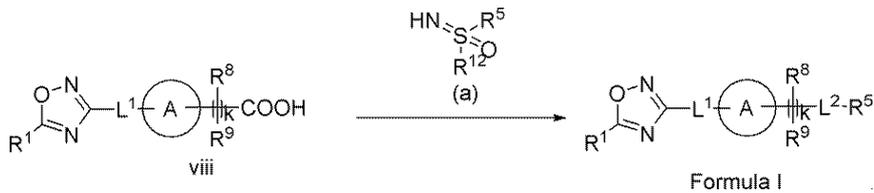
ここで、X=Br、Cl又はI；

【0159】

d) 式viiiの化合物を式(a)の化合物と反応させて式(I)の化合物を得る。

【0160】

【化19】

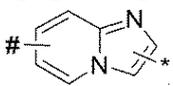


【0161】

ここで、L¹は直接結合であり、Aは

【0162】

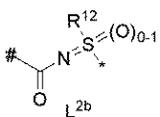
【化20】



であり；そしてL²は

【0163】

【化21】



であり；R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【0164】

さらに別の実施形態では、本発明は、以下の工程を含む式(I)の化合物を調製するためのプロセスを提供する。

【0165】

a) 式iの化合物を式xの化合物と反応させて、式xiの化合物を得る。

10

20

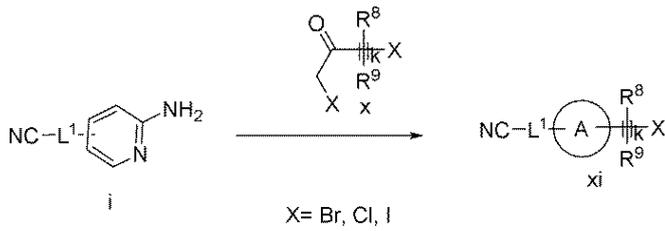
30

40

50

【 0 1 6 6 】

【 化 2 2 】

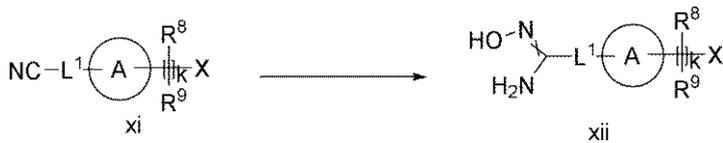


【 0 1 6 7 】

b) 式xiの化合物をヒドロキシルアミンと反応させて、式xiiの化合物を得る。

【 0 1 6 8 】

【 化 2 3 】



【 0 1 6 9 】

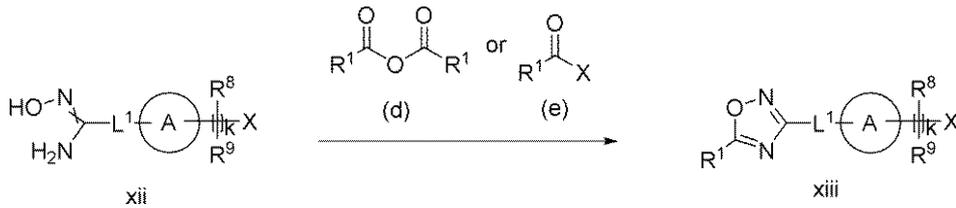
ここで、Xは Br、Cl、又はIである。

【 0 1 7 0 】

c) 式xiiの化合物を式(d)の酸無水物又は式(e)の酸塩化物化合物と反応させて、式xiiiの化合物を得る。

【 0 1 7 1 】

【 化 2 4 】



【 0 1 7 2 】

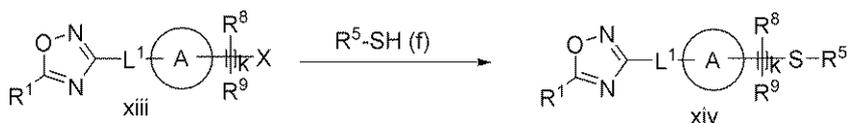
ここで、Xは Br、Cl、又はIである。

【 0 1 7 3 】

d) 式xiiiの化合物を式(f)の化合物と反応させて、式xivの化合物を得る。

【 0 1 7 4 】

【 化 2 5 】

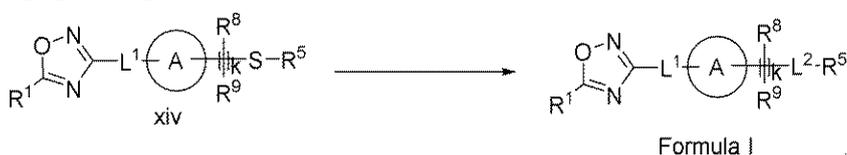


【 0 1 7 5 】

e) 式xivの化合物を適切な酸化剤で酸化して式(I)の化合物を得る。

【 0 1 7 6 】

【 化 2 6 】



10

20

30

40

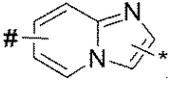
50

【 0 1 7 7 】

ここで、L¹は直接結合あり、Aは

【 0 1 7 8 】

【 化 2 7 】



であり；L²は-S(=O)₀₋₂-である。R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【 0 1 7 9 】

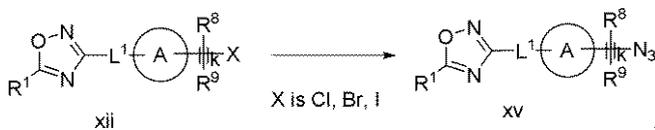
さらに別の実施形態では、本発明は、以下の工程を含む式 (I) の化合物を調製するためのプロセスを提供する。

【 0 1 8 0 】

a) 式 x i i の化合物を適切なアルカリ金属アジド化合物と反応させて、式 x v の化合物を得る。

【 0 1 8 1 】

【 化 2 8 】



【 0 1 8 2 】

b) 式 x v の化合物を適切な還元剤と反応させて、式 x v i の化合物を得る。

【 0 1 8 3 】

【 化 2 9 】

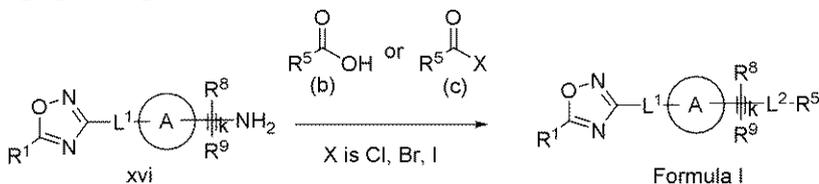


【 0 1 8 4 】

c) 式 x v i の化合物を式 (b) のカルボン酸又は式 (c) のカルボン酸クロリド化合物と反応させて、式 (I) (Formula I) の化合物を得る。

【 0 1 8 5 】

【 化 3 0 】

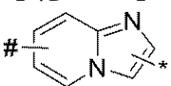


【 0 1 8 6 】

ここで、L¹は直接結合であり、Aは

【 0 1 8 7 】

【 化 3 1 】

であり、L²は

【 0 1 8 8 】

10

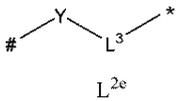
20

30

40

50

【化32】



であって、Yは-NR¹⁰であり、

【0189】

L³はC(=O)- ; R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【0190】

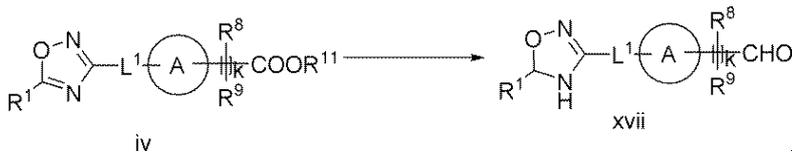
さらに別の実施形態では、本発明は、以下の工程を含む式(I)の化合物を調製するためのプロセスを提供する。 10

【0191】

a) 式ivの化合物を適切な還元試薬と反応させて、式xviiの化合物を得る。

【0192】

【化33】



20

【0193】

b) 式xviiの化合物を適切な酸化剤と反応させて、式xviiiの化合物を得る。

【0194】

【化34】

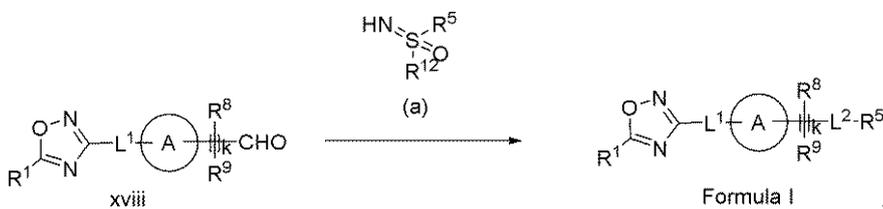


【0195】

c) 式xviiiの化合物を式(a)のスルホキシミン化合物と反応させて、式(I) (30 Formula I) の化合物を得る。

【0196】

【化35】

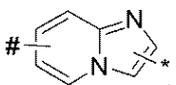


【0197】

ここで、L¹は直接結合であり、Aは

【0198】

【化36】



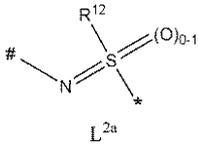
であり、L²は

【0199】

40

50

【化37】



であり、R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【0200】

一般式(I)によって及び/又は表1から12に定義される本発明の化合物は、既知の方法で、スキーム1~5に記載されるような様々な方法で、調製することができる。

【0201】

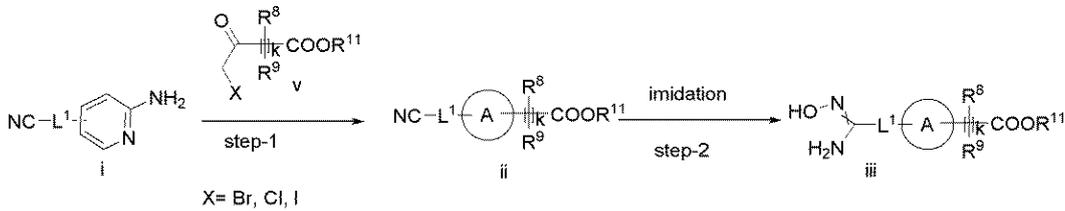
式(I)の化合物は、スキーム1に示されるようなプロセスを使用することによって調製することができる。

【0202】

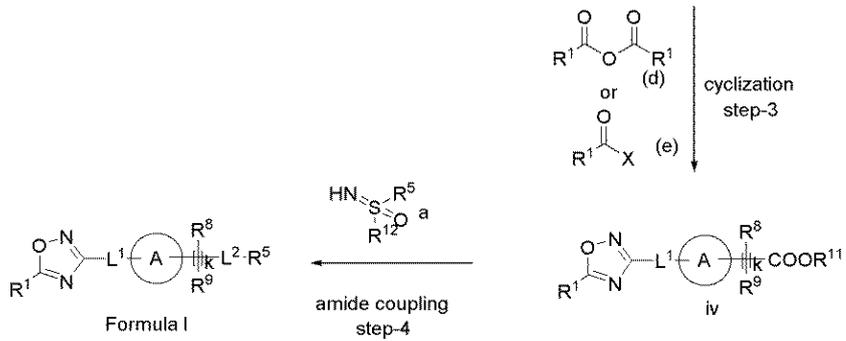
スキーム1

【0203】

【化38】



20



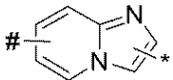
30

【0204】

ここで、L¹は直接結合であり、Aは

【0205】

【化39】

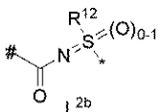


40

である。L²は

【0206】

【化40】



であり、R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

50

【 0 2 0 7 】

式 i i の化合物は、エタノールなどの極性プロトン性溶媒の存在下で、場合により酢酸などの酸の存在下で、還流温度で、式 i の 2 - アミノピリジン化合物及び式 v のアルファ - ハロカルボニル化合物を反応させることによって調製することができる。

【 0 2 0 8 】

式 i i i の化合物は、式 i i の化合物を、エタノール、メタノールなどの極性プロトン性溶媒の存在下、周囲温度から 6 0 でヒドロキシルアミンと反応させることによって調製することができる。この反応は、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサンなどの溶媒でも行うことができる。

【 0 2 0 9 】

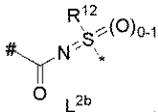
式 i v の化合物は、場合によりトリエチルアミン又はN,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの有機塩基の存在下で、式 i i i の化合物を式 (d) の酸無水物と反応させることによって調製することができる。又は、式 i i i の化合物を、場合によりトリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミンなどの有機塩基の存在下で式 (e) の酸塩化物化合物と反応させて、式 i v の所望の化合物を得ることができる。通常、この反応は、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジクロロメタンなどの非プロトン性溶媒中で、0 ~ 6 0 ° C の温度で実行される。

【 0 2 1 0 】

L 2 が

【 0 2 1 1 】

【 化 4 1 】



である式 I の化合物は、カップリング試薬としてトリメチルアルミニウムを使用することにより、式 i v のエステル化合物と式 (a) のスルホキシミン化合物とを反応させることにより得ることができる。この反応は、トルエン、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサンなどの溶媒中で0-110 ° Cで行うことができる。

【 0 2 1 2 】

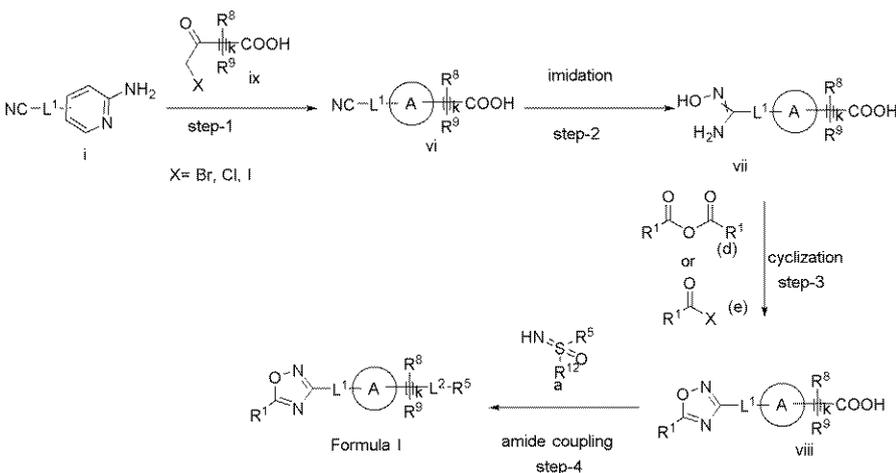
又は、式 (I) の化合物は、スキーム 2 に示されるようなプロセスを使用することによって調製することもできる。

【 0 2 1 3 】

スキーム 2

【 0 2 1 4 】

【 化 4 2 】



【 0 2 1 5 】

10

20

30

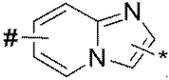
40

50

ここで、L¹は直接結合であり、Aは

【0216】

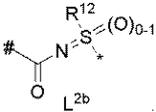
【化43】



であり；L²は

【0217】

【化44】



であり、R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【0218】

式v iの化合物は、任意選択で、酢酸などの有機酸の存在下で、式iの化合物及び式i xの化合物を反応させることによって得ることができる。この反応は、テトラヒドロフランや1,4-ジオキサンなどの溶媒中で、25 °Cで還流温度で行うことができる。

【0219】

式viiの化合物は、式viの化合物をテトラヒドロフラン、1,4-ジオキサンなどの非プロトン性溶媒中で0 ~ 60 °Cでヒドロキシルアミンと反応させることにより得ることができる。

【0220】

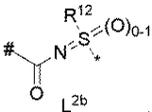
式v i i iの化合物は、必要に応じて、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンなどの塩基の存在下で、式v iの化合物と式(d)の酸無水物とを反応させることによって調製することができる。又は、式viiの化合物を、場合によりトリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンなどの有機塩基の存在下で式(e)の酸塩化物化合物と反応させて、式viiの所望の化合物を得ることができる。通常、この反応は、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジクロロメタンなどの非プロトン性溶媒中で、0 ~ 60 °Cの温度で実行される。

【0221】

L²が

【0222】

【化45】



である式Iの化合物は、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(4-ジメチルアミノピリジンの存在下)、1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[2,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスフェート(HATU)などのアミドカップリング試薬を使用することにより、式v i iの酸性化合物と式(a)のスルホキシミン化合物とを反応させることにより得ることができる。この反応は0-60 °Cで行うことができる。

【0223】

又は、式(I)の化合物は、スキーム3に示されるようなプロセスを使用することによって調製することもできる。

【0224】

スキーム3

10

20

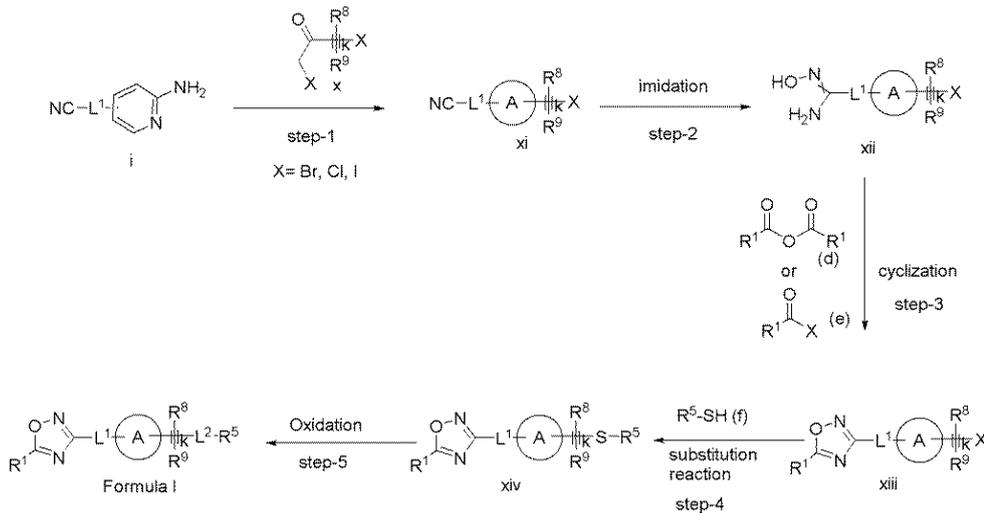
30

40

50

【 0 2 2 5 】

【 化 4 6 】



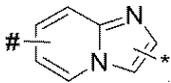
10

【 0 2 2 6 】

ここで、L¹は直接結合である。Aは

【 0 2 2 7 】

【 化 4 7 】



20

であり；L²は-S(=O)₀₋₂-；R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【 0 2 2 8 】

式 x i の化合物は、エタノール、メタノールなどの極性プロトン性溶媒中で式 i の化合物を式 x の化合物と反応させることによって得ることができる。

【 0 2 2 9 】

式 x i i の化合物は、式 x i の化合物をエタノール、メタノールなどの溶媒中でヒドロキシルアミンと反応させることによって得ることができる。この反応は、0 ~ 60 の温度で実施することができる。

30

【 0 2 3 0 】

式 x i i i の化合物は、式 x i i の化合物を、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン又は1,4-ジオキサンなどの溶媒中で式 (d) の酸無水物又は式 (e) の酸塩化物と環化することによって得ることができる。この反応は、任意にトリエチルアミン又はジイソプロピルエチルアミンなどの有機塩基の存在下で、0 ~ 60 の温度で実施することができる。

【 0 2 3 1 】

式 x i v の化合物は、式 x i i i の化合物及び式 (f) のチオール化合物を、炭酸カリウム、炭酸セシウムなどの塩基の存在下で反応させることによって得ることができる。この反応は、アセトニトリル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの溶媒中で行うことができる。

40

【 0 2 3 2 】

L²が-S(=O)₀₋₂-である式 I の化合物は、オキシソ、m-クロロ過安息香酸などの適切な当量の酸化剤を使用することによる式 x i v の硫化物化合物の酸化によって得ることができる。この反応は、ジクロロメタンなどの溶媒中で0 °C ~ 35 °Cの温度で行うことができる。

【 0 2 3 3 】

一実施形態では、式 (I) の化合物は、スキーム 4 に示されるようなプロセスを使用することによって調製することができる。

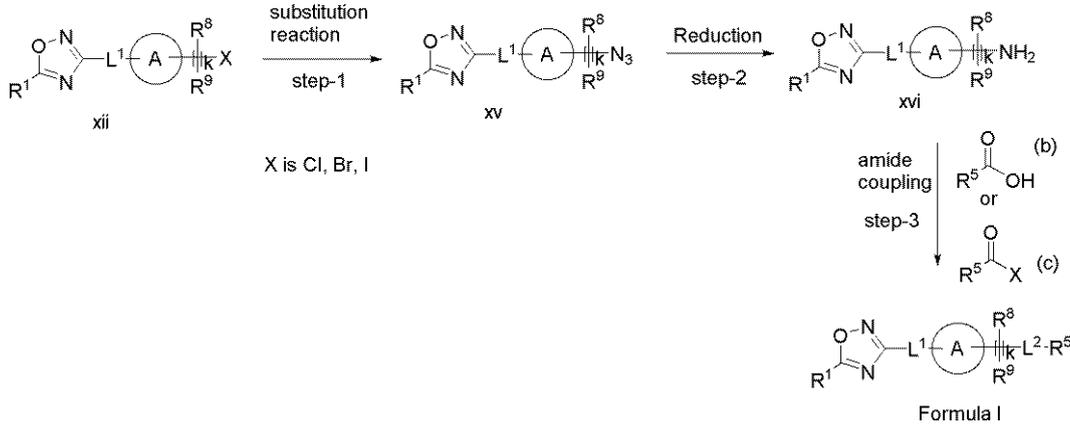
50

【 0 2 3 4 】

スキーム 4

【 0 2 3 5 】

【 化 4 8 】



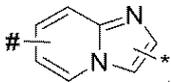
10

【 0 2 3 6 】

ここで、L¹は直接結合である。Aは

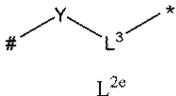
【 0 2 3 7 】

【 化 4 9 】

であり；L²は

【 0 2 3 8 】

【 化 5 0 】



であり、ここで、Yは -NR¹⁰であり、L³は -C(=O)-；R¹、k、R⁸、R⁹及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義された通りである。

30

【 0 2 3 9 】

式xvのアジド化合物は、式xiiの化合物と、アジ化ナトリウム、アジ化カリウムなどのアルカリ金属アジドを、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒中で反応させることによって得ることができる。この反応は0-60°Cの温度で行うことができる。

【 0 2 4 0 】

式xviのアミン化合物は、トリフェニルホスフィン及び水の存在下でシュタウディングー反応条件によって式xvのアジド化合物を反応させることによって合成することができる。この反応は、テトラヒドロフランなどの溶媒中で行うことができる。

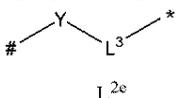
40

【 0 2 4 1 】

式(I)の化合物であって、L²は、

【 0 2 4 2 】

【 化 5 1 】



であり；Yが-NR¹⁰、L³が-C(=O)-である式(I)の化合物は、式xviのアミン化合物と式(B)のカルボン酸を トリエチルアミン又はジイソプロピルエチルアミンなどの有機塩基の存在下で1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド-ヒドロキシ

50

ベンゾトリアゾール又は1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[2,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスフェートなどの適切なカップリング試薬を使用することによって従来のアミドカップリング反応を実施することによって調製することができる。又は、式(i)の化合物は、式xviのアミン化合物を、トリエチルアミン又はジイソプロピルエチルアミン又はピリジンなどの有機塩基の存在下で式cのカルボン酸塩化物と反応させることによって得ることができる。

【0243】

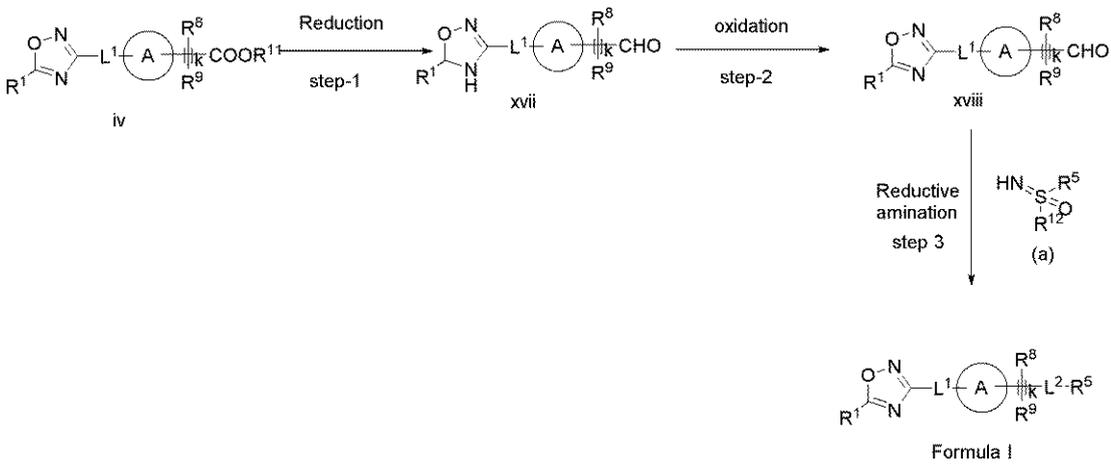
別の実施形態では、式(i)の化合物は、スキーム5に示されるようなプロセスを使用することによって調製することができる。

【0244】

スキーム5

【0245】

【化52】

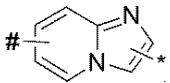


【0246】

ここで、L¹は直接結合であり、Aは

【0247】

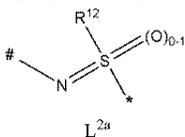
【化53】



であり；L²は

【0248】

【化54】



であり；R¹、k、R⁸、R⁹、及びR⁵は、上記の詳細な説明で定義されているとおりである。

【0249】

式xviiiの化合物は、式ivの化合物を水素化ジイソブチルアルミニウム(DIBAL-H)などの適切な還元剤で還元することによって調製することができる。この反応は、ジクロロメタン、テトラヒドロフランなどの溶媒中で、-78°C~-50°Cの温度で行うことができる。

【0250】

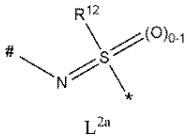
式xviiiの化合物は、0~-35°Cでジクロロメタンなどの溶媒中の適切な酸化試薬2,3-ジクロロ-5、

6 - ジシアノ - 1, 4 - ベンゾキノンを使用することによる式 x v i i のジヒドロ - オキサジアゾール化合物の酸化によって調製することができる。

【 0 2 5 1 】

L 2 が

【 化 5 5 】



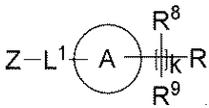
である式 I の化合物は、温度 1 2 5 ~ 1 3 5 で、式 x v i i i のアルデヒド化合物及び式 (a) のスルホキシミン化合物のマイクロ波支援還元的アミノ化によって調製することができる。

【 0 2 5 2 】

一実施形態では、本発明は式 (B) の化合物を提供する。

【 0 2 5 3 】

【 化 5 6 】



【 0 2 5 4 】

式 (B)

【 0 2 5 5 】

ここで、

【 0 2 5 6 】

Z は

【 0 2 5 7 】

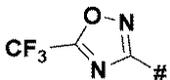
【 化 5 7 】



又は

【 0 2 5 8 】

【 化 5 8 】



であり、ここで、「#」はL1への接続点を示す。

【 0 2 5 9 】

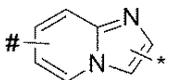
L1は直接結合であり、

【 0 2 6 0 】

Aは

【 0 2 6 1 】

【 化 5 9 】



である。

【 0 2 6 2 】

R8及びR9は、水素、ハロゲン、シアノ、C1-C6-アルキル、C1-C6-ハロアルキル、C1 50

-C₆-アルコキシ、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル及びC₃-C₈-シクロアルキルからなる群から独立して選択され；

【0263】

kは0から1の範囲の整数である。

【0264】

Rⁱは水素、アジド、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、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、アミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ、NHSO₂-C₁-C₆-アルキル、-S(=O)(=NH)-C₁-C₆-アルキル；-C(=O)-C₁-C₆-アルキル、C(=O)-C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-アルキルスルホニル、ヒドロキシ-C₁-C₆-アルキル、-C(=O)-NH₂、C(=O)-NH(C₁-C₆-アルキル)、C₁-C₆-アルキルチオ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、ジ-C₁-C₆-アルキルアミノ-C₁-C₆-アルキル、アミノカルボニル-C₁-C₆-アルキル及びC₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル；からなる群から選択され；

10

【0265】

ただし、以下の化合物が式(I)の化合物の定義から除外されるという条件で；

【0266】

エチル(Z)-2-(6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート、6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸及びエチル(Z)-2-(7-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート。

20

【0267】

好ましい実施形態では、式(B)の化合物は、

7-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸；

エチル2-(7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート；

7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸；

7-(5-(トリフルオロメチル)-2,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

30

7-(5-(トリフルオロメチル)-2,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド；

3-(2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール；

3-(2-(アジドメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール；

エチル2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート；

6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸；

40

エチル2-(6-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート；

6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

6-(5-(トリフルオロメチル)-2,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド；

3-(2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール；

2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド；

3-(2-(アジドメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル

50

) -1,2,4-オキサジアゾール及び
イミノ(メチル)(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノンから選択される。

【0268】

一実施形態では、本発明は、式(I)の化合物、農業的に許容される塩、金属錯体、構成異性体、立体異性体、ジアステレオ異性体、エナンチオマー、キラル異性体、アトロプ異性体、配座異性体、回転異性体、互変異性体、光学異性体異性体、多形体、幾何異性体、又はそれらのN-オキシドと、任意選択で、不活性担体などの補助剤を伴う1つ又は複数の追加の活性成分、又は界面活性剤、添加剤、固体希釈剤及び液体希釈剤などの他の必須成分を含む組成物に関する。

10

【0269】

式Iの化合物及び本発明による組成物は、それぞれ、殺菌剤として適切である。それらは、特にプラスモディオフォロミセテス、ペロノスポロミセテス(同義卵菌)、キトリジオミセテス、接合菌門、子囊菌類、担子菌類及び重水素菌(不完全菌類)のクラスに由来する土壤伝染性真菌を含む広範囲の植物病原性真菌に対する卓越した有効性によって区別される。いくつかは全身的に効果的であり、葉面殺菌剤、種子ドレッシング用殺菌剤及び土壤殺菌剤として作物保護に使用することができる。さらに、それらは、とりわけ木又は植物の根に発生する有害な真菌を防除するのに適している。

【0270】

式(I)の化合物及び本発明による組成物は、様々な栽培植物上の多数の植物病原性真菌の防除において特に重要である。例えば小麦、ライ麦、大麦、ライコムギ、オーツ麦又は米；テンサイや飼料用ビートのようなビートなどの穀物；ナシ状果、核果、又はリンゴ、ナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボ、イチゴ、ラズベリー、ブラックベリー、グーズベリーなどの柔らかい果物などの果物；レンズ豆、エンドウ豆、アルファルファ、大豆などのマメ科植物；菜種、マスタード、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、ココア豆、ヒマシ油植物、アブラヤシ、落花生、大豆などの油性植物；スカッシュ、キュウリ、メロンなどのウリ；綿、亜麻、麻、ジュートなどの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ、みかんなどの柑橘系の果物；ほうれん草、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモ、ウリ、パプリカなどの野菜；アボカド、シナモン、樟脳などの月桂樹植物；トウモロコシ、大豆、菜種、サトウキビ、アブラヤシなどのエネルギー及び原材料の植物；コーン；タバコ；ナッツ；コーヒー；お茶；バナナ；ブドウの木(テーブルグレープとグレープジュースブドウのつる)；ホップ；芝；甘い葉(ステビアとも呼ばれる)；天然ゴム植物又は花、低木、広葉樹、針葉樹のような常緑樹などの観賞用及び林業用植物；種子などの植物繁殖材料、及びこれらの植物の作物材料。

20

30

【0271】

特に、式Iの化合物及び本発明による組成物は、ダイズ及び種子などの植物繁殖材料、ならびにダイズの作物材料上の植物病原性真菌の防除において重要である。したがって、本発明はまた、式Iの少なくとも1つの化合物を含む組成物及び種子を含む。組成物中の式Iの化合物の量は、100kgの種子あたり0.1gai(有効成分あたりのグラム)から10kgai(有効成分あたりのキログラム)の範囲である。

40

【0272】

好ましくは、式(I)の化合物及びその組成物は、それぞれ、ジャガイモ、テンサイ、タバコ、コムギ、ライムギ、オオムギ、オート麦、米、トウモロコシ、綿、大豆、レイプ、マメ科植物、ヒマワリ、コーヒー又はサトウキビ；果物；ブドウの木；観賞用；又は、きゅうり、トマト、豆、スカッシュなどの野菜などの畑作物上の多数の真菌を防除するために使用される。

【0273】

「植物繁殖材料」という用語は、種子などの植物のすべての生殖又は生殖部分、ならびに挿し木及び塊茎(例えば、ジャガイモ)などの栄養植物材料を意味すると理解されるべきであり、これらは植物の増殖に使用することができる。これには、種子、根、果実、塊茎

50

、球根、根茎、新芽、芽、小枝、花、及び発芽後又は土壌からの出芽後に移植される苗木及び若い植物を含む植物の他の部分が含まれる。

【0274】

これらの若い植物はまた、移植前に、浸漬又は注入による全体的又は部分的な処理によって保護され得る。

【0275】

好ましくは、式Iの化合物、それらの組み合わせ及び/又は組成物による植物繁殖材料の処理は、それぞれ、コムギ、ライ麦、オオムギ及びオーツ麦、米、とうもろこし、綿花、大豆などの穀類上の多数の真菌を防除するために使用される。

【0276】

「栽培植物」という用語は、市場又は開発中の農業バイオテクノロジー製品を含むがこれらに限定されない、育種、突然変異誘発、又は遺伝子工学によって改変された植物として理解されるべきである (<http://cera-gmc.org/>を参照、そのGM作物データベースを参照)。遺伝子組み換え植物とは、組換えDNA技術を使用して遺伝物質を改変した植物であり、自然環境下では、交雑育種、突然変異、又は自然組換えでは容易に入手できないものである。通常、植物の特定の特性を改善するために、1つ又は複数の遺伝子が遺伝子組み換え植物の遺伝物質に組み込まれている。そのような遺伝子改変には、例えば、グリコシル化又はプレニル化、アセチル化又はファルネシル化部分などのポリマー付加によるタンパク質、オリゴ又はポリペプチドの標的化された翻訳後修飾又はPEG部分も含まれるが、これらに限定されない。ディカンバや2,4-Dなどのオーキシンの除草剤などの特定のクラスの除草剤の適用に耐性を持たせた植物例えば育種、突然変異誘発、又は遺伝子工学によって改変されたもの；ヒドロキシルフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (HPPD) 阻害剤又はフィトエンデサチウラーゼ (PDS) 阻害剤などの漂白除草剤；スルホニル尿素又はイミダゾリノンなどのアセト乳酸シンターゼ (ALS) 阻害剤；グリホサートなどのエノールピルピルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ (EPSPS) 阻害剤；グルホシネートなどのグルタミンシンターゼ (GS) 阻害剤；プロトポルフィリノーゲン-IXオキシダーゼ阻害剤；アセチルCoAカルボキシラーゼ (ACCase) 阻害剤などの脂質生合成阻害剤；又は、従来の育種方法又は遺伝子工学の結果としてのオキシニル (すなわち、プロモキシニル又はアイオキシニル) 除草剤；さらに、グリホサートとグルホシネートの両方、又はグリホサート及びALS阻害剤、HPPD阻害剤、オーキシン除草剤、ACCase阻害剤などの別のクラスの除草剤の両方に対する耐性など、複数の遺伝子組み換えによって複数のクラスの除草剤に耐性を持たせた植物。これらの除草剤耐性技術は、例えばPest Managem. Sci. 61, 2005, 246 ; 61, 2005, 258 ; 61, 2005, 277 ; 61, 2005, 269 ; 61, 2005, 286 ; 62, 2008, 326 ; 62, 2008, 332 ; Weed Sci. 57, 2009, 108 ; Austral. J. Agricult. Res. 58, 2007, 708 ; Science 316, 2007, 1185及びそこに引用されている参考文献で説明されている。いくつかの栽培植物は、従来の育種方法 (突然変異誘発) によって除草剤に耐性をもっている。例えば、Clearfield (商標) サマーレイブ (Canola, BASF SE, ドイツ) はイミダゾリノンに耐性をもっている。例えば、イマザモックス、又はExpressSun (商標) ヒマワリ (デュポン、米国) は、トリベヌロンのようなスルホニル尿素に耐性がある。遺伝子工学的手法は、大豆、綿花、トウモロコシ、ビート、菜種などの栽培植物をグリホサートとグルホシネートなどの除草剤に耐性にするために使用されてきた。そのうちのいくつかは、RoundupReady (商標) (グリホサート耐性、モンサント、米国)、Cultivance (商標) (イミダゾリノン耐性、BASF SE, ドイツ) 及びLibertyLink (商標) (グルホシネート耐性、バイエルクロップサイエンス、ドイツ) の商品名で市販されている。

【0277】

さらに、組換えDNA技術を使用することにより、1つ以上の殺虫性タンパク質、特に細菌属 (バチルス) から知られているものを合成することができる植物は、本発明の範囲内である。バチルスは、特に、CryIA (b)、CryIA (c)、CryIF、CryIF (a2)、CryIIA (b)、CryIIIA、CryIIIB (b1) 又はCry9cなどの δ -エンドトキシンなどのバチル

10

20

30

40

50

スチューリンゲンシスに由来する。栄養殺虫性タンパク質（VIP）、例えばVIP1、VIP2、VIP3又はVIP3A；線虫にコロニーを形成する細菌の殺虫性タンパク質、例えば、*Photorhabdus* spp. 又は *Xenorhabdus* spp.；サソリ毒素、クモ類毒素、ハチ毒素、又は他の昆虫特異的神経毒など、動物によって産生される毒素。Streptomyces毒素、エンドウ豆又は大麦レクチンなどの植物レクチンなどの真菌によって産生される毒素；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン又はパイン阻害剤などのプロテイナーゼ阻害剤。リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリン、プリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質（RIP）；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリン、プリオジンなど；3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-IDP-グリコシルトランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤又はHMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素；ナトリウム又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体（ヘリコキニン受容体）；スチルベンシターゼ、ピベンジルシターゼ、キチナーゼ又はグルカナナーゼ；本発明の文脈において、これらの殺虫性タンパク質又は毒素は、プレトキシン、ハイブリッドタンパク質、短縮型又は他の方法で修飾されたタンパク質としても明確に理解されるべきである。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新しい組み合わせによって特徴付けられる（例えば、WO02 / 015701を参照）。そのような毒素又はそのような毒素を合成することができる遺伝子改変植物のさらなる例は、例えば、EP374753、WO93 / 007278、WO95 / 34656、EP427 529、EP451 878、WO03 / 18810及びWO03 / 520 73に開示されている。そのような遺伝子改変植物を生産するための方法は、一般に当業者に知られており、上記の刊行物などに記載されている。遺伝子改変植物に含まれるこれらの殺虫性タンパク質は、これらのタンパク質を産生する植物に、節足動物のすべての分類群からの有害な害虫、特に甲虫（甲虫目）、両翼昆虫（双翅目）、蛾（鱗翅目）及び線虫（線虫）に対する耐性を付与する。1つ又は複数の殺虫性タンパク質を合成することができる遺伝子組み換え植物は、例えば、上記の出版物に記載されており、YieldGard（商標）（Cry1Ab毒素を産生するトウモロコシ品種）、YieldGard（商標）Plus（Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を産生するトウモロコシ品種）、Starlink（商標）（Cry9c毒素）、Herculex（商標）RW（Cry34Ab1、Cry35Ab1及び酵素ホスフィノトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ[PAT]を生産するトウモロコシ栽培品種）；NuCOTN（商標）33B（Cry1Ac毒素を産生するワタ品種）、Bollgard（商標）I（Cry1 Ac毒素を産生するワタ品種）、Bollgard（商標）II（Cry1Ac及びCry2Ab2毒素を産生するワタ品種）；VIPCOT（商標）（VIP毒素を産生するワタ栽培品種）；NewLeaf（商標）（Cry3A毒素を産生するジャガイモ栽培品種）；Bt-Xtra（商標）、NatureGard（商標）、KnockOut（商標）、BiteGard（商標）、Protecta（商標）、Bt1 1（例：AgriSure（商標）CB）、フランスのシンジェンタシードSASのBt176（Cry1Ab毒素とPAT酵素を生産するトウモロコシ品種）、フランスのシンジェンタシードSASのMIR604（トウモロコシ Cry3A毒素の改変バージョンを生産する栽培品種、WO 03/018810を参照）、フランスのモンサントヨーロッパSAからのMON 863（Cry3Bb1毒素を生産するトウモロコシ栽培品種）、ベルギーのモンサントヨーロッパS.A.からのIPC531（Cry1Ac毒素の改変バージョンを生産する綿栽培品種）及びベルギーのバイオニアオーバースープレーションからの1507（Cry1 F毒素及びPAT酵素を生産するトウモロコシ栽培品種）。

【0278】

さらに、1つ又は複数のタンパク質を合成して、組換えDNA技術を使用することにより、細菌、ウイルス、又は真菌の病原体に対するそれらの植物の抵抗又は耐性を高めることができる植物もまた、本発明の範囲内である。そのようなタンパク質の例は、いわゆる「病原性関連タンパク質」（PRタンパク質、例えばEP392225を参照）、植物病害抵抗性遺伝子（例えば、メキシコの野生ジャガイモ *Solanum bulbocastanum* に由来する *Phytophthora infestans* に対して作用する耐性遺伝子を発現するジャガイモ栽培品種）

である。又はT4-リゾチーム（例えば、*Erwinia amylovora*などの細菌に対する耐性を高めてこれらのタンパク質を合成できるジャガイモ栽培品種）。そのような遺伝子改変植物を生産するための方法は、一般に当業者に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。

【0279】

さらに、組換えDNA技術を使用して、1つ又は複数のタンパク質を合成し、生産性（例えば、バイオ大量生産、穀物収量、デンプン含有量、油含有量又はタンパク質含有量）、干ばつに対する耐性、塩分又はその他の成長を高めることができる植物-環境要因又はそれらの植物の害虫及び真菌、細菌又はウイルス病原体に対する耐性を制限することは、本発明の範囲内である。

10

【0280】

さらに、組換えDNA技術を使用して、人間又は動物の栄養を改善するために、変更された量の含有物質又は新しい含有物質を含む植物、例えば、健康を促進する長鎖オメガ-3脂肪酸又は不飽和オメガ-9脂肪酸を生産する油糧作物（例えば、Nexera（商標）レイブ、DOW Agro Sciences、カナダ）も本発明の範囲内である。

【0281】

さらに、組換えDNA技術を使用して、原料生産を改善するために、変更された量の含有物質又は新しい含有物質を含む植物、例えば、アミロペクチンの量を増加させるジャガイモ（例えば、Amflora（商標）ジャガイモ、BASF SE、ドイツ）も本発明の範囲内である。

20

【0282】

本発明はまた、農作物及び/又は園芸作物における植物病原性微生物による植物の侵入を制御又は防止するための方法に関する。ここで、有効量の式Iの少なくとも1つの化合物又は本発明の組み合わせ又は本発明の組成物が、植物の種子に適用される。本発明の化合物、組み合わせ及び組成物は、植物病害を防除又は予防するために使用することができる。式Iの化合物、それらの組み合わせ及び/又は組成物は、それぞれ、以下の植物病害を防除するのに特に適している。

【0283】

アルブゴ属（白さび病）：観賞用植物、野菜（例：A. Candida）及びヒマワリ（例：A. トラゴゴニス）；アルテマリア属（*Alternaria*リーフスポット）野菜、菜種（A. brassicola又はbrassicae）、テンサイ（A. tenuis）、果物、米、大豆、ジャガイモ（A. solani又はA. alternataなど）、トマト（A. solani又はA. solanataなど）及び小麦（A. alternata）*Aphanomyces* spp.：テンサイと野菜；穀物や野菜上のアスコキタ属、例えば小麦のA. tritici（炭疽病）と大麦のA. hordei；*Bipolaris*及び*Drechslera* spp.（teleomorph：Cochliobolus spp.）、トウモロコシのサザンリーフブライト（Southern leaf blight）（D. maydis）又はノーザンリーフブライト（Northern leaf blight）（B. zeicola）、穀物のスポットブロッチ（B. sorokiniana）、イネや芝のB. oryzaeなど；穀物（小麦や大麦など）のブルメリア（旧エリシフェ）グラミニス（うどんこ病）；果物やベリー（イチゴなど）、野菜の灰色かび病*Botrytis cinerea*（有性世代：Botryotinia fuckeliana：灰色かび病）；（レタス、ニンジン、セロリ、キャベツなど）、菜種、花、ブドウの木、林業植物、小麦；レタスの*Bremia lactucae*（べと病）；広葉樹及び常緑樹上の*Ceratocystis*（syn. *Ophiostoma*） spp.（腐敗又はしおれ）、ニレのC. ウルミ（オランダのニレ病）；セルコスポラ属：トウモロコシ（例：灰色の葉の斑点：C. zea-maydis）、米、テンサイ（例：C. beticola）、サトウキビ、野菜、コーヒー、大豆（例：C. soja又はC. kikuchii）及びイネ；クラドスポリウム属：トマト（例：C. fulvum：葉型）及び穀物、小麦のC. herbarum（黒い耳）；穀物の麦角菌（麦角）；コクリオポルス（無性世代：Bipolarisのヘルミントスポリウム） spp.：（葉の斑点）トウモロコシ（C. carbonum）、穀物（例：C. sativus、無性世代：B. sorokiniana）及びイネ（例：C. miyabeanus、無性世代：H. oryzae）；コレトリカム（有性世代：グロメレラ）属：（炭疽病）綿（例：C. goss

30

40

50

ypii)、トウモロコシ(例:C.graminicola:炭疽病の茎腐れ)、柔らかい果物、ジャガイモ(例:C.coccodes:黒い点)、豆(例:C.lindemuthianum)及び大豆(例:C.truncatum又はC.gloeosporioides);コルチシウム属:C.sasakii(シースプライト)イネ;大豆及び観賞植物のCorynespora cassiicola(葉の斑点);オリーブの木C.oleaginumなどのシクロコニウム属;シンドロカルボン属(例:果樹潰瘍又は若いブドウの衰退、有性世代:Nectria又はNeonectria spp.):果樹、ブドウの木(例:C.liriodendri、有性世代:Neonectria liriodendri:黒足病)及び観賞用植物;ダイズのDematophora(teleomorph:Rosellinia)necatrix(根と茎の腐敗);ダイズのD.phaseolorum(ダンピングオフ)などのDiaporthe spp.;Drechslera(シノニムHelminthosporium、有性世代:Pyrenophora)spp.:トウモロコシ、大麦(例:D.teres、ネットブロッツ)や小麦(例:D.tritici-repentis:黄斑)、いねなどの穀物及び芝;Formitiporia(syn.Phellinus)punctataによって引き起こされたブドウの木のEsca(胴枯れ(dieback)、アポプレキシー(apoplexy)、F.mediterranea、Phaeomoniella chlamydospora(初期のPhaeoacremonium chlamydosporum)、Phaeoacremonium maleophilum及び/又はBotryosphaeria obtusa;エルシノエ属:ナシ状果(E.pyri)、柔らかい果実(E.veneta:炭疽病)及びブドウの木(E.ampelina:炭疽病);イネのEntyloma oryzae(葉の黒穂菌);小麦上のEpicoccum spp.(黒カビ);エリシフェ属(うどんこ病)テンサイ(E.betae)、野菜(例:E.pisi)、ウリ(例:E.cichoracearum)、キャベツ、菜種(例:E.cruciferarum);Eutypa lata(Eutypa canker又は胴枯れ(dieback)、無性世代:果樹、ブドウの木、観賞用の木に対するEutypa lata(Eutypa canker又は立ち枯れ、無性世代:Cytosporina lata、syn.Libertella lepharis);Exserohilum(syn.Helminthosporium)spp.トウモロコシ(例:E.turcicum);フザリウム(有性世代:ジベレラ)属(しおれ、根又は茎の腐敗)穀物(例えば小麦又は大麦)のF.graminearum又はF.culmorum(根腐れ、かさぶた又は頭枯れ)、トマトのF.oxysporum、F.solani(f.sp.glycinesは現在syn.F.virguliforme)及びそれぞれ大豆に突然死症候群を引き起こすF.tucumaniaeとF.brasiliense、及びトウモロコシにそれを発生させるF.verticillioides;穀物(小麦や大麦など)とトウモロコシのGaeumannomyces graminis(テイクオール);ジベレラ属:穀物(例:G.zeae)及びいね(例:G.fujikuroi:馬鹿苗病);つる、ナシ状果及び他の植物のGloemerella cingulata及び綿のG.gossypii;いねの穀物染色複合体(Grainstaining complex);つるのGuignardia bidwellii(黒腐病);G.sabinae(さび)などのバラ科植物及びジュニパーの赤星病属ナシ;ヘルモントスポリウム属(シノニムDrechslera、有性世代:Cochliobolus):トウモロコシ、シリアル、いね;コーヒー上のH.vastatrix(コーヒー葉さび病)などのコーヒーさび病菌;つる植物のIsariopsis clavispora(シノニムCladosporium vitis);大豆と綿のMacrophomina phaseolina(syn.phaseoli)(根と茎の腐敗);穀物(小麦や大麦など)のMicrodochium(syn.Fusarium)nivale(ピンクの雪型);大豆のMicrosphaera diffusa(うどんこ病);核果及び他のバラ科植物上のM.laxa、M.fructicola及びM.fructigena(花及び小枝枯病、褐色腐敗病)などのモニリニア属;ミコスフェレラ属 穀物、バナナ、柔らかい果物と落花生、小麦のM.graminicola(無性世代:Septoria tritici、Septoriablotch)又はバナナのM.fijiensis(シガトカ病);ペロノスポラ属:(べと病)キャベツ(例:P.brassicae)、菜種(例:P.parasitica)、タマネギ(例:P.destructor)、タバコ(P.tabacina)及び大豆(例:P.manshurica);フィアロフォラ属:つる植物(例:P.tracheiphila及びP.tetraspora)及び大豆(例:P.gregata:茎の腐敗);菜種とキャベツのフォマリンガム(根腐れと茎腐れ)とテンサイのP.ベテ(根腐れ、葉の斑点と減衰);ホモプシス属:ヒマワリ、ブドウの木(例:P.viticola:缶と葉の斑点)及び大豆(例:茎の腐敗:P.phaseoli、有性世代:Diaporthe phaseolorum);トウモロコシのPhysoderma maydis(茶色の斑点);Phytophthora spp.(しおれ、根、葉、果実、茎の根)パプリカやウリ(例:P.capsici)などのさま

10

20

30

40

50

さまざまな植物、大豆（例：*P. megasperma*, syn. *P. sojae*）、大豆、ジャガイモ、トマト（例：*P. infestans*：疫病）及び広葉樹（例：*P. ramorum*：オークの突然死）；キャベツ、菜の花、大根及び他の植物の*Plasmodiophora brassicae*（クラブの根）；つる植物の*P. viticola*（ブドウのべと病）やヒマワリの*P. halstedii*などのプラズモパラ属；ポドスファエラ属（うどんこ病）バラ科植物、ホップ、ナシ状果、及びリンゴの*P. leucotricha*などの柔らかい果実；オオムギやコムギ（*P. graminis*）やテンサイ（*P. betae*）などの穀物に付着したポリミクサ属菌は、ウイルス性疾患を感染させる；コムギやオオムギなどの穀物に付着した*Pseudocercospora herpotrichoides*（アイスポット、有性世代：*Tapesia yallundae*）；ウリ科の*P. cubensis*やホップの*P. humili*などのさまざまな植物の*Pseudoperonospora*（べと病）；つるの*Pseudopezizomycetes tracheiphila*（赤い火のような病気（red fire disease）又は‘rotbrenner’、無性世代：*Fiaria foera*）；さまざまな植物上のブッチニア属（さび病）：*P. triticina*（茶色又は葉のさび病）、*P. striiformis*（縞模様又は黄色のさび病）、*P. hordei*（矮性さび病）、*P. graminis*（茎又は黒さび病）、又は小麦、大麦又はライ麦などの穀物上の*P. recondita*（茶色又は葉のさび病）、サビキンの*P. kuehnii*（オレンジ色のさび病）及びアスパラガスの*P. asparagi*；コムギ黄斑病（無性世代：*Drechslera tritici-repentis*（黄斑）又はオオムギ*P. teres*（ネットブロッチ）；イネの*P. oryzae*（有性世代：*Magnaporthe grisea*、イネいもち菌）や芝や穀物の*P. grisea*などの*Pyricularia* spp；*Pyricularia*属（減衰）：芝、イネ、トウモロコシ、小麦、綿、菜種、ヒマワリ、大豆、テンサイ、野菜、その他のさまざまな植物（*P. ultimum*や*P. aphanidermatum*など）；オオムギの*R. collo-cygni*（ラムラリアの葉の斑点、生理学的葉の斑点）やテンサイの*R. beticola*などのラムラリア属；リゾクトニア属 綿、米、ジャガイモ、芝、トウモロコシ、菜種、ジャガイモ、テンサイ、野菜、及びなどのさまざまな植物、例えば大豆の*R. solani*（根腐病）、米の*R. solani*（鞘枯病）又は小麦又は大麦の*R. secalis*（リゾクトニア春枯病）；イチゴ、ニンジン、キャベツ、ブドウの木、トマトの*Rhizopus stolonifer*（黒カビ、やわらかい腐敗）；オオムギ、ライムギ、ライコムギの*Rhynchosporium secalis*（熱傷）；さまざまな植物のセプトリア属 例えば、大豆の*S. glycines*（茶色の斑点）、小麦の*S. tritici*（*Septoria*斑点）、穀物の*S.*（syn. *Stagonospora*）*nodorum*（*Stagonospora*斑点）など；ブドウの木のうどんこ病菌（うどんこ病菌、無性世代：*Oidium tuckeri*）；セトスパエリア属（葉枯れ）トウモロコシ（例：*S. turcicum*, syn. *Helminthosporium turcicum*）及び芝；*Sphaelotheca* spp.（黒穂菌）：トウモロコシ（例：*S. reiliana*：糸黒穂病）、ソルガムとサトウキビ；ウリ科の*Sphaerotheca fuliginea*（うどんこ病）；ジャガイモの*Spongospora subterranea*（粉状かさぶた）及びそれによる伝染性ウイルス性疾患；穀類上のスタゴノスポラ属、例えば小麦の*S. nodorum*（*Stagonospora*ブロッチ、有性世代：*Leptosphaeria* [シノニム *Phaeosphaeria*] *nodorum*）；ジャガイモの*Synchytrium endobioticum*（ジャガイモ疣贅病）；桃の*T. deformans*（葉のカール病）やプラムの*T. pruni*（プラムポケット）などのタフリナ属；タバコ、ナシ状果、野菜、大豆、ワタ上の*Thielaviopsis* spp.（黒根腐れ）例えば、*T. basicola*（シノニム *Chalara elegans*）；小麦などの穀物上のティレティア属（一般的なバント（Bunt）又は臭い黒穂菌）例えば*T. tritici*（シノニム *T. caries*、小麦バント（Bunt））及び*T. controversa*（矮性バント（Bunt））；オオムギ又はコムギの*Typhulaincarnata*（灰色の雪型）；ライ麦の*U. occulta*（茎のスマット）などの*Urocystis* spp. ウロマイセス属（さび）豆（例：*U. appendiculatus*, syn. *U. phaseoli*）やテンサイ（例：*U. betae*）などの野菜；穀物上のウスチラゴ属（緩い黒穂菌）（例：*U. nuda*及び*U. avae-nae*）、トウモロコシ（例：*U. maydis*：トウモロコシ黒穂病）及びサトウキビ；ベンチュリア属（かさぶた）リンゴ（例：*V. inaequalis*）とナシ；及びバーティシリウム属（しおれ）：さまざまな植物の*V. dahliae*、例えば果物や観賞用植物、ブドウの木、柔らかい果物、野菜、イチゴ、菜種、ジャガイモ、トマト、畑作物など。

式Iの化合物、それらの組み合わせ又は組成物は、いくつかの真菌病原体を対処するために使用され得る。本発明に従って対処することができる真菌性疾患の病原体の非限定的な例には、以下が含まれる：

【0285】

Ustilaginoidea virens、Ustilago nuda、Ustilago tritici、Ustilago zeae、rustsなどのUstilaginales例えば、Cerotelium fici、Chrysomyxa arctostaphyli、Coleosporium ipomoeae、Hemileiavastatrix、Puccinia arachidis、Puccinia cacabata、Puccinia graminis、Puccinia recondita、Puccinia sorghi、Puccinia hordei、Puccinia striiformis f.sp. Hordei、Puccinia striiformis f.sp. Secalis、Pucciniastrum coryli、などのブッチニアによって引き起こされるもの又はCronartium ribicola、Gymnosporangium juniperi-virginianae、Melampsora medusae、Phakopsora pachyrhizi、Phragmidium mucronatum、Phytophthora ampelosioidis、Tranzschelia discolor、Uromyces viciae-fabaeなどのウレディナレス；及びクリプトコッカス属菌によって引き起こされるものなどの他の腐敗及び病気、Exobasidium vexans、Marasmiellus inoderma、Mycena spp.、Sphacelotheca reiliana、Typhula ishikariensis、Urocystis agropyri、Isonilia perplexans、Corticium invisum、Laetisaria fuciformis、Waitea circinata、Rhizoctonia solani、Thanetophorus cucurmeris、Entyloma dahliae、Entylomella microspora、Neovossiamoliniae及びティレティアのう蝕。Phytophthora maydisなどのBlastocladiomycetes。Choanephora cucurbitarumなどのケカビ亜門；Mucor spp.；とRhizopus arrhizus、

10

20

【0286】

別の実施形態では、さび病病原体、例えば、赤星病種、例えば、赤星病菌によって引き起こされる疾患。Hemileia種、例えばHemileiavastatrix；Phakopsora種、例えばPhakopsora pachyrhizi又はPhakopsora meibomiae；ブッチニア種、例えば、ブッチニア・レコンディタ、ブッチニア・グラミニス又はブッチニア・ストリフォルミス。ウロマイセス種、例えばウロマイセス・アペンディキュラタス；

【0287】

特に、Cronartium ribicola（白松のプリスターさび病）；Gymnosporangium juniperi-virginianae（シダー-リンゴのさび病）；Hemileia vastatrix（コーヒーさび病）；Phakopsora meibomiae及びP.pachyrhizi（大豆さび）；Puccinia coronata（オーツ麦とライグラスのクラウンラスト）；Puccinia graminis（小麦とケンタッキーブルーグラスの黒さび病、又は穀物の黒さび病）；Puccinia hemerocallidis（カンゾウさび病）；ブッチニアは亜種を持続する。tritricina（小麦さび病又は「茶色又は赤さび病」）；Puccinia sorghi（トウモロコシのさび病）；Puccinia striiformis（穀物の「黄色いさび病」）；Uromyces appendiculatus（豆のさび病）；Uromyces phaseoli（豆のさび病）；Puccinia melanocephala（サトウキビの「茶色のさび病」）；Puccinia kuehnii（サトウキビの「オレンジ色のさび病」）。

30

【0288】

本発明に従って処理することができる植物には、以下が含まれる：綿、亜麻、ブドウの木、果物、野菜、例えばバラ科の種（例えば、リンゴ、ナシ、アプリコット、サクランボ、アーモンド、桃などのナシ状果）、Ribesioideae sp.、Juglandaceae sp.、Betulaceae sp.、Anacardiaceae sp.、Fagaceae sp.、Moraceae sp.、Oleaceae sp.、Actinidaceae sp.、Lauraceae sp.、Musaceae sp.（例えば、バナナの木やプランテーション）、アカネ科sp.（例えばコーヒー）、ツバキ科、Sterculiaceae sp.、ミカン科sp.（例えば、レモン、オレンジ、グレープフルーツ）；ブドウ科sp.（例えばブドウ）；ナス科sp.（例えば、トマト、ピーマン）、ユリ科sp.、キク科sp.（レタスなど）、セリ科、アブラナ科、サンパウロ科、ウリ科（例えばキュウリ）、ネギ科sp.（例えば、リーキ、タマネギ）、マメ科sp.（例えば、エンドウ豆）；イネ科/イネ科などの主要な作物。（例えば、トウモロコシ、芝、小麦、ライ麦、米、大

40

50

麦、オート麦、キビ、ライコムギなどの穀物)、キク科。(例えばヒマワリ)、アブラナ科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、チンゲン菜、コールラビ、大根、油糧種子菜種、マスタード、西洋わさび、クレス)、Fabaceae sp。(例えば、豆、ピーナッツ)、マメ科sp。(例えば大豆)、ナス科sp。(ジャガイモなど)、Chenopodiaceae sp。(例えば、テンサイ、飼料用ビート、スイスフダンソウ、ビートルート);アオイ科(例えば綿);庭や樹木が茂った地域に役立つ植物や観賞植物。そしてこれらの植物のそれぞれの遺伝子組み換え品種。

【0289】

大豆の以下の病気を防除することがより優先される。例えば、アルテマリアの葉の斑点(Altemaria spec. atrans tenuissima)によって引き起こされる葉、茎、鞘及び種子の真菌性疾患、炭疽病(Colletotrichum gloeosporoides dematiumvar. truncatum)、茶色の斑点(Septoria glycines)、セルコスポラの葉の斑点と枯れ(Cercospora kikuchii)、コウガイケカビの葉の枯れ(Choanephora infundibulifera trispora(Syn.))、dactuliophoraリーフスポット(Dactuliophora glycines)、べと病(Peronospora manshurica)、drechslera blight(Drechslera glycini)、カエルアイリーフスポット(Cercospora soja)、leptosphaerulinaリーフスポット(Leptosphaerulina trifolii)、phyllostica(Phomopsis sojae)、うどんこ病(Microsphaera diffusa)、ピレノチャエタ葉斑点(Pyrenochaeta glycines)、リゾクトニア空中、葉、及びウェブ枯病(Rhizoctonia solani)、さび病(Phakopsora pachyrhizi、Phakopsora meibomiae)、かさぶた枯病(Stemphylium botryosum)、標的スポット(Corynespora cassiicola)。

【0290】

黒根腐れ(Calonectia crotalariae)によって引き起こされ、根及び茎の基部の真菌性疾患例えば、木炭腐敗病(Macrophomina phaseolina)、フザリウム枯病又は萎凋病、根腐れ病、及び鞘と首輪の腐敗病(Fusarium oxysporum、Fusarium Orthoceras、Fusarium semitectum、Fusarium equiseti)、mycoleptodiscusの根腐れ(Mycoleptodiscus terrestris)、neocosmospora(Neocosmospora vas infecta)、鞘と茎の枯死(Diaporthe phaseolorum)、茎潰瘍(Diaporthe phaseolorumvar. caulivora)、phytophthora rot(Phytophthora megasperma)、茶色の茎の腐敗(Phialophora gregata)、ピシウムの腐敗(Pythium aphanidennatum、Pythium Irregulare、Pythium debaryanum、Pythium myriotylum、Pythium ultimum)、根腐病菌の根腐れ、茎の腐敗、及び減衰(Rhizoctonia solani)、菌核病菌、sclerotinia south blight(Sclerotinia rolfsii)、thielaviopsis root rot(Thielaviopsisbasicola)。

【0291】

本発明はまた、以下の植物病害を防除又は予防するための式Iの化合物、それらの組み合わせ又は組成物の使用に関する:さまざまな植物上のプッチニア属(さび病)、例えば、P. triticina(茶色又は葉のさび病)、P. striiformis(縞模様又は黄色のさび病)、P. hordei(矮性さび病)、P. graminis(茎又は黒さび病))又は小麦、大麦、ライ麦穀物などのP. recondita(茶色又は葉のさび病)、さまざまな植物上のPhakopsoraceae属、特に大豆のPhakopsorapachyrhiziとP.meibomiae(大豆さび病)、Hemileiavastarix(コーヒーさび病)、Uromyces appendiculatus、Uromyces fabae、Uromyces phaseoli(豆のさび病)。

【0292】

本発明はさらに、農作物及び/又は園芸作物のPhakopsora pachyrhizi、Phakopsora meibomiae、などの植物病原性真菌を制御又は予防するための式Iの化合物、それらの組み合わせ又は組成物の使用に関する。

【0293】

式Iの化合物、それらの組み合わせ及び組成物は、それぞれ、貯蔵製品又は収穫物の保護及び材料の保護において有害な真菌を制御するのにも適している。「材料の保護」という

用語は、接着剤、接着剤、木材、紙及び板紙、繊維、皮革、塗料分散液、プラスチック、冷却潤滑剤、繊維又は布地などの真菌や細菌などの有害な微生物による侵入と破壊に対して技術的及び非生物材料の保護を意味すると理解されるべきである。

【0294】

木材やその他の材料の保護に関しては、次の有害な菌類に特に注意が払われている。Op
hiostoma spp.、Ceratocystis spp.、Aureobasidium pullulans、Scleroph
oma spp.、Chaetomium spp.、Humicola spp.、Petriella spp.、Trichur
us spp. などの子囊菌；Coniophora spp.、Coriolus spp.、Gloeophyllum s
pp.、Lentinus spp.、Pleurotus spp.、Pora spp.、Serpula spp. などの
担子菌及びTyromyces spp.、アスペルギルス属、クラドスポリウム属、ペニシリウ
ム属、トリコデルマ属、アルテマリア属、ペシロマイセス属などの不完全菌類。及びMu
cor spp. などの接合菌、さらに保存された製品の保護と収穫に加えて、次の酵母菌が
注目に値する：Candida spp. 及びSaccharomyces cerevisiae。

10

【0295】

一実施形態では、式Iの化合物、それらの組み合わせ及び組成物は、それぞれ、以下の植
物病害を防除するのに特に適している：ダイズ上のPhakopsora pachyrhizi及びP
、メイボミエ（ダイズさび病）。

【0296】

本発明はさらに、植物病原性真菌を制御又は予防するための方法に関する。この方法は、
真菌又は材料、植物、植物部分、その遺伝子座、土壌又は種子を真菌の攻撃から保護する
ために、有効量の式Iの少なくとも1つの化合物又は組み合わせ又は少なくとも式Iの化
合物1つを含む組成物で処理することを含む。

20

【0297】

本発明による処理方法は、保存された製品又は収穫物を真菌及び微生物の攻撃から保護す
る分野でも使用することができる。本発明によれば、「貯蔵製品」という用語は、自然の
ライフサイクルから取られ、長期の保護が望まれる、植物又は動物由来の天然物質及びそ
れらの加工形態を意味すると理解される。植物又はその一部、例えば茎、葉、塊茎、種子
、果実又は穀物などの作物植物起源の貯蔵製品は、新たに収穫された状態で、又は、事前
乾燥、湿らせ、粉末、粉碎、プレス、ローストなどの加工形態で保護することができる。
このプロセスは収穫後処理としても知られている。また、貯蔵製品の定義に該当するのは
、建設用木材、電気パイロン、バリアなどの原油の形であれ、家具や木で作られた物体な
どの完成品の形であれ、木材である。動物由来の貯蔵製品は、皮、皮革、毛皮、毛髪など
である。本発明による組み合わせは、腐敗、変色又はカビなどの不利な影響を防ぐことが
できる。好ましくは、「貯蔵製品」は、植物起源の天然物質及びそれらの加工形態、より
好ましくは、ナシ状果、核果、軟質果実及び柑橘類などの果実及びそれらの加工形態及び
それらの加工形態を意味すると理解される。

30

【0298】

式Iの化合物、それらの組み合わせ及び組成物は、それぞれ、植物の健康を改善するた
めに使用することができる。本発明はまた、植物、その繁殖材料、及び/又は植物が成長し
ている、又は植物が成長する場所を、それぞれ有効量の化合物I及びその組成物で処理す
ることによって植物の健康を改善する方法に関する。

40

【0299】

「植物の健康」という用語は、いくつかの指標のみによって、又は収量などの相互に組み
合わせて決定され、植物及び/又はその製品の状態を示すと理解されるべきである。（例
えば、バイオマスの増加及び/又は貴重な成分の含有量の増加）、植物の活力（例えば、
植物の成長及び/又はより緑の葉の改善（「緑化効果」））、品質（例えば、特定の成分
の含有量又は組成の改善）、及び非生物的及び/又は生物的ストレスに対する耐性。植物
の健康状態について上記で特定された指標は、相互に依存している場合もあれば、相互に
起因している場合もある。

【0300】

50

式 I の化合物は、生物学的活性が異なる可能性がある異なる結晶修飾又は多形で存在することができる。それらは同様に本発明の主題である。

【0301】

式 I の化合物は、それ自体で、又は真菌又は植物、種子、土壌、表面、材料などの植物繁殖材料、又は真菌の攻撃から保護される部屋を処理するため殺菌効果のある量の有効成分での組成物の形態で使用される。施用は、菌類による植物、種子、土壌、表面、材料又は部屋などの植物繁殖材料の感染の前後の両方で行うことができる。

【0302】

植物繁殖材料は、植栽又は移植時又は植栽前のいずれかで、式 I の化合物、その組み合わせ及び組成物で保護的に処理することができる。

【0303】

本発明はまた、補助剤及び式 I の少なくとも 1 つの化合物を含む農薬組成物に関する。

【0304】

農薬組成物は、殺菌有効量の式 I の化合物を含む。「有効量」という用語は、栽培植物の有害な真菌を防除するのに、又は材料を保護するのに十分であり、処理された植物に実質的な損傷をもたらさない、式 I の組成物又は化合物の量を意味する。そのような量は広範囲に変化する可能性があり、制御される真菌種、処理された栽培植物又は材料、気候条件及び使用される式 1 の特定の化合物などのさまざまな要因に依存する。

【0305】

式 I の化合物、それらの N - オキシド、金属錯体、異性体、多形体又はそれらの農業的に許容される塩は、慣習的なタイプの農薬組成物（例えば、溶液、乳濁液、懸濁液、粉塵、粉末、ペースト、顆粒、圧搾剤、カプセル、及びそれらの混合物）に変換することができる。組成タイプの例としては、懸濁液（SC、OD、FSなど）、乳化性濃縮物（ECなど）、エマルジョン（EW、EO、ES、MEなど）、カプセル（CS、ZCなど）、ペースト、トローチ、水和剤、ダスト（例：WP、SP、WS、DP、DS）、プレス（例：BR、TB、DT）、顆粒（例：WG、SG、GR、FG、GG、MG）、殺虫剤（例：LN）、及びゲル種子（例えばGF）などの植物繁殖材料の処理のための製剤などがある。これら及びその他の組成タイプは、「Catalogue of pesticide Formulation types and international coding system」、Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008、CropLife Internationalで定義されている。

【0306】

組成物は、Mollet and Grubemann、Formulation technology、Wiley VCH、Weinheim 2001、又はKnowles、

New developments in crop protection product Formulation、

Agrow Reports DS243、

T&F Informa、

London、

2005によって記載されているような既知の方法で調製される。

【0307】

適切な助剤は、溶媒、液体担体、固体担体又は充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、補助剤、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、接着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激剤、相溶化剤、殺菌剤、抗-凍結剤、消泡剤、着色剤、増粘剤、バインダーである。

【0308】

適切な溶媒及び液体担体は、水及び灯油、ディーゼル油などの中沸点から高沸点の鉱油留分などの有機溶媒であり；植物又は動物由来の油；トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンなどの脂肪族、環状及び芳香族炭化水素；エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノールなどのアルコール；グリコール；DMSO；シクロヘキサノンなどのケトン；乳酸塩、炭酸塩、脂肪酸エステル、 γ -ブチロラクトンなどのエステル；脂肪酸；ホスホネート；アミン；N-メチル

10

20

30

40

50

ピロリドン、脂肪酸ジメチルアミドなどのアミド；及びそれらの混合物；適切な固体担体又は充填剤は、ケイ酸塩、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰岩、石灰、チョーク、粘土、ドロマイト、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなどのミネラルアース物である。セルロース、デンプンなどの多糖類；硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素などの肥料；シリアルミール、樹皮ミール、木材ミール、ナットシェル・ミール、及びそれらの混合物などの野菜由来の製品。

【0309】

適切な界面活性剤は、陰イオン性、陽イオン性、非イオン性及び両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、及びそれらの混合物などの界面活性化合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又は補助剤として使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's、Vol.1: Emulsifiers & Detergents、McCutcheon's Directories、Glen Rock、USA、2008 (International Ed. or North American Ed.) にリストされている。

10

【0310】

適切な陰イオン性界面活性剤は、スルホン酸塩、硫酸塩、リン酸塩、カルボン酸塩のアルカリ、アルカリ土類又はアンモニウム塩及びそれらの混合物である。スルホン酸塩の例は、アルキルアリアルスルホン酸塩、ジフェニルスルホン酸塩、アルファオレフィンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、脂肪酸及び油のスルホン酸塩、エトキシ化アルキルフェノールのスルホン酸塩、アルコキシ化アリアルフェノールのスルホン酸塩、縮合ナフタレンのスルホン酸塩、ドデシル及びトリデシルベンゼンのスルホン酸塩、ナフタレンのスルホン酸塩である。及びアルキルナフタレン、スルホコハク酸塩又はスルホスクシナメート。硫酸塩の例は、脂肪酸及び油、エトキシ化アルキルフェノール、アルコール、エトキシ化アルコール、又は脂肪酸エステル、又は脂肪酸エステルの硫酸塩である。リン酸塩の例はリン酸塩エステルである。カルボン酸塩の例は、アルキルカルボン酸塩、及びアルコキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレートである。

20

【0311】

適切な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N置換脂肪酸アミド、アミンオキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、ポリマー界面活性剤、及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリアルフェノール、脂肪酸、又は脂肪酸エステルなど、1~50当量でアルコキシ化された化合物である。アルコキシ化には、エチレンオキシド及びノ又はプロピレンオキシド、好ましくはエチレンオキシドを使用することができる。

30

【0312】

N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステル又はモノグリセリドである。糖ベースの界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロース及びグルコースエステル又はアルキルポリグルコシドである。高分子界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、又は酢酸ビニルのホモポリマー又はコポリマーである。

40

【0313】

適切なカチオン性界面活性剤は、第四級界面活性剤、例えば、1つ又は2つの疎水性基を有する第四級アンモニウム化合物、又は長鎖第一級アミンの塩である。適切な両性界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。適切なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B又はA-B-Aタイプ、又はアルコール、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドを含むA-B-Cタイプのブロックポリマーである。適切な高分子電解質は、ポリ酸又はポリベースである。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸のアルカリ塩又はポリ酸コームポリマーである。ポ

50

リベースの例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

【0314】

適切なアジュバントは、それ自体が無視できるか、又は殺虫活性さえも持たず、標的に対する式Iの化合物の生物学的性能を改善する化合物である。例としては、界面活性剤、鉱物油又は植物油、その他の助剤がある。さらなる例は、Knowles、

Adjuvants and additives、

Agrow Reports DS256、

T&F Informa UK、

2006、

第5章にリストされている。

10

【0315】

適切な増粘剤は、多糖類（例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース）、無機粘土（有機的に修飾された又は修飾されていない）、ポリカルボン酸塩、及びケイ酸塩である。

【0316】

適切な殺菌剤は、プロノポール及びアルキルイソチアゾリノン及びベンズイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体である。

【0317】

適切な凍結防止剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素、及びグリセリンである。

20

【0318】

適切な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、及び脂肪酸の塩である。

【0319】

適切な着色剤（例えば、赤、青、又は緑）は、水溶性の低い顔料及び水溶性染料である。例としては、無機着色剤（例：酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸塩）及び有機着色剤（例：アリザリン、アゾ、フタロシアニン着色剤）がある。

【0320】

適切な粘着付与剤又は結合剤は、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、ポリアクリレート、生物学的又は合成ワックス、及びセルロースエーテルである。

30

【0321】

組成タイプとその調整の例は次のとおりである。

【0322】

i) 水溶性濃縮物 (SL、LS)

【0323】

式Iの化合物の10～60重量%及び5～15重量%の湿潤剤（例えば、アルコールアルコキシレート）を、水及び/又は水溶性溶媒（例えば、アルコール）に100重量%で溶解する。活性物質は水で希釈すると溶解する。

【0324】

ii) 分散性濃縮物 (DC)

40

【0325】

式Iの化合物5～25重量%及び分散剤1～10重量%（例えば、ポリビニルピロリドン）を、100重量%で有機溶媒（例えば、シクロヘキサノン）に溶解する。水で希釈すると分散液が得られる。

【0326】

iii) 乳化性濃縮物 (EC)

【0327】

式Iの化合物の15～70重量%及び乳化剤5～10重量%（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート）を、水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に100重量%で溶解する。水で希釈するとエマルジョンが得られる。

50

【 0 3 2 8 】

iv) エマルジョン (EW、EO、ES)

【 0 3 2 9 】

式 I の化合物の 5 ~ 40 重量% 及び乳化剤 1 ~ 10 重量% (例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート) を、20 ~ 40 重量% の水不溶性有機溶媒 (例えば、芳香族炭化水素) に溶解する。この混合物は、乳化機によって 100 重量% の水で導入され、均質なエマルジョンにされる。水で希釈するとエマルジョンが得られる。

【 0 3 3 0 】

v) サスペンション (SC、OD、FS)

【 0 3 3 1 】

攪拌ボールミルでは、式 I の化合物の 20 ~ 60 wt% を、2 ~ 10 wt% の分散剤及び湿潤剤 (例: リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート)、0.1 ~ 2 wt% の増粘剤 (例: キサンタンガム) 及び水を 100 wt% で添加し、粉碎して、微細な活性物質懸濁液を生成する。水で希釈すると、活性物質の安定した懸濁液が得られる。FS タイプの組成物の場合、最大 40 重量% の結合剤 (例えば、ポリビニルアルコール) が添加される。

【 0 3 3 2 】

vi) 水分散性顆粒及び水溶性顆粒 (WG、SG)

【 0 3 3 3 】

式 I の化合物の 50 ~ 80 重量% は、分散剤及び湿潤剤 (例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート) を 100 重量% で添加して細かく粉碎され、技術的器具 (例: 押出成形、スプレー塔、流動床) により水分散性顆粒及び水溶性顆粒を調整する。水で希釈すると、活性物質の安定した分散液又は溶液が得られる。

【 0 3 3 4 】

vii) 水分散性粉末及び水溶性粉末 (WP、SP、WS)

【 0 3 3 5 】

式 I の化合物の 50 ~ 80 wt% を、1 ~ 5 wt% の分散剤 (例、リグノスルホン酸ナトリウム) を添加してローターステーターミルで粉碎する。)、1 ~ 3 wt% の湿潤剤 (例、アルコールエトキシレート) 及び固体担体 (例、シリカゲル) 及び水で 100 wt% にする。水で希釈すると、活性物質の安定した分散液又は溶液が得られる。

【 0 3 3 6 】

viii) ゲル (GW、GF)

【 0 3 3 7 】

攪拌ボールミルでは、式 I の化合物の 5 ~ 25 重量% が、3 ~ 10 重量% の分散剤 (例えば、リグノスルホン酸ナトリウム)、1 ~ 5 重量% の増粘剤 (例えば、カルボキシメチルセルロース) 及び 100 重量% での水を加えて粉碎される。活性物質の微細な懸濁液を与える。水で希釈すると、活性物質の安定した懸濁液が得られる。

【 0 3 3 8 】

ix) マイクロエマルジョン (ME)

【 0 3 3 9 】

式 I の化合物の 5 ~ 20 重量% を、5 ~ 30 重量% の有機溶媒ブレンド (例えば、脂肪酸ジメチルアミド及びシクロヘキサノン)、10 ~ 25 重量% の界面活性剤ブレンド (例えば、アルコールエトキシレート及びアリアルフェノールエトキシレート)、及び 100% で水に加える。この混合物を 1 時間攪拌して、熱力学的に安定したマイクロエマルジョンを自発的に生成する。

【 0 3 4 0 】

x) マイクロカプセル (CS)

【 0 3 4 1 】

式 I の化合物を 5 ~ 50 重量%、水不溶性有機溶媒を 0 ~ 40 重量% 含む油相 (例えば、

10

20

30

40

50

芳香族炭化水素)、2~15重量%のアクリルモノマー(例えば、メチルメタクリレート、メタクリル酸、及びジ又はトリアクリレート)を、保護コロイド(例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散させる。ラジカル重合は、ポリ(メタ)アクリレートマイクロカプセルの形成をもたらす。又は、本発明による式Iの化合物の5~50重量%、0~40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、及びイソシアナートモノマー(例えば、ジフェニルメテン-2,4'-ジイソシアナタエ)を保護コロイド(例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散させる。ポリアミン(例えば、ヘキサメチレンジアミン)の添加は、ポリ尿素マイクロカプセルの形成をもたらす。モノマーの量は1~10 wt%である。wt%は、CSの総組成に関連している。

【0342】

xi) ダスタブルパウダー(DP、DS)

【0343】

式Iの化合物の1~10重量%を細かく粉砕し、固体担体(例えば、細かく分割されたカオリン)と100重量%で密接に混合する。

【0344】

xii) 顆粒(GR、FG)

【0345】

式Iの化合物の0.5~30重量%が細かく粉砕され、100重量%での固体担体(例えば、ケイ酸塩)と結合している。造粒は、押出成形、噴霧乾燥、又は流動床によって行われる。

【0346】

xiii) 超少量液体(UL)

【0347】

式Iの化合物の1~50重量%を100重量%で有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解する。

【0348】

タイプi)からxiii)の組成物は、任意選択で、0.1~1重量%の殺菌剤、5~15重量%の凍結防止剤、0.1~1重量%の消泡剤、及び0.1~1重量%の着色剤などのさらなる助剤を含み得る。

【0349】

農薬組成物は、一般に、0.01から95重量%、好ましくは0.1から90重量%、特に0.5から75重量%の有効成分(ai)を含む。有効成分(ai)は、90%から100%、好ましくは95%から100%の純度で使用される(NMRスペクトルによる)。

【0350】

植物繁殖材料、特に種子の処理を目的として、種子処理用溶液(LS)、懸濁液(SE)、流動性濃縮物(FS)、乾燥処理用粉末(DS)、スラリー処理用水分散性粉末(WS)、水溶性粉末(SS)、エマルジョン(ES)、乳化性濃縮物(EC)、及びゲル(GF)が通常使用される。組成物は、2から10倍希釈後、すぐに使用できる調製物として、0.01から60重量%、好ましくは0.1から40%の活性物質濃度を与える。

【0351】

播種前又は播種中に散布できる。式Iの化合物、その組み合わせ及び組成物をそれぞれ植物繁殖材料、特に種子に適用するための方法には、ドレッシング、コーティング、ペレット化、ダスティング、及び浸漬、ならびに畝間適用方法が含まれる。好ましくは、式Iの化合物、それらの組み合わせ及び組成物は、それぞれ、発芽が誘導されないような方法、例えば、シードドレッシング、ペレット化、コーティング、ダスティングなどによって植物繁殖材料に適用される。

【0352】

植物保護に使用される場合、適用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、1ヘクタールあたり0.001~2kg、好ましくは1ヘクタールあたり0.005~2kg、より好ましくは1ヘクタールあたり0.05~1.0kgであり、特に1ヘクタールあたり0.1から1.0kg

10

20

30

40

50

である。

【0353】

例えば種子の散布、コーティング又は水浸しによる種子などの植物繁殖材料の処理において、一般に、植物繁殖材料（できれば種子）100kgあたり0.1から1000g、好ましくは1から1000g、より好ましくは1から100g、最も好ましくは5から100gまでの活性物質の量が必要である。

【0354】

材料や保管製品の保護に使用する場合、適用される活性物質の量は、適用領域の種類と目的の効果によって異なる。材料の保護に通常適用される量は、処理された材料の立方メートルあたり、0.001gから2kg、好ましくは0.005gから1kgの活性物質である。

10

【0355】

様々な種類の油、湿潤剤、補助剤、肥料、又は微量栄養素、及びさらなる農薬（例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、安全剤、生物農薬）を、プレミックスとして、活性成分又はそれらを含む組成物に添加することができる。又は適切な場合、使用直前まで（タンクミックス）添加しない。これらの薬剤は、1：100から100：1、好ましくは1：20から20：1の重量比で本発明による組成物と混合することができる。

【0356】

農薬は一般に、その効果によって害虫を抑止、無力化、殺害、又はその他の方法で阻止する化学的又は生物学的因子（例えば殺虫活性成分、化合物、組成物、ウイルス、細菌、抗

菌剤又は消毒剤など）である。対象となる害虫には、昆虫、植物病原体、雑草、軟体動物、鳥、哺乳類、魚、線虫（回虫）、及び財産を破壊し、迷惑をかけ、病気を蔓延させ、病気の媒介動物である微生物が含まれる。「農薬」という用語には、植物の予想される成長、開花、又は繁殖率を変える植物成長調節剤；通常は収穫を容易にするために、葉や他の葉を植物から落とす枯葉剤；不要な植物のてっぺんなど、生体組織の乾燥を促進する乾燥剤；特定の害虫に対する防御のために植物生理学を活性化する植物活性化因子；作物に対する農薬の望ましくない除草作用を低減するセーフナー植物の生理機能に影響を与えて、作物の成長、バイオマス、収量、又は作物の収穫可能な商品の他の品質パラメータを増加させる植物成長促進剤も含まれる。

20

【0357】

ユーザは、通常、事前投与装置、ナップザック噴霧器、噴霧タンク、噴霧面、又は灌漑システムから、本発明による組成物を適用する。通常、農薬組成物は、水、緩衝液、及び/又は所望の適用濃度までのさらなる助剤で構成され、したがって、本発明によるすぐに使用できるスプレー液又は農薬組成物が得られる。通常、すぐに使用できるスプレー液を20~2000リットル、好ましくは50~400リットル、農業用有用面積1ヘクタールあたりに使用される。

30

【0358】

一実施形態によれば、キットの部分又は二成分又は三成分混合物の部分などの本発明による組成物の個々の成分は、スプレータンク又は用途に使用される任意の他の種類の容器内で（例：シード処理ドラム、シードペレット化機械、ナップザック噴霧器）ユーザー自身によって混合され得て；必要に応じて、さらに補助装置を追加することもできる。

40

【0359】

したがって、本発明の一実施形態は、使用可能な殺虫剤組成物を調製するためのキットであり、このキットは、a)本明細書で定義されるような成分1)及び少なくとも1つの補助剤を含む組成物を含む。b)本明細書で定義される成分2)及び少なくとも1つの補助剤を含む組成物。及び任意選択でc)本明細書で定義されるような、少なくとも1つの補助成分及び任意選択でさらなる活性成分を含む組成物3)を含む。

【0360】

式(I)の化合物、他の殺菌剤との殺菌剤としての使用におけるそれらを含むそれらの組み合わせ及び組成物は、得られる殺菌活性のスペクトルの拡大、又は殺菌剤耐性の発生の

50

防止をもたらし得る。さらに、多くの場合、驚くべきな効果が得られる。

【0361】

一実施形態では、本発明は、式(I)の少なくとも1つの化合物と、殺菌剤、殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、生物農薬、除草剤、セーフナー、植物成長調節剤、抗生物質、肥料、栄養素の群から選択される少なくとも1つのさらなる殺虫活性物質とを含む組み合わせを提供する。WO2015185485のページ36-43及びWO2017093019ページの42-56で報告されている殺虫活性物質は、式(I)の化合物と組み合わせて使用することができる。

【0362】

成分2と呼ばれる活性物質、それらの調製、及び例えば有害な真菌に対するそれらの活性が知られている(参照：<http://www.alanwood.net/pesticides/>)。これらの物質は市販されている。化合物はIUPACの命名法で説明されており、その調製と殺虫活性も知られている。(cf. Can. J. Plant Sci. 48(6)、

587-92, 1968; EP141317; EP152031; EP226917; EP243970; EP256503; EP428941; EP532022; EP1028125; EP1035122; EP1201648; EP1122242, JP2002316902; DE19650197; DE10021412; DE102005009458; US3296272; US3325503; WO9846608; WO9914187; WO9924413; WO9927783; WO0029404; WO0046148; WO0065913; WO0154501; WO0156358; WO0222583; WO0240431; WO0310149; WO0311853; WO0314103; WO0316286; WO0353145; WO0361388; WO0366609; WO0374491; WO0449804; WO0483193; WO05120234; WO05123689; WO05123690; WO0563721; WO0587772; WO0587773; WO0615866; WO0687325; WO0687343; WO0782098; WO0790624; WO11028657; WO2012168188; WO2007006670; WO201177514; WO13047749; WO10069882; WO13047441; WO0316303; WO0990181; WO13007767; WO1310862; WO13127704; WO13024009; WO13024010; WO13047441; WO13162072; WO13092224及びWO11135833.

【0363】

本発明はさらに、式Iの少なくとも1つの化合物(成分1)及び植物保護に有用な少なくとも1つのさらなる活性物質を含む農薬混合物に関する。

【0364】

式Iの化合物を少なくとも1つの殺虫活性化合物と一緒に適用することにより、追加の効果をj得ることができる。

【0365】

これは、式Iの化合物及び少なくとも1つのさらなる殺虫活性物質を同時に(例えば、タンク混合物として)又は別々に、又は連続して適用することによって得ることができ、ここで、個々の適用間の時間間隔は、最初に適用される活性物質が、さらなる殺虫活性物質の適用時に十分な量で作用部位で依然として発生することを確実にするように選択される。適用の順序は、本発明の実施に必須ではない。

【0366】

式Iの化合物及び殺虫活性物質を連続して適用する場合、両方の適用間の時間は、例えば2時間から7日の間で変動し得る。また、0.25時間から30日、好ましくは0.5時間から14日、特に1時間から7日又は1.5時間から5日、さらにより好ましくは2時間から1日の範囲のより広い範囲が可能である。本発明による二成分混合物及び組成物において、成分1)及び成分2)の重量比は、一般に、使用される活性成分の特性に依存し、通常、それは、1:1000から1000:1の範囲である。多くの場合、1:100~100:1の範囲で、通常は1:50~50:1の範囲で、好ましくは1:20~20:1の範囲で、より好ましくは1:10~10:1、の範囲で:さらにより好ましくは、1:4から4:1の範囲、特に1:2から2:1の範囲である。

【0367】

10

20

30

40

50

二成分混合物及びその組成のさらなる実施形態によれば、成分1)及び成分2)の重量比は、通常、1000:1から1:1000の範囲であり、多くの場合、100:1から1:100の範囲で、通常は50:1から1:50の範囲で、好ましくは20:1から1:20の範囲で、より好ましくは10:1から1の範囲で、さらにより好ましくは4:1から1:4の範囲、特に2:1から1:2の範囲である。

【0368】

三成分混合物、すなわち、成分1)及び成分2)及び化合物III(成分3)を含む本発明による組成物において、成分1)及び成分2)の重量比は、使用される活性物質の特性に依存する。通常、それは1:100から100:1の範囲であり、普通は1:50から50:1の範囲であり、好ましくは1:20から20:1の範囲であり、より好ましくは1:10~10:1、特に1:4~4:1の範囲であり、コンポーネント1)とコンポーネント3)の重量比は、通常、1:100~100:1の範囲であり、普通は1:50から50:1の範囲、好ましくは1:20から20:1の範囲、より好ましくは1:10から10:1の範囲、特に1:4から4:1の範囲である。

10

【0369】

これ以上の活性成分は、必要に応じて、成分1)に対して20:1から1:20の比率で添加される。

【0370】

これらの比率は、種子処理によって適用される本発明の混合物にも適している。

【0371】

本発明はまた、本発明の化合物を調製するためのプロセスに関する。本発明の化合物を調製するためのプロセスは、実験のセクションでより詳細に説明されている。

20

【0372】

本開示で開示される発明は、非限定的なスキーム及び例によって詳細に説明されている。

【0373】

化学の例:

【0374】

実施例1: N-(3-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド(化合物番号1)

【0375】

工程1: -エチル-7-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート

30

【0376】

テトラヒドロフラン(0.5mL)中の2-アミノイソニコチノニトリル(0.5g、4.2ミリモル)の攪拌溶液に、プロモピルビン酸エチル(0.77mL、6.1ミリモル)を加え、25で24時間攪拌した。さらに、この反応混合物に、酢酸(1mL、17.5mmol)を加え、16時間還流した。揮発性物質を減圧下で除去し、得られた残留物にヘキサン(10mL)を加え、30分間攪拌した。沈殿物を濾過し、ヘキサン(5mL)で洗浄し、減圧下で乾燥させて、7-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル(1g、収率58%)を得た。

【0377】

工程2: エチル7-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート

40

【0378】

エタノール(100mL)中の7-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル(6.2g、29ミリモル)の攪拌懸濁液に、25でヒドロキシルアミン(3.64mL、58ミリモル)を加え、得られた反応混合物を40で16時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去して、粗製のエチル7-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(7g)を得た。

【0379】

工程3: -エチル7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミ

50

ダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート

【0380】

テトラヒドロフラン(60mL)中の7-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル(6g、24.2ミリモル)の攪拌懸濁液に、無水トリフルオロ酢酸(13.7mL、97ミリモル)0°Cで追加された。得られた反応混合物を25°Cで24時間攪拌した。飽和重炭酸ナトリウム水溶液(100mL)に0~5°Cで注ぐことにより反応混合物をクエンチした。生成物を酢酸エチル(150mL)に抽出した。酢酸エチル層を水(50mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。この粗生成物にヘキサン(60mL)を加え、混合物を30分間攪拌した。得られたスラリーを濾過し、ヘキサン(30mL)で洗浄し、減圧下で乾燥させて、エチル7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート(6.5g、82%収率)を得た。

10

【0381】

工程4:N-(3-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド

【0382】

トルエン(3 mL)中の7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル(0.3g、0.9mmol)の攪拌溶液にm-アニシジン(0.2 mL、1.8 mmol)及びトリメチルアルミニウム(トルエン中2M)(1.0 mL、2.0 mmol)を0~5°Cで添加し、発泡が止まるまで25°Cで攪拌した。得られた反応混合物を65°Cで16時間攪拌した。反応混合物を25°Cに冷却し、10%酢酸水溶液(10mL)に注いだ。生成物を酢酸エチル(30mL)で抽出した。酢酸エチル層を重炭酸ナトリウム水溶液(10mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して粗生成物を得た。粗生成物をシリカゲルのカラムクロマトグラフィーにより精製して、N-(3-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド(180 mg、49%収率)を得た。

20

【0383】

¹H-NMR(400 MHz, DMSO-d₆) 10.35(s, 1H), 8.84(dd, 1H), 8.73(d, 1H), 8.27-8.26(m, 1H), 7.62-7.59(m, 2H), 7.52-7.49(m, 1H), 7.25(t, 1H), 6.68(dd, 1H), 3.76(s, 3H); LCMS(M+H): 404.15。

30

【0384】

表1:以下の化合物は、化合物番号1の手順と同様の手順で調製した。

【0385】

40

50

【表 1 - 1】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
2	N-(4-メトキシフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.30 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.70 (d, 1H), 8.26 (t, 1H), 7.81-7.78(m, 2H), 7.60 (dd, 1H), 6.94-6.91(m, 2H), 3.74 (s, 3H); LCMS (M+H): 404.1
3	N-(p-トリル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.29 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.71 (d, 1H), 8.27-8.26(m, 1H), 7.79-7.76(m, 2H), 7.61 (dd, 1H), 7.15 (d, 2H), 2.28 (s, 3H); LCMS (M+H): 388.1
4	N-(3-フルオロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.059 (s, 1H), 8.88 (dd, 1H), 8.74 (d, 1H), 8.305 (t, 1H), 7.876 (dt, 1H), 7.62-7.59 (dd, 1H), 7.41-7.35 (m, 1H), 7.41-7.35 (m, 1H), 7.15-7.17 (td, 1H); LCMS (M+H): 392.05
5	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.059 (s, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.744 (1H), 8.30(t, 1H), 7.86 (td, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.43-7.37 (m, 1H), 7.17-7.15(m, 1H); LCMS (M+H): 410.05
6	N-(4-クロロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.60 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.75(d, 1H), 8.26 (t, 1H), 7.96-7.94(m, 2H), 7.61 (dd, 1H), 7.42-7.39(m, 2H); LCMS (M+H): 408.05
7	N-(2-フルオロフェニル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.95 (s, 1H), 8.83 (dd, 1H), 8.76 (d, 1H), 8.33 (t, 1H), 8.02-7.96 (m, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.35-7.30 (m, 1H), 7.25-7.201 (m, 2H); LCMS (M+H): 392.05
8	7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)-N-(4-(トリフルオロメチル)ベンジル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.23 (t, 1H), 8.80 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.68 (d, 2H), 7.58-7.53 (m, 3H), 4.56 (d, 2H); LCMS (M+H): 456.15
9	N-(ピリジン-3-イル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.73 (s, 1H), 9.07-9.06 (m, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.77 (d, 1H), 8.32-8.27 (m, 3H), 7.62 (dd, 1H), 7.41-7.37 (m, 1H); LCMS (M+H): 375.1

10

20

30

40

50

【表 1 - 2】

10	N-ベンジル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.06 (t, 1H), 8.79 (d, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.35-7.29 (m, 4H), 7.24-7.21 (m, 1H), 4.48 (d, 2H); LCMS (M+H): 388.15
11	N- (ピリジン-4-イル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.85 (s, 1H), 8.84 (dd, 1H), 8.80 (d, 1H), 8.47 (dd, 2H), 8.27 (t, 1H), 7.94-7.92 (m, 2H), 7.62 (dd, 1H); LCMS (M+H): 375.1
12	N- (4-クロロフェニル) -N-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.70 (d, 1H), 8.23 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.48 (dd, 1H), 7.39-7.37 (m, 2H), 7.295-7.273 (m, 2H), 3.46 (s, 3H); LCMS (M+H): 422.1
13	N-メチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (dd, 1H), 8.55 (d, 1H), 8.46 (q, 1H), 8.19 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 2.80 (d, 3H); LCMS (M+H): 312.05
14	N-メチル-N- (2-フェノキシエチル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) @ 80 degree celcius δ 8.74 (dd, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.50 (dd, 1H), 7.23 (t, 2H), 6.93-6.89 (m, 3H), 4.27 (t, 2H); LCMS (M+H): 432.1
15	N- (4-シアノフェニル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.48 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.33 (dd, 1H), 7.93-7.91 (m, 2H), 7.70-7.68 (m, 2H), 7.63 (dd, 1H); LCMS (M+H): 399.05
33	アゼチジン-1-イル (7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メタノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.76 (dd, 1H), 8.56 (d, 1H), 8.24 (t, 1H), 7.55 (dd, 1H), 4.65 (t, 2H), 4.07 (t, 2H), 2.35-2.27 (m, 2H); LCMS (M+H): 338.15.
34	N- (2-メトキシエチル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (d, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.56 (dd, 1H), 3.47-3.44 (m, 4H), 3.27 (s, 3H); LCMS (M+H): 355.70.
35	N-イソブチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (dd, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.46 (t, 1H), 8.22 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 3.11 (t, 2H), 1.91-1.84 (m, 1H), 0.87 (d, 6H); LCMS (M+H): 353.70.

10

20

30

40

50

【表 1 - 3】

36	N-ネオペンチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (dd, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.25-8.22 (m, 2H), 7.56 (dd, 1H), 3.14 (d, 2H), 0.88 (d, 9H); LCMS (M+H): 368.30.	
37	N-イソペンチル-7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79-8.76 (m, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.44 (t, 1H), 8.20 (t, 1H), 7.59-7.54 (m, 1H), 3.33-3.28 (m, 2H), 1.59 (td, 1H), 1.43 (q, 2H), 0.90 (d, 6H); LCMS (M+H): 368.05	
38	N- (4-クロロベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.13 (s, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.36 (dd, 4H), 4.46 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.85.	10
39	N- (4-メトキシベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.95 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.26 (d, 2H), 6.87 (dd, 2H), 4.40 (d, 2H), 3.71 (s, 3H); LCMS (M+H): 418.05.	
40	N- (3-クロロベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.17 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.58-7.48 (m, 1H), 7.38-7.28 (m, 4H), 4.47 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.85.	20
41	N- (3-メトキシベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.03 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.22 (t, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.24-7.20 (m, 1H), 6.91-6.78 (m, 3H), 4.45 (d, 2H), 3.72 (s, 3H); LCMS (M+H): 417.95.	
42	N- (2-フルオロベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.03 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.38-7.13 (m, 4H), 4.54 (d, 2H); LCMS (M+H): 406.15.	30
43	N- (4- (ジメチルアミノ) ベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82-8.78 (m, 2H), 8.57 (d, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.17 (d, 2H), 6.67 (d, 2H), 4.35 (d, 2H), 2.84 (s, 6H); LCMS (M+H): 430.95.	
44	N- (3,4-ジクロロベンジル) -7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.21 (t, 1H), 8.79 (dd, 1H), 8.60 (d, 1H), 8.22 (t, 1H),	40

【表 1 - 4】

	ル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	7.59-7.56 (m, 3H), 7.33 (dd, 1H), 4.46 (d, 2H); LCMS (M+H): 455.85.
--	------------------------------	---

【0386】

実施例 2 : N - (3 - メトキシフェニル) - 6 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 2 - カルボキサミド (化合物番号 16)

【0387】

10

20

30

40

50

工程1：6-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-カルボン酸エチル

【0388】

テトラヒドロフラン（80mL）中の6-アミノニコチノニトリル（6g、50.4ミリモル）の攪拌溶液に、プロモピルビン酸エチル（7.0mL、55.4ミリモル）を0～5 で滴下した。得られた反応混合物を25 で24時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去した。得られた残留物に、エタノール（80mL）及び酢酸（23mL、403mmol）を25 で加え、得られた反応混合物を80 で18時間攪拌した。反応混合物を0～5 に冷却し、150mLの酢酸エチルで希釈した。pHが塩基性になるまで、飽和重炭酸ナトリウム水溶液を反応混合物に加えた。酢酸エチル層を単離し、水（50mL）、ブライン溶液（50mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、6-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-カルボン酸エチルを得た。（9g、83%の収率）。

10

【0389】

工程2：メチル-6-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート

【0390】

メタノール（7mL）と水（3mL）の混合物中の6-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル臭化水素酸塩（1g、3.38mmol）の攪拌溶液に、塩酸ヒドロキシルアミン（0.35g）、5.0ミリモル）及び重炭酸ナトリウム（0.9g、10.1ミリモル）を15 で加えた。得られた反応混合物を25 で24時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去して、粗生成物を得た。水（30ml）を粗生成物に加え、0～5 で1時間攪拌した。得られたスラリーを濾過し、水（10mL）で洗浄し、真空下で乾燥させた。得られた固体化合物を10mLのアセトンと共に0-5°Cで15分間攪拌し、濾過し、ヘキサン（10mL）で洗浄し、真空下で乾燥させて、エチル6-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート（0.75g、89%収率）。

20

【0391】

工程3：エチル6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート

【0392】

テトラヒドロフラン（20mL）中のエチル-6-(N'-ヒドロキシカルバミミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート（1.3g、5.2ミリモル）の攪拌懸濁液に、無水トリフルオロ酢酸（2.2mL、15.7ミリモル）を0～5 で加えた。得られた反応混合物を25 で24時間攪拌した。反応混合物をヘキサン（20mL）で希釈し、濾過し、真空下で乾燥させて、固体を得た。固体をジクロロメタン（30mL）で希釈し、0～5 に冷却し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液で塩基性化した。ジクロロメタン層を単離し、水（10mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、エチル6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキシレート（1.5g、88%収率）。

30

【0393】

工程4：N-(3-メトキシフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド

【0394】

トルエン（2.5mL）中の6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル（250mg、0.7ミリモル）の攪拌溶液に、m-アニシジン（94mg、0.7ミリモル）及びトリメチルアルミニウム（0.8mL、1.5ミリモル）を0～5 で加えた。得られた反応混合物を70 で24時間攪拌した。反応混合物を25 に冷却し、0～5 で10%酢酸水溶液（10mL）に注いだ。生成物を酢酸エチル（30mL）で抽出した。酢酸エチル層を重炭酸ナトリウム水溶液（10mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して粗生成物を得た。粗生成物をシリカゲルのカラムクロマトグラフィーにより精製して、N-(3-メトキシフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-

40

50

2-カルボキサミド (184 mg、55% 収率) を得た。¹H-NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) 10.34(s, 1H), 9.59(q, 1H), 8.71(d, 1H), 7.91(dd, 1H), 7.85-7.87(m, 1H), 7.60(t, 1H), 7.52-7.50(m, 1H), 7.24(t, 1H), 6.69(dd, 1H), 3.75(s, 3H); LCMS(M+H): 404.15。

【0395】

表2: 以下の化合物は、化合物番号16の手順と類似の手順によって調製された。

【0396】

【表2-1】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
17	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.04 (s, 1H), 9.57 (t, 1H), 8.72 (s, 1H), 7.93-7.82 (m, 3H), 7.41-7.35(m, 1H), 7.16-7.10(m, 1H); LCMS (M+H): 410.15
18	N-(4-クロロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.59 (s, 1H), 9.58 (q, 1H), 8.72 (d, 1H), 7.97-7.93(m, 2H), 7.92-7.89 (m, 1H), 7.87-7.85(m, 1H), 7.42-7.38 (m, 2H); LCMS (M+H): 408.15
19	N-(p-トリル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.28 (s, 1H), 9.58 (s, 1H), 8.69 (s, 1H), 7.91-7.86 (m, 2H), 7.77 (d, 2H), 7.14 (d, 2H), 2.27 (s, 3H); LCMS (M+H): 388.15
20	N-(2-フルオロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.93 (s, 1H), 9.58 (t, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.03-7.98 (m, 1H), 7.92 (d, 2H), 7.35-7.30(m, 1H), 7.26-7.21(m, 2H); LCMS (M+H): 391.95
21	N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.53 (q, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.48-8.44(m, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.79-7.76 (m, 1H), 2.79 (d, 3H); LCMS (M+H): 312.15
22	N-(4-メトキシフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.27 (s, 1H), 9.58 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 7.91-7.88(m, 1H), 7.86-7.84 (m, 1H), 7.81-7.82(m, 2H), 6.92 (d, 2H), 3.74 (s, 3H); LCMS (M+H): 403.8
23	N-ベンジル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.54 (q, 1H), 9.05 (t, 1H), 8.57 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.81-7.78 (m, 1H), 7.34-7.28(m, 4H), 7.24-7.20(m, 1H), 4.47 (d, 2H); LCMS (M+H): 388.15
24	N-(3-フルオロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10.64 (s, 1H), 9.58 (q, 1H), 8.73 (s, 1H), 7.93-7.85 (m, 3H), 7.76-7.74 (m, 1H), 7.41-7.34 (m, 1H), 6.92 (td, 1H); LCMS (M+H): 392

10

20

30

40

50

【表 2 - 2】

25	N, N-ジメチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (t, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.85-7.80(m, 2H), 3.41 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); LCMS (M+H): 326.15
26	N-(4-クロロ-2-フルオロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.03 (s, 1H), 9.57 (t, 1H), 8.74 (s, 1H), 7.98-7.88 (m, 3H), 7.56 (dd, 1H), 7.35-7.32 (m, 1H); LCMS (M+H): 425.95
27	N-(4-シアノフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.90 (s, 1H), 9.59 (t, 1H), 8.77 (s, 1H), 8.15-8.13(m, 2H), 7.92 (dd, 1H), 7.88-7.86(m, 1H), 7.83-7.81 (m 2H); LCMS (M+H): 399
28	N-(2-メトキシフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.76 (s, 1H), 9.57 (t, 1H), 8.71 (d, 1H), 8.40-8.38 (m, 1H), 7.94-7.81 (m, 2H), 7.15-7.09 (m, 2H), 7.01-6.94 (m, 1H), 3.95 (s, 3H); LCMS (M+H): 404.1
29	N-(ピリジン-3-イル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.70 (s, 1H), 9.59 (t, 1H), 9.07 (d, 1H), 8.74 (d, 1H), 8.31-8.28 (m, 2H), 7.92 (dd, 1H), 7.87 (d, 1H), 7.38 (dd, 1H); LCMS (M+H): 374.8
30	N-(2,6-ジフルオロフェニル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 10.21(s, 1H), 9.57 (q, 1H), 8.70 (d, 1H), 7.92 (dd, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.44-7.36 (m, 1H), 7.22-7.16 (m, 2H); LCMS (M+H): 410.15
31	N-(3-フルオロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.55 (q, 1H), 9.15 (t, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.38-7.32 (m, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 7.07-7.03 (m, 1H), 4.48 (d, 2H); LCMS (M+H): 405.8
32	N-(ピリジン-4-イル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.35 (s, 1H), 9.07 (q, 1H), 8.58 (dd, 2H), 8.37 (d, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.70 (dd, 2H); LCMS (M+H): 374.75
63	6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.55 (q, 1H), 9.23 (t, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.81 (d,

10

20

30

40

50

【表 2 - 3】

	-3-イル) -N- (4- (トリフルオロメチル) ベンジル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H, 7.68 (d, 2H), 7.53 (d, 2H), 4.55 (d, 2H); LCMS (M+H): 456.05.
64	モルフォリノ (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メタノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.86-7.81 (m, 2H), 4.20 (s, 2H), 3.65 (s, 6H); LCMS (M+H): 367.70.
65	N- (2-メトキシエチル) -6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.54 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.80 (d, 1H), 3.45 (d, 4H), 3.26 (s, 3H); LCMS (M+H): 355.80.
66	N-イソブチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.45 (t, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 3.10 (t, 2H), 1.90-1.83 (m, 1H), 0.87 (d, 6H); LCMS (M+H): 353.80.
67	N-シクロペンチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.78 (d, 1H), 4.24 (q, 1H), 1.91-1.82 (m, 2H), 1.70-1.68 (m, 2H), 1.60-1.52 (m, 4H); LCMS (M+H): 365.80.
68	(3-メトキシピロリジン-1-イル) (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メタノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.84-7.81 (m, 2H), 4.23-4.17 (m, 1H), 4.05-3.88 (m, 2H), 3.65-3.48 (m, 2H), 3.24 (d, 3H), 2.11-1.89 (m, 2H); LCMS (M+H): 381.75.
69	アゼチジン-1-イル (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル) メタノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 7.85-7.79 (m, 2H), 4.64 (t, 2H), 4.06 (t, 2H), 2.34-2.26 (m, 2H); LCMS (M+H): 338.00.
70	N- (シクロプロピルメチル) -6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.54 (t, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.51 (t, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 3.15 (t, 2H), 1.09-1.02 (m, 1H), 0.43-0.39 (m, 2H), 0.26-0.22 (m, 2H); LCMS (M+H): 351.75.
71	N-ベンジル-N-メチル-6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.54 (s, 1H), 8.58 (d, 1H), 7.82 (d, 2H), 7.37-7.27 (m, 5H), 5.31

10

20

30

40

50

【表 2 - 4】

	ル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	(s, 1H), 4.71 (s, 1H), 3.35 (s, 2H), 2.89 (s, 2H); LCMS (M+H): 401.80.	
72	N-(1-フェニルエチル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (s, 1H), 8.78 (d, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.42 (d, 2H), 7.31 (t, 2H), 7.21 (t, 1H), 5.21-5.14 (m, 1H), 1.51 (d, 3H); LCMS (M+H): 401.75.	
73	N-(1-シアノシクロプロピル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.55 (t, 2H), 8.64 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.79 (d, 1H), 1.55-1.48 (m, 2H), 1.37-1.25 (m, 2H); LCMS (M+H): 362.65.	10
74	N-(メトキシメチル)-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.51 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.85-7.80 (m, 2H), 4.11 (t, 1H), 3.63-3.43 (m, 4H), 3.28 (s, 1H), 3.19 (s, 2H), 3.02 (s, 2H); LCMS (M+H): 370.30.	
75	N-(3-クロロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.54 (q, 1H), 9.17 (t, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.89-7.79 (m, 2H), 7.37-7.27 (m, 4H), 4.47 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.95.	20
76	N-(3-メトキシベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.54 (d, 1H), 9.03 (s, 1H), 8.57 (d, 1H), 7.88-7.81 (m, 2H), 7.22 (t, 1H), 6.90 (s, 2H), 6.81 (s, 1H), 4.44 (d, 2H), 3.72 (s, 3H); LCMS (M+H): 418.20.	
77	N-(4-クロロベンジル)-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.54 (q, 1H), 9.13 (t, 1H), 8.57 (d, 1H), 7.88-7.78 (m, 2H), 7.38-7.33 (m, 4H), 4.45 (d, 2H); LCMS (M+H): 421.90.	30
78	N-イソブチル-N-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.53 (t, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.85 (d, 2H), 3.85 (d, 1H), 3.36 (d, 3H), 3.01 (s, 1H), 2.03 (dt, 1H), 0.92 (d, 3H), 0.80 (d, 3H); LCMS (M+H): 368.30.	40

【0397】

実施例3: 3-(2-(フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(化合物番号50)の調製

【0398】

工程1: -2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【0399】

エタノール(100mL)中の2-アミノイソニコチノニトリル(20g、168ミリモル)の攪拌溶液に、1,3-ジクロロプロパン-2-オン(38.4g、302ミリモル)を加え、50 で16時間攪拌した。反応混合物を飽和重曹水溶液(500mL)でクエンチし、得られた沈殿物

をブフナー漏斗で濾過し、得られた固体をエタノール（50 mL）で洗浄した。得られた残留物を減圧下で乾燥させて、2-（クロロメチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル（21 g、110 mmol、65%の収率）を得た。

【0400】

工程2：2-（クロロメチル）-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド

【0401】

エタノール（50 mL）中の2-（クロロメチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル（10.25 g、53.5ミリモル）の攪拌溶液に、水中の50重量%のヒドロキシルアミン溶液（6.56 mL、107ミリモル）を25 で加えた。得られた反応混合物を60 で3時間攪拌し、減圧下で濃縮して、2-（クロロメチル）-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド（11.54 g、53.5 mmol、96% 収率）を得た。

【0402】

工程3：3-（2-（クロロメチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル）-5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール

【0403】

テトラヒドロフラン（50 mL）中の2-（クロロメチル）-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド（12.0 g、53.4ミリモル）の攪拌溶液に、無水トリフルオロ酢酸（13.58 mL、96ミリモル）窒素雰囲気下、0~5 でゆっくりと加え、25 で18時間攪拌した。得られた反応混合物を減圧下で濃縮し、得られた残留物をジクロロメタン（100 mL）に溶解した。ジクロロメタン層を重炭酸ナトリウム水溶液（50 mL）で洗浄し、続いてブライン（50 mL）で洗浄しその後無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液60%の酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、3-（2-（クロロメチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル）-5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール（12.56 g、41.5 mmol、78% 収率）。

【0404】

工程4：3-（2-（フェニルチオ）メチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル）-5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール

【0405】

窒素雰囲気下、アセトニトリル（8 mL）中のベンゼンチオール（0.473 g、4.30ミリモル）の攪拌溶液に、炭酸カリウム（0.91 g、6.6ミリモル）を加え、反応混合物を0 で10分間攪拌した。得られた反応混合物に対して、3-（2-（クロロメチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル）-5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール（1.0 g、3.30ミリモル）のN,N-ジメチルホルムアミド中の溶液を加え、得られた反応混合物を60 で3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を酢酸エチル（15 mL）で希釈し、水（15 mL）で洗浄した。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液10%の酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、3-（2-（フェニルチオ）メチル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル）-5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール（1.03 g、2.73 mmol、83% 収率）。

【0406】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) 8.39(t, 1H), 8.20-8.12(m, 1H), 7.49-7.45(m, 1H), 7.38-7.35(m, 2H), 7.29-7.24(m, 3H), 7.19-7.15(m, 1H), 4.36(s, 2H); LCMS(M+H): 377.35。

【0407】

表3：以下の化合物は、化合物50の手順と類似の手順によって調製された。

【0408】

【表 3】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
46	3-(2-((3-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.56-8.41 (m, 1H), 8.19-8.14 (m, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.52-7.48 (m, 1H), 7.22-7.17 (m, 1H), 7.01-6.93 (m, 2H), 6.78-6.71 (m, 1H), 4.38-4.34 (s, 2H), 3.77 (s, 3H); LCMS (M+H): 407.35.
47	3-(2-((4-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.08-8.06 (m, 1H), 7.83 (dd, 1.0 Hz, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.18-7.11 (m, 1H), 7.04-6.88 (m, 4H), 4.01 (s, 2H); LCMS (M+H): 410.85.
48	3-(2-((4-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.42 (t, 1H), 8.21-8.17 (m, 1H), 7.57-7.54 (m, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.42-7.37 (m, 2H), 7.03-6.97 (m, 2H), 4.30 (s, 2H); LCMS (M+H): 395.15.
49	3-(2-((4-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.40 (d, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.52-7.45 (m, 2H), 7.37-7.33 (m, 2H), 6.84-6.80 (m, 2H), 4.25-4.23 (m, 2H), 3.78 (s, 3H); LCMS (M+H): 407.25.
51	3-(2-((2-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.38 (s, 1H), 8.14 (dd, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.48-7.37 (m, 2H), 7.24-7.18 (m, 1H), 7.09-7.02 (m, 2H), 4.35 (s, 2H); LCMS (M+H): 395.0.
52	5-(トリフルオロメチル)-3-(2-((4-(トリフルオロメチル)フェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.40 (s, 1H), 8.16 (dd, 1.0 Hz, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.51-7.42 (m, 5H), 4.41 (s, 2H); LCMS (M+H): 445.00.
53	3-(2-((4-メトキシベンジル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.39 (s, 1H), 8.22-8.16 (m, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.48 (dd, 1.7 Hz, 1H), 7.31-7.20 (m, 2H), 6.92-6.81 (m, 2H), 4.00-3.53 (m, 7H); LCMS (M+H): 421.05.
54	3-(2-((プロピルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.39 (d, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.52-7.47 (m, 1H), 3.92 (d, 2H), 2.60-2.57 (m, 2H), 1.66 (td, 7.3 Hz, 2H), 1.08-0.97 (m, 3H); LCMS (M+H): 343.00.

10

20

30

40

【0409】

実施例4: 3-(2-((フェニルスルホニル)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(化合物番号58)の調製

【0410】

ジクロロメタン(10 mL)中の3-(2-((フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(0.250 g、0.664 mmol)の攪拌溶液に、メタクロロ過安息香酸(0.573 g、1.993 mmol)を1時間をかけて0°Cで少しずつ加え、次に25°Cで8時間攪拌した。反応混合物をジクロロメタン(20 mL)で希釈し、飽和重炭酸ナトリウム水溶液(20 mL)で洗浄した。有機層を

50

分離し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液 30% の酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、3 - (2 - ((フェニルスルホニル)メチル)イミダゾ [1, 2 - a]ピリジン - 7 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (0.156 g、0.382 mmol、58% 収率) を得た。¹H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) 8.31(t, 1H), 8.24(dd, 1H), 7.89(s, 1H), 7.83-7.80(m, 2H), 7.66-7.62(m, 1H), 7.57-7.49(m, 3H), 4.65(s, 2H); LCMS(M+H): 409.05。

【 0 4 1 1 】

表 4 : 以下の化合物は、化合物 58 の手順と類似の手順によって調製された。

【 0 4 1 2 】

10

20

30

40

50

【表 4】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
55	3-(2-((4-クロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.32-8.24 (m, 2H), 8.05-7.89 (m, 1H), 7.72 (dt, 2H), 7.57-7.42 (m, 3H), 4.65 (s, 2H); LCMS (M+H): 442.95.
56	3-(2-((4-メトキシフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.33-8.23 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.73-7.70 (m, 2H), 7.53 (dd, 1H), 7.00-6.93 (m, 2H), 4.62 (s, 2H), 3.88 (s, 3H); LCMS (M+H): 438.95.
57	3-(2-((4-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.31 (t, 1H), 8.25 (dd, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.58-7.40 (m, 1H), 7.19-7.14 (m, 2H), 4.65 (s, 2H); LCMS (M+H): 427.20.
59	3-(2-((2-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.30 (t, 1H), 8.21 (dd, 1.0 Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.79-7.75 (m, 1H), 7.66-7.60 (m, 1H), 7.52-7.49 (m, 1H), 7.28-7.21 (m, 2H), 4.85 (s, 2H); LCMS (M+H): 427.50.
60	3-(2-((4-メトキシベンジル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.48 (s, 1H), 8.31-8.23 (m, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.59-7.52 (m, 3H), 7.00-6.92 (m, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.32 (s, 2H), 3.82 (s, 3H); LCMS (M+H): 453.50.
61	3-(2-((プロピルスルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.42 (t, 1H), 8.25 (dd, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.56-7.52 (m, 1H), 4.52-4.47 (m, 2H), 3.13-3.04 (m, 2H), 2.03-1.89 (m, 2H), 1.14-1.06 (m, 3H); LCMS (M+H): 375.50.
62	5-(トリフルオロメチル)-3-(2-((4-(トリフルオロメチル)フェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-イル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.32 (s, 1H), 8.26 (dd, 1H), 7.97-7.92 (m, 3H), 7.77 (d, 2H), 7.57-7.52 (m, 1H), 4.70 (s, 2H); LCMS (M+H): 477.50.

10

20

30

40

【0413】

実施例 5: N-((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド (化合物番号番号 81)

【0414】

工程 1: -3-(2-(アジドメチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール

【0415】

N,N-ジメチルホルムアミド (25 mL) 中の 3-(2-(クロロメチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール (2.70g、8.9

50

2 mmol) の攪拌溶液に、アジ化ナトリウム (0.638 g、9.81 mmol) を窒素雰囲気下で加えた。得られた反応混合物を25 で16時間攪拌した。反応混合物を砕いた氷 (50g) に注ぎ、酢酸エチル (50 mL) で2回抽出した。酢酸エチル層を水 (50 mL) で2回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、3-(2-(アジドメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール (2.72 g、8.8 mmol、99%収率) を得た。3

【0416】

工程2：6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2イル)メタンアミン

【0417】

テトラヒドロフラン (30 mL) 中の3-(2-(アジドメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール (3.43 g、11.09 ミリモル) の攪拌溶液に、トリフェニルホスフィン (2.91 g、11.1 mmol) を0 で加え、次に水 (6 mL) を加え、得られた反応混合物を70 で16時間攪拌した。反応混合物を濃縮し、減圧下で、粗製物をアセトニトリル (25 mL) で3回共蒸発させた。1,4-ジオキサン (4 Mol.) 中のジクロロメタン (20 mL) 及び塩酸 (13.87 mL、55.5 mmol) を0 で加え、1時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去して、粗生成物を得た。粗生成物をヘキサン中の60%酢酸エチル (50 mL) と共に25 で攪拌し、濾過して、(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタンアミン (3.12 g、11.02 mmol、99%収率)。

【0418】

工程3：N-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド

【0419】

(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メタンアミン (300 mg、1.06 mmol) のジクロロメタン (10 mL) 中の攪拌溶液に、トリエチルアミン (0.517 mL、3.71 mmol) を窒素雰囲気下0 で加え、次に反応混合物を10分間攪拌した。安息香酸 (194 mg、1.589 ミリモル) 及び1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[2,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサフルオロホスフェート (1007 mg、2.65 ミリモル) を加えた。得られた反応混合物を25 で16時間攪拌した。反応混合物をジクロロメタン (25 mL) で抽出し、水 (25 mL) で洗浄した。ジクロロメタン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液0-50%酢酸エチルを使用するシリカゲルのカラムクロマトグラフィーにより精製して、N-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)ベンズアミド (101 mg、0.26 mmol、25%収率)。

【0420】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) 9.45-9.46(m, 1H), 9.09(t, 1H), 8.04(d, 1H), 7.89-7.92(m, 2H), 7.75(dd, 1H), 7.70(d, 1H), 7.52-7.56(m, 1H), 7.45-7.49(m, 2H), 4.61(d, 2H), 1.22(s, 2H); LCMS(M); 387.90。

【0421】

表5：以下の化合物は、化合物番号81の手順と類似の手順によって調製された。

【0422】

10

20

30

40

50

【表 5 - 1】

化合物 番号	IUPAC 名	分析データ
82	4-メトキシ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.94 (t, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.89 (dd, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 6.98-7.01 (m, 2H), 4.58 (d, 2H), 3.80 (s, 3H), 1.22 (s, 3H); LCMS(M+1) = 418.05
83	4-クロロ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 9.18 (t, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.92 (dd, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.54-7.57 (m, 2H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M) = 421.85
84	2- (4-クロロフェニル) -N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.47 (q, 1H), 8.65 (t, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.34-7.36 (m, 2H), 7.30 (dd, 2H), 4.39 (d, 2H), 3.49 (s, 2H); LCMS(M+1) = 436.05
85	3-クロロ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, 1H), 9.23 (t, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.95 (t, 1H), 7.85-7.88 (m, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (dd, 1H), 7.62 (dq, 1H), 7.52 (t, 1H), 4.61 (d, 2H); LCMS(M+1) = 422.05
86	3,4-ジクロロ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 9.30 (t, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.88 (dd, 1H), 7.74-7.79 (m, 2H), 7.70 (d, 1H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M) = 456.00
87	N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ピコリンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 9.27 (t, 1H), 8.67 (dq, 1H), 8.07 (dt, 1H), 7.99-8.03 (m, 2H), 7.78 (dd, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.62 (ddd, 1H), 4.66 (d, 2H); LCMS(M+1) = 389.40
88	N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) プロピオンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.33 (t, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 4.37 (d, 2H), 2.14 (q, 2H), 1.03 (t, 3H); LCMS(M+1) = 340.10
90	4-フルオロ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 9.13 (t, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.96-7.99 (m,

10

20

30

40

50

【表 5 - 2】

	[1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 7.74 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.28-7.34 (m, 2H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M)= 405.95	
91	2-フルオロ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.49 (q, 1H), 8.89-8.91 (m, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.65-7.76 (m, 3H), 7.51-7.57 (m, 1H), 7.27-7.33 (m, 2H), 4.60 (d, 2H); LCMS(M+1) = 406.10	
92	N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) オキサゾール-4-カルボキサミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 8.79 (t, 1H), 8.66 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.74 (dd, 1.7 Hz, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 4.57 (d, 2H); LCMS(M) = 378.95	10
93	3-フルオロ-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.20 (t, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.73-7.77 (m, 2H), 7.68-7.72 (m, 2H), 7.54 (td, 1H), 7.37-7.42 (m, 1H), 4.61 (d, 2H); LCMS(M+1) = 406.15	
94	2-フェニル-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.47 (q, 1H), 8.62 (t, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.27-7.30 (m, 4H), 7.19-7.24 (m, 1H), 4.39 (d, 2H), 3.48 (s, 2H); LCMS(M+1) = 402.15	20
95	4- (ジメチルアミノ) -N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 8.71 (t, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.78 (d, 2H), 7.73 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 6.71 (d, 2H), 4.56 (d, 2H), 2.96 (s, 6H); LCMS(M+1) = 431.20	
96	3-メチル-N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ブタンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.51 (q, 1H), 8.37 (t, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 4.40 (d, 2H), 1.98-2.04 (m, 3H), 0.88-0.91 (m, 6H); LCMS(M+1) = 368.10	30
97	4- (トリフルオロメチル) -N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.45 (q, 1H), 9.34 (t, 1H), 8.10 (d, 2H), 8.06 (s, 1H), 7.87 (d, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 4.63 (d, 2H); LCMS(M) = 455.75	
98	N- ((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリ	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9.44 (q, 1H), 9.31 (t, 1H), 9.06 (q, 1H), 8.71 (dd, 1H), 8.23 (dt, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H),	40

【表 5 - 3】

	ジン-2-イル) メチル) ニコチン アミド	7.70 (d, 1H), 7.52 (ddd, 1H), 4.63 (d, 2H); LCMS(M) = 388.75
99	N-((6-(5-(トリフルオロメ チル) -1,2,4-オキサジアゾール -3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリ ジン-2-イル) メチル) イソニコ チンアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, 1H), 9.41 (t, 1H), 8.74 (dd, 2H), 8.06 (s, 1H), 7.80 (dd, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.69-7.71 (m, 1H), 4.62 (d, 2H); LCMS(M) = 388.75

10

【0423】

実施例6：3-(2-((4-メトキシフェニル) チオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5-(トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾールの調製 (化合物番号100)

【0424】

工程1：2-(クロロメチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル

【0425】

エタノール (40 mL) 中の6-アミノニコチノニトリル (15 g、126ミリモル) の攪拌溶液に、1,3-ジクロロプロパン-2-オン (63.9 g、504ミリモル) を窒素雰囲気下で添加し、60 で16時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を重曹の氷冷飽和溶液 (160 mL) に注ぎ、濾過して粗生成物2-(クロロメチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル (20 g、104 mmol、83%収率)。

20

【0426】

工程2：(Z)-2-(クロロメチル) -N'-ヒドロキシイミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド

【0427】

エタノール (10 mL) 中の2-(クロロメチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル (8.64 g、45.1ミリモル) の攪拌溶液に、ヒドロキシルアミン (4.47 mL、67.6ミリモル) を加え、25 °Cで4時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去して、(Z)-2-(クロロメチル) -N'-ヒドロキシイミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド (9.9 g、44.1ミリモル、98%収率) と 2-(エトキシメチル) -N'-ヒドロキシイミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキシイミダミドの混合物を得た。

30

【0428】

工程3：3-(2-(クロロメチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5-(トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール

【0429】

(Z)-2-(クロロメチル) -N'-ヒドロキシイミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド (2.3 g、10.24 mmol) 及び2-(エトキシメチル) -N'-ヒドロキシイミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミドのテトラヒドロフラン (12 mL) 中の溶液に無水トリフルオロ酢酸 (1.848 mL、13.09ミリモル) を窒素雰囲気下0 で加えた。得られた反応混合物を25 で16時間攪拌した。反応混合物を、飽和重炭酸ナトリウム水溶液 (100 mL) に0~5 で注ぐことによりクエンチした。生成物を酢酸エチル (150 mL) に抽出した。酢酸エチル層を水 (50 mL) で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液0-50%酢酸エチルを使用するシリカゲルのカラムクロマトグラフィーにより精製して、3-(2-(クロロメチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5-(トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール (3 g、9.91 mmol、97%収率) 及び2-(エトキシメチル) -N'-ヒドロキシイミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミドを得た。

40

【0430】

¹H-NMR (400 MHz, DMSO-*d*6) 9.45 (q, 1H), 8.07 (d, 1H), 7.75 (dd, 1

50

H), 7.68-7.70 (m, 1H), 4.58 (d, 2H), 3.56 (q, 2H), 1.15 (t, 3H); LCMS (M+1): 313.15。

【0431】

工程4: 3-(2-(4-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール

【0432】

アセトニトリル(8mL)中の4-メトキシベンゼンチオール(0.264mL、2.148ミリモル)の攪拌溶液に、炭酸カリウム(457mg、3.30ミリモル)を加え、0 で10分間攪拌した。次に、3-(2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(500 mg、1.652 mmol)のN,N-ジメチルホルムアミド中の溶液を加えた。得られた反応混合物を60 で3時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチル(15mL)で希釈し、水(15mL)で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧濃縮して粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液20%酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、3-(2-(4-メトキシフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(244 mg、0.6 mmol、37%収率)を得た。

10

【0433】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) 8.88-8.94 (m, 1H), 7.85 (dd, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.33-7.37 (m, 2H), 6.82 (dt, 2H), 4.21-4.23 (m, 2H), 3.78 (s, 3H); LCMS (M+1): 407.35。

20

【0434】

表6: 以下の化合物は、化合物番号100と同様の手順で調製した。

【0435】

30

40

50

【表 6 - 1】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
101	3-(2-(フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.43 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.67-7.70 (m, 1H), 7.37-7.40 (m, 2H), 7.27-7.32 (m, 2H), 7.14-7.19 (m, 1H), 4.37 (s, 2H); LCMS (M+1) = 377.40
102	3-(2-(4-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.42 (q, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.41 (dt, 2H), 7.35 (dt, 2H), 4.38 (s, 2H); LCMS (M+1) = 411.20
103	3-(2-(3-クロロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.43-9.45 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.48 (t, 1H), 7.34 (dt, 1H), 7.28-7.32 (m, 1H), 7.20-7.25 (m, 1H), 4.43 (s, 2H); LCMS (M) = 410.95
104	3-(2-(3-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.44 (q, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68-7.70 (m, 1H), 7.29-7.35 (m, 2H), 7.20 (dq, 1H), 6.95-7.00 (m, 1H), 4.43 (s, 2H); LCMS (M+1) = 395.35
105	3-(2-(4-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.42 (q, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.67-7.69 (m, 1H), 7.42-7.47 (m, 2H), 7.12-7.18 (m, 2H), 4.33 (s, 2H); LCMS (M+1) = 395.35
106	3-(2-(2-フルオロフェニル)チオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.45 (q, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.56 (td, 1H), 7.16-7.30 (m, 3H), 4.40 (s, 2H); LCMS (M+1) = 395.35
107	3-(2-(プロピルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.44 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.81 (d, 2H), 2.52 (t, 2H), 1.56 (td, 2H), 0.91 (q, 3H); LCMS (M+1) = 343.35
108	3-(2-(ベンジルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.43 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.69 (dd, 1H), 7.30-7.37 (m, 4H), 7.21-7.26 (m, 1H), 3.80 (s, 2H), 3.74 (s, 2H); LCMS (M+1) = 391.40

10

20

30

40

50

【表 6 - 2】

109	3- (2- (((4-メトキシベンジル) チオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.43 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.68-7.76 (m, 2H), 7.24-7.28 (m, 2H), 6.85-6.89 (m, 2H), 3.72-3.75 (m, 7H) ; LCMS (M+1) = 421.35	
110	3- (2- (((3,4-ジクロロフェニル) チオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.75 (dd, 1H), 7.68-7.70 (m, 2H), 7.53 (d, 1H), 7.37 (dd, 1H), 4.45 (s, 2H) ; LCMS (M+1) = 444.90	10
111	3- (2- (((3,5-ジクロロフェニル) チオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.68-7.77 (m, 2H), 7.47-7.48 (m, 2H), 7.37 (t, 1H), 4.50 (s, 2H) ; LCMS (M+1) = 446.80	
112	3- (2- ((イソブチルチオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.82 (s, 2H), 2.44 (d, 2H), 1.74-1.81 (m, 1H), 0.93 (t, 6H) ; LCMS (M+1) = 357.50	20
113	3- (2- ((シクロペンチルチオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.42-9.50 (m, 1H), 8.09 (d, 1H), 7.66-7.80 (m, 2H), 3.88 (d, 2H), 3.12-3.19 (m, 1H), 1.90-1.98 (m, 2H), 1.58-1.71 (m, 2H), 1.40-1.56 (m, 4H) ; LCMS (M+1) = 369.40	
114	3- (2- ((シクロヘキシルチオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.43 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 3.87 (s, 2H), 2.71-2.77 (m, 1H), 1.92-1.96 (m, 2H), 1.68 (d, 2H), 1.54 (d, 1H), 1.21-1.29 (m, 5H) ; LCMS (M+1) = 383.40	30
115	3- (2- (((2-エチルフェニル) チオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.43 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.68-7.76 (m, 2H), 7.44-7.46 (m, 1H), 7.10-7.20 (m, 3H), 4.34 (s, 2H), 2.64 (q, 2H), 1.08-1.13 (m, 3H) ; LCMS (M+1) = 406.00	40

【0436】

実施例7：3- (2- ((フェニルスルホニル) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール (化合物番号116) の調製

【0437】

3- (2- ((フェニルチオ) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール (250 mg、0.664 mmol) のジクロロメタン (5 mL) 中の攪拌溶液に、*m*-クロロペルオキシ安息香酸 (252 mg、1.461 mmol) を0 °Cで加え、25 °Cで16時間攪拌した。反応終了後、反応混合物をジクロロメタン (20 mL) で希釈し、重曹飽和溶液 (20 mL) で洗浄した。ジクロロメタン層を無水硫酸ナ

トリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液 30% 酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、3 - (2 - ((フェニルスルホニル)メチル)イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 6 - イル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール (135 mg、0.331 mmol、50% 収率)。

【 0 4 3 8 】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) 9.49 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.75-7.78 (m, 2H), 7.66-7.73 (m, 2H), 7.63 (d, 1H), 7.54-7.58 (m, 2H), 4.80-4.90 (m, 2H): LCMS (M+1): 409.05.

【 0 4 3 9 】

表 7 : 以下の化合物は、化合物番号 1 1 6 の手順と類似の手順によって調製された。

【 0 4 4 0 】

10

20

30

40

50

【表 7 - 1】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
117	3-(2-((3,4-ジクロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.04 (d, 1H), 7.85-7.88 (m, 1H), 7.75-7.79 (m, 1H), 7.66-7.71 (m, 2H), 5.01 (s, 2H); LCMS (M+1) = 476.80
118	3-(2-((3-クロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.84 (t, 1H), 7.80 (dq, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.71-7.74 (m, 1H), 7.69-7.69 (OH), 7.66 (d, 1H), 7.61 (t, 1H), 4.97 (s, 2H); LCMS (M+1) = 443.00
119	3-(2-((4-クロロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.74-7.80 (m, 3H), 7.66-7.69 (m, 3H), 4.92 (s, 2H); LCMS (M+1) = 444.00
120	3-(2-((3-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (q, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.74-7.78 (m, 1H), 7.57-7.69 (m, 5H), 4.96 (s, 2H); LCMS (M+1) = 427.30
121	3-(2-((4-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.51 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.82-7.86 (m, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.40-7.46 (m, 2H), 4.89 (s, 2H); LCMS (M+1) = 427.20
122	3-(2-((4-メトキシベンジル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.56 (t, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.82 (dd, 2H), 7.40 (dt, 2H), 6.96 (dt, 2H), 4.57 (s, 2H), 4.52 (s, 2H), 3.75 (s, 3H); LCMS (M+1) = 453.25
123	3-(2-(シクロヘキシルスルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.55 (t, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.75-7.81 (m, 2H), 4.63 (s, 2H), 3.16 (tt, 1H), 2.14 (d, 2H), 1.82 (d, 2H), 1.64 (d, 1H), 1.41 (qd, 2H), 1.14-1.31 (m, 3H); LCMS (M+1) = 415.50
124	3-(2-((2-フルオロフェニル)スルホニル)メチル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.57 (q, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.77-7.83 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.68 (td, 1H), 7.53 (ddd, 1H), 7.37 (td, 1H), 5.03 (s, 2H); LCMS (M+1) = 426.90

10

20

30

40

50

【表 7 - 2】

126	3-(2-(((3,4-ジクロロフェニル) スルフィニル) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5-(トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.52 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.75-7.81 (m, 3H), 7.68 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 4.50 (d, 1H), 4.36 (d, 1H); LCMS (M+1) = 460.75
127	3-(2-(((3-クロロフェニル) スルフィニル) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5-(トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.51 (q, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.77 (dd, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.64 (q, 1H), 7.54-7.61 (m, 3H), 4.46 (d, 1H), 4.33 (d, 1H); LCMS (M) = 426.85
128	3-(2-(((2-フルオロフェニル) スルフィニル) メチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-6-イル) -5-(トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.50 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.58-7.62 (m, 2H), 7.33-7.42 (m, 2H), 4.46 (d, 1H), 4.34 (d, 1H); LCMS (M+1) = 411.25

10

【0441】

実施例 8 : N-(メチル(オキソ)(フェニル)-6-スルファニリデン)-2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセトアミド(化合物番号129)

20

【0442】

工程 1 : -エチル 2-(6-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート

【0443】

エタノール(70 mL)中の6-アミノニコチノニトリル(7g、58.8ミリモル)の攪拌溶液に、4-クロロ-3-オキソブタン酸エチル(19.98 mL、147ミリモル)を加え、60 で48時間攪拌した。反応混合物を25 で1時間攪拌し、次にそれを濾過して純粋な生成物を得た。生成物を重炭酸ナトリウムの飽和溶液(50 mL)と共に攪拌し、次に濾過して、2-(6-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)酢酸エチル(11g、41.4ミリモル、71%収率)を得た。

30

【0444】

工程 2 : エチル 2-(6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート

【0445】

エタノール(100 mL)中の2-(6-シアノイミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)酢酸エチル(9.1g、39.7ミリモル)の攪拌溶液に、ヒドロキシルアミン(6.50 mL、119ミリモル)を25 で加えた。得られた反応混合物を25 で4時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去して、粗製の2-(6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテートエチル(10.1g、38.5 mmol、97%収率)を得た。

40

【0446】

工程 3 : エチル 2-(6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)アセテート

【0447】

2-(6-(N'-ヒドロキシカルバミドイル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)酢酸エチル(10.1 g、38.5 mmol)とテトラヒドロフラン(100 mL)の攪拌溶液に、無水トリフルオロ酢酸(7.62 mL、53.9 mmol)を窒素雰囲気下0 °Cで加え、反応混合物を25 °Cで16時間攪拌した。反応混合物を、飽和重炭酸ナトリウム水溶液(100 mL)に0 ~ 5 で注ぐことによりクエンチした。生成物を酢酸エチル(150 mL)に抽出した

50

。酢酸エチル層を水（50 mL）で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、2-（6-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）アセテートエチル（10.52 g、30.9 mmol、80%収率）。

【0448】

工程4：N-（メチル（オキソ）（フェニル）-6-スルファニリデン）-2-（6-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）アセトアミド

【0449】

トルエン（7 mL）中のイミノ（メチル）（フェニル）-6-スルファノン（205 mg、1.323ミリモル）の攪拌溶液に、ヘキサン中の25%トリメチルアルミニウム（0.636 mL、2.204ミリモル）を0~5 で加えた。25 °Cで30分間攪拌した。次に、2-（6-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）酢酸エチル（300 mg、0.882 mmol）を窒素雰囲気下加えた。得られた反応混合物を65 で16時間攪拌した。反応混合物を25 に冷却し、10%酢酸水溶液（10 mL）の氷冷溶液に注いだ。生成物を酢酸エチル（30 mL）で抽出した。酢酸エチル層を重曹水溶液で洗浄した。（10 mL）、無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物を分取HPLCにより精製して、N-（メチル（オキソ）（フェニル）-6-スルファニリデン）-2-（6-（5-（トリフルオロメチル）-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル）イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル）アセトアミド（112 mg、0.25 mmol、28%収率）を得た。

10

20

【0450】

¹H-NMR（400 MHz, DMSO-d₆） 9.45 (q, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.95-7.97 (m, 2H), 7.71-7.75 (m, 2H), 7.63-7.68 (m, 3H), 3.77 (s, 2H), 3.43 (d, 3H): LCMS (M+1): 450.40.

【0451】

表8：以下の化合物は、化合物129と同様の手順を使用して調製した。

【0452】

30

40

50

【表 8 - 1】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
130	N- ((2-フルオロフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2- a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q 1H), 8.01 (s, 1H), 7.94 (td, 1H), 7.78-7.83 (m, 1H), 7.72 (dd 1H), 7.66 (d, 1H), 7.47-7.53 (m, 2H), 3.75 (d, 2H), 3.52 (s, 3H); LCMS (M+1): 468.40
131	N- ((3-フルオロフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2- a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.47 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.81-7.85 (m, 2H), 7.71-7.77 (m, 2H), 7.68 (d, 1H), 7.60-7.65 (m, 1H), 3.75-3.88 (m, 2H), 3.51 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 468.40
132	N- ((4-フルオロフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2- a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03-8.06 (m, 3H), 7.73 (dd, J = 9.4, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.48-7.54 (m, 2H), 3.77 (dd, J = 18.0, 16.5 Hz, 2H), 3.48 (s, 3H); LCMS(M+1):468.00
133	N- ((3-メトキシフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2- a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.47 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.75 (dd, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.54 (dt, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.29 (dq, 1H), 3.83 (t, 3H), 3.78 (d, 2H), 3.47 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 480
134	N- (ジメチル (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.66-7.69 (m, 1H), 3.71 (s, 2H), 3.35 (s, 6H) ; LCMS (M+1): 388
135	N- (1-オキシデテトラヒドロ-2H-1 λ 6-チオピラン-1-イリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 3.72 (s, 2H), 3.54-3.59 (m, 2H), 3.34-3.38 (m, 2H), 1.90-1.97 (m, 2H), 1.78-1.87 (m, 2H), 1.50-1.59 (m, 2H) ; LCMS (M+1): 428.05
136	N- ((4-クロロフェニル) (2-メトキシエチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾ	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.91-7.96 (m, 2H), 7.68-7.74 (m, 4H), 3.85-3.96 (m, 2H),

10

20

30

40

50

【表 8 - 2】

	ール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	3.79 (dd, 2H), 3.55-3.67 (m, 2H), 2.99 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 528
137	N- (イソプロピル (メチル) (オキソ) -λ6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン- 2-イル) アセトアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.48 (q, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 3.72 (s, 2H), 3.64 (td, 1H), 3.30 (d, 3H), 1.24-1.44 (m, 6H) ; LCMS (M+1):415.75
138	N- ((4-メトキシフェニル) (メチル) (オキソ) -λ6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2- a]ピリジン- 2-イル) アセトアミド	¹ H-NMR- (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45-9.47 (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.87-7.90 (m, 2H), 7.66-7.74 (m, 2H), 7.14-7.18 (m, 2H), 3.84 (d, 3H), 3.76 (t, 2H), 3.43 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 480.05
139	N- (メチル (オキソ) (4- (トリフルオロメチル) フェニル) -λ6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2 -a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	¹ H-NMR - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (t, 1H), 8.19 (d, 2H), 8.04 (t, 3H), 7.73 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.78 (d, 2H), 3.52 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 518.00
140	N- ((3,5-ジクロロフェニル) (メチル) (オキソ) -λ6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール- 3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン- 2-イル) アセトアミド	¹ H-NMR - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.03 (t, 2H), 7.95 (d, 2H), 7.74 (dd, 1H), 7.68 (d, 1H), 3.76 (dd, Hz, 2H), 3.53 (s, 3H) ; LCMS (M-1): 517.70
141	N- (1-オキシドテトラヒドロ-1λ6-チオフェン-1-イリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン- 2-イル) アセトアミド	¹ H-NMR - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 3.71 (d, 2H), 3.47-3.54 (m, 2H), 3.16 (d, 2H), 2.15-2.24 (m, 2H), 2.06-2.11 (m, 2H) ; LCMS (M+1): 413.95
142	N- ((4-ブロモフェニル) (メチル) (オキソ) -λ6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2- a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	¹ H-NMR - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.88-7.93 (m, 4H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 3.78 (dd, 16.6 Hz, 2H), 3.49 (s, 3H) ; LCMS (M-1): 527.70

10

20

30

40

50

【表 8 - 3】

143	N- ((3,4-ジクロロフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.17 (d, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.95-7.96 (m, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.70 (d, 1H), 3.81 (d, 1H), 3.74 (d, 1H), 3.53 (s, 3H) - LCMS (M+1): 517.70
144	N- (4-オキシド-1,4 λ 6-オキサチアン-4-イリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.46 (q, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.66 (d, 1H), 4.08 (td, 2H), 3.81-3.87 (m, 2H), 3.76 (s, 2H), 3.70 (dt, 2H), 3.45-3.52 (m, 2H) ; LCMS (M+1):429.95
145	N- ((2-メトキシフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.64-7.73 (m, 3H), 7.28 (d, 1H), 7.16-7.20 (m, 1H), 3.87 (d, 3H), 3.69 (s, 2H), 3.45 (s, 3H) ; LCMS (M+1) : 480
146	N- ((4-メトキシピリジン-2-イル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ - (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.30 (q, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.74 (d, 2H), 3.44 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 481.05
147	N- ((4-クロロフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.45 (q, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.98 (dt, 2H), 7.71-7.76 (m, 3H), 7.68 (d, 1H), 3.76 (dd, 2H), 3.48 (s, 3H) ; LCMS (M+1): 483.95
148	N- (メチル (オキシ) (o-トリル) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.94 (dd, 1.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, 1.7 Hz, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.59 (td, 1H), 7.45 (q, 2H), 3.76 (s, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.54 (s, 3H) ; LCMS (M+1) : 464.45
149	N- ((3-クロロフェニル) (メチル) (オキシ) - λ 6-スルファンイリデン) -2- (6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) アセトアミド	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.44 (q, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.97 (t, 1H), 7.92 (dq, 1H), 7.80 (dq, 1H), 7.72-7.74 (m, 1H), 7.66-7.70 (m, 2H), 3.70-3.83 (m, 2H), 3.50 (s, 3H) ; LCMS (M+1):484.05

10

20

30

40

【 0 4 5 3 】

実施例 9 : N- (メチル (オキシ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) - λ 6-スルファンイリデン) ベンズアミド (化合物番号 155) の調製

【 0 4 5 4 】

工程 1 : -2- (クロロメチル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【 0 4 5 5 】

エタノール (100 mL) 中の 2-アミノイソニコチノニトリル (20 g、168 ミリモル) の攪拌溶液に、1,3-ジクロロプロパン-2-オン (38.4 g、302 ミリモル) を加え、50 で 16

50

時間攪拌した。反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム水溶液でクエンチし、得られた沈殿物をブフナー漏斗で濾過し、最小量のエタノールで洗浄して、未反応の出発物質を除去した。得られた残留物は、2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(21g、110mmol、65%の収率)である。

【0456】

工程2: 2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【0457】

テトラヒドロフラン(20mL)中の2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(1.0g、5.22ミリモル)の攪拌溶液に、メタンチオレートナトリウム(0.439g、6.26ミリモル)を少しずつ0°Cでゆっくりと加え、さらに25°Cで8時間攪拌した。得られた反応混合物を水でクエンチし、酢酸エチル(20mL)で2回抽出し、ブライン(20mL)で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液20%の酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーによって精製して、2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(0.98g、4.82mmol)、92%収率)を得た。

10

【0458】

工程3: N'-ヒドロキシ-2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド

【0459】

N'-ヒドロキシ-2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミドの合成の実験手順は、実施例8の工程2と同様である(7.8g、33.0mmol、96%収率)。

20

【0460】

工程4: 3-(2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール

【0461】

3-(2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾールの合成の実験手順は、実施例8の工程3と同様である。(8.25g、26.2mmol、86%の収率)。

30

【0462】

工程5: イミノ(メチル)(7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン

【0463】

3-(2-(メチルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(8.5g、27.0mmol)及びメタノール(50mL)中のカルバミン酸アンモニウム(5.28g、67.6ミリモル)の溶液に、ヨードベンゼンジアセテート(21.78g、67.6ミリモル)を0°Cでゆっくりと少しずつ加え、25°Cで12時間攪拌した。得られた反応混合物を減圧下で濃縮した。得られた粗残留物を酢酸エチル(50mL)で希釈し、溶液を重炭酸ナトリウム(80mL)溶液で中和した。酢酸エチル層を集め、水層を酢酸エチル(50mL)で3回抽出した。合わせた酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下で濃縮した。粗残留物を、ジクロロメタン中の溶離液10%のメタノールを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、イミノ(メチル)(7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン(4.8g、13.90mmol、51%収率)を得た。

40

【0464】

工程6: N-(メチル(オキシ)(7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファンイリデン)ベンズアミド

50

【0465】

イミノ(メチル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン(0.2g、0.579ミリモル)及び4-ジメチルアミノピリジン(0.014g、0.116ミリモル)の攪拌溶液に、トリメチルアミン(0.109mL、1.158ミリモル)及びジクロロメタン(10mL)を0で加え、続いて塩化ベンゾイル(0.122g、0.869ミリモル)を加えた。25で3時間攪拌した。得られた反応混合物を水で希釈し、酢酸エチル(20mL)で2回抽出し、ブライン(20mL)で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた粗生成物を、ヘキサン中の溶離液80%の酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、N-(メチル(オキシ)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール)3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファニリデン)ベンズアミド(0.124g、0.276mmol、48%収率)を得た。

10

【0466】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO-d₆) 8.83-8.30 (m, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.27-8.25 (m, 1H), 8.00-7.98 (m, 2H), 7.57-7.51 (m, 2H), 7.46-7.42 (m, 2H), 5.29-5.11 (m, 2H), 3.51 (s, 3H); $^{19}\text{F-NMR}$ (377 MHz, CHLOROFORM-D) -64.67; LCMS (M+H): 449.95.

【0467】

表9：以下の化合物は、化合物番号155の手順と類似の手順によって調製された

20

【0468】

30

40

50

【表 9 - 1】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
152	イミノ (メチル) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ 6-スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78 (dd, 1H), 8.20 (q 2H), 7.49 (dd, 1H), 4.57 (dd, 2H), 3.73 (s, 1H), 2.96 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.68; LCMS (M+H): 345.95.
153	N- (メチル (オキソ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ 6-スルファニリデン) ピバルアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82 (dd, 1H), 8.22-8.19 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 5.08 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 0.98 (s, 9H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 430.05.
154	4-メトキシ-N- (メチル (オキソ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ 6-スルファニリデン) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82-8.78 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.25-8.23 (m, 1H), 7.93 (dt, 2H), 7.50 (dd, 1H), 6.95 (dt, 2H), 5.21 (t, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.46 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 479.80.
156	4-クロロ-2-フルオロ-N- (メチル (オキソ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ 6-スルファニリデン) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.80 (dd, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.82 (t, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.45 (dd, 1H), 7.33-7.30 (m, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.48 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58, -109.05; LCMS (M+H): 501.95.
157	3-フルオロ-N- (メチル (オキソ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ 6-スルファニリデン) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.80 (dd, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.80 (dt, 1H), 7.66 (dq, 1H), 7.52-7.46 (m, 2H), 7.41-7.36 (m, 1H), 5.25 (dd, 2H), 3.51 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58, -113.12; LCMS (M+H): 467.95.
158	3-クロロ-N- (メチル (オキソ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ 6-スルファニリデン) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (dd, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.61 (dt, 1H), 7.52-7.45 (m, 2H), 5.26 (dd, 2H), 3.51 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 483.95.
159	4-クロロ-N- (メチル (オキソ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82-8.78 (m, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.53-7.48 (m, 3H), 5.25 (dd, 2H),

10

20

30

40

50

【表 9 - 2】

	イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ6-スルファニリデン) ベンズアミド	3.50 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58; LCMS (M+H): 484.00.	
160	N-(メチル(オキソ) (7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) -λ6-スルファニリデン) -4-(トリフルオロメトキシ) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.81 (dd, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.24 (t, 1H), 8.11-8.08 (m, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.43 (dd, 2H), 5.27 (s, 2H), 3.52 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -56.60, -64.68; LCMS (M+H): 534.	10
161	N-(メチル(オキソ) (7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) -λ6-スルファニリデン) -2-(トリフルオロメチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.82 (dd, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 7.74-7.72 (m, 1H), 7.69-7.58 (m, 3H), 7.52 (dd, 1H), 5.25 (dd, 2H), 3.48 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -57.31, -64.58; LCMS (M+H): 517.95	20
162	N-(メチル(オキソ) (7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) -λ6-スルファンイリデン) -3-(トリフルオロメチル) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.79 (dd, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.22-8.24 (m, 3H), 7.91 (d, 1H), 7.70 (t, 1H), 7.51 (dd, 1H), 5.28 (dd, 2H), 3.54 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ -61.22, -64.68; LCMS (M-H): 516	
163	2-フルオロ-N-(メチル(オキソ) (7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル) -λ6-スルファンイリデン) ベンズアミド	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.80 (dd, 1H), 8.29 (s, 1H), 8.23 (t, 1H), 7.77 (td, 1H), 7.48-7.54 (m, 2H), 7.18-7.22 (m, 2H), 5.22 (d, 2H), 3.48 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ -64.67, -112.36; LCMS (M+H): 468.00	30

【0469】

実施例10: イミノ(フェニル) (7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン(化合物番号164)の調製

【0470】

工程1: -2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【0471】

エタノール(100mL)中の2-アミノイソニコチノニトリル(20g、168ミリモル)の攪拌溶液に、1,3-ジクロロプロパン-2-オン(38.4g、302ミリモル)を加え、50で16時間攪拌した。反応混合物を飽和重曹水溶液(500mL)でクエンチし、得られた沈殿物をブフナー漏斗で濾過し、得られた固体をエタノール(50mL)で洗浄した。得られた残留物を減圧下で乾燥させて、2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(21g、110mmol、65%の収率)を得た。

【0472】

10

20

30

40

50

工程2：2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミ
ダミド

【0473】

エタノール(50mL)中の2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニト
リル(10.25g、53.5mmol)の攪拌溶液に、水中の50wt.%のヒドロキシルアミン溶
液(6.56mL、107ミリモル)を25 で加えた。得られた反応混合物を60 で3時間攪
拌し、減圧下で濃縮して、2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]ピリジン
-7-カルボキシミダミド(11.54g、53.5mmol、96%収率)を得た。

【0474】

工程3：3-(2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロ
メチル)-1,2,4-オキサジアゾール 10

【0475】

テトラヒドロフラン(50mL)中の2-(クロロメチル)-N'-ヒドロキシイミダゾ[1,2-a]
ピリジン-7-カルボキシミダミド(12.0g、53.4ミリモル)の攪拌溶液に、無水トリフ
ルオロ酢酸(13.58mL、96ミリモル)を窒素雰囲気下、0~5 でゆっくりと加え、2
5 で18時間攪拌した。得られた混合物を減圧下で濃縮し、得られた残留物をジクロロ
メタン(100mL)に溶解した。ジクロロメタン層を重炭酸ナトリウム水溶液(50mL)
、続いてブライン(50mL)で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮し
た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液60%の酢酸エチルを使用するシリカゲルのフラッ
シュカラムクロマトグラフィーによって精製して、3-(2-(クロロメチル)イミダゾ
[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジア
ゾール(12.56g、41.5mmol、78%収率)を得た。 20

【0476】

工程4：3-(2-(フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリ
フルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール

【0477】

窒素雰囲気下、アセトニトリル(8mL)中のベンゼンチオール(0.473g、4.30ミリモ
ル)の攪拌溶液に、炭酸カリウム(0.91g、6.6ミリモル)を加え、反応混合物を0 で
10分間攪拌した。得られた反応混合物に対して、N,N-ジメチルホルムアミド中の3-(2
-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフルオロメチル)-1,2,
4-オキサジアゾール(1.0g、3.30ミリモル)の溶液を加え、得られた反応混合物を60
で3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を酢酸エチル(15mL)で希釈し、水(1
5mL)で洗浄した。酢酸エチル層を分離し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で
濃縮して、粗製物を得た。粗生成物を、ヘキサン中の溶離液10%の酢酸エチルを使用す
るシリカゲルのフラッシュカラムクロマトグラフィーにより精製して、3-(2-(
フェニルチオ)メチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル)-5-(トリフル
オロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール(1.03g、2.73mmol、83%収率)を得た。 30

【0478】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CHLOROFORM-D) 8.39(t, 1H), 8.20-8.12(m, 1H), 7
.49-7.45(m, 1H), 7.38-7.35(m, 2H), 7.29-7.24(m, 3H), 7.19-7.15(m, 1H), 40
4.36(s, 2H); LCMS(M+H): 377.35。

【0479】

工程5：-イミノ(フェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾ
ール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノン

【0480】

イミノ(フェニル)((7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イ
ル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)-6-スルファノンの合成の実験手順は
、実施例9の工程-5と同様である。(0.132g、31%)

【0481】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO-d6) 8.76(dd, 1H), 8.08-8.06(m, 2H), 7.80-7 50

.77(m, 2H), 7.65-7.61(m, 1H), 7.53(td, 2H), 7.46(dd, 1H), 4.68(dd, 2H), 4.41(s, 1H); ¹⁹F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) -64.68; LCMS(M+H): 407.85。

表 10 : 以下の化合物は、化合物番号 164 の手順と類似の手順によって調製された【0482】

【表 10】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
165	イミノ (4-メトキシフェニル) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ6-スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.76 (dd, 1H), 8.10 (t, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.06-7.02 (m, 2H), 4.63 (dd, 2H), 4.26 (s, 1H), 3.81 (s, 3H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.68; LCMS (M+H): 438.05
166	(4-クロロフェニル) (イミノ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ6-スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.76 (dd, 1H), 8.09-8.07 (m, 2H), 7.76 (dt, 2H), 7.60 (dt, 2H), 7.46 (dd, 1H), 4.71 (dd, 2H), 4.54 (s, 1H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.67; LCMS (M+H): 441.70
167	(4-フルオロフェニル) (イミノ) ((7- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) -λ6-スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 8.78-8.76 (m, 1H), 8.07 (d, 2H), 7.82-7.78 (m, 2H), 7.46 (dd, 1H), 7.38-7.33 (m, 2H), 4.70 (dd, 2H), 4.50 (s, 1H); ¹⁹ F-NMR (377 MHz, CHLOROFORM-D) δ -64.58, -107.05; LCMS (M+H): 425.85

10

20

30

【0483】

実施例 11 : (3-フルオロフェニル) (メチル) (((6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-イル) メチル) イミノ) -λ6-スルファノン (化合物番号 168) の調製

【0484】

工程-1 : 6- (5- (トリフルオロメチル) -2,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド

【0485】

6- (5- (トリフルオロメチル) -1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-カルボン酸エチル (3.5 g、10.73 mmol) のジクロロメタン (150 mL) 中の溶液に攪拌しながら、DIBAL-H (37.5 mL、37.5 mmol) を -78 °C で滴下し、同じ温度でさらに 30 分間攪拌した。反応混合物を 10 % 酢酸 (250 mL) でクエンチし、そしてジクロロメタン (150 mL) で 3 回抽出した。合わせた有機層をさらにブライン (100 mL) で 2 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で蒸発乾固させて、6- (5- (トリフルオロメチル) -2,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ [1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド (3.0 g、10.56 mmol、98 % 収率) を得た。この組成物は、次の工程でそのまま繰り越された。

40

【0486】

50

工程-2：6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド

【0487】

6-(5-(トリフルオロメチル)-2,5-ジヒドロ-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド(3g、10.56)のジクロロメタン(15mL)中の攪拌溶液に2,3-ジクロロ-5、

6-ジシアノ-1,4-ベンゾキノン(1.198g、5.28ミリモル)を0 で加え、さらに25で30分間攪拌した。反応の完了後、反応混合物を飽和重炭酸ナトリウム(100mL)でクエンチし、酢酸エチル(100mL)で3回抽出した。合わせた有機層をブライン(50mL)で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、蒸発乾固させた。得られた粗生成物をコンピフラッシュにより精製し、ヘキサン中の20%酢酸エチルで所望の化合物を溶出して、白色固体として6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド(1.5g、5.32mmol、2段階で50%の収率)を得た。

10

【0488】

工程3：(3-フルオロフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン

【0489】

ギ酸(0.3g、1.063mmol)中の6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルバルデヒド(0.3g、1.063mmol)の攪拌溶液に3mL)、(3-フルオロフェニル)(イミノ)(メチル)-6-スルファノン(0.331g、1.914mmol)を加えた。得られた混合物をマイクロ波で130 で1時間照射した。反応の完了後、反応混合物を冷飽和重炭酸ナトリウム(200mL)に注ぎ、酢酸エチル(100mL)で3回抽出した。合わせた有機層をブライン(100mL)で2回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、真空下で蒸発乾固させた。粗化合物を分取HPLCにより精製して、(3-フルオロフェニル)(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン)-2-イル)メチル)イミノ)-6-スルファノン(0.017g、0.039mmol、3.6%収率)を得た。

20

【0490】

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO-*d*6) 9.42(q, 1H), 8.02(s, 1H), 7.76(dt, 1H), 7.65-7.72(m, 3H), 7.62(d, 1H), 7.51-7.56(m, 1H), 4.17(d, 1H), 4.02(d, 1H), 3.28(s, 3H); LCMS(M+1): 440.5。

30

【0491】

表11：以下の化合物は、化合物番号168の手順と類似の手順によって調製された

【0492】

【表11】

化合物番号	IUPAC名	分析データ
169	エチル(メチル)((6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-イル)メチル)イミノ)- λ 6-スルファノン	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- <i>d</i> 6) δ 9.42 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 4.27 (s, 2H), 3.16-3.22 (m, 2H), 2.96 (s, 3H), 1.22-1.27 (m, 3H); ; LCMS (M+1): 374.00

40

【0493】

実施例12：(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)-6-スルファノン(化合物番号170)の調製

50

【0494】

工程-1: 3-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アミノ)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル

【0495】

(3-フルオロフェニル)(イミノ)(メチル)-6-スルファノン(0.3 g、1.732 mmol)のジメチルスルホキシド(2 mL)溶液に、水酸化カリウム(0.097 g、1.732 mmol)を窒素雰囲気下、0°Cで添加し、25°Cで15分間攪拌した。1 mLのジメチルスルホキシド中の2-(クロロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル(0.266 g、1.386 mmol)の溶液を加え、得られた反応混合物を25°Cで10分間攪拌した。反応混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液(20 mL)でクエンチし、ジクロロメタン(100 mL)で2回抽出した。合わせたジクロロメタン層をブライン(25 mL)で2回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮して、3-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファネイリデン)アミノ)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル(0.09 g、0.274 mmol、16%収率)を得た。

10

【0496】

工程-2: 3-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アミノ)-N'-ヒドロキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド

【0497】

3-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アミノ)-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボニトリル(0.22 g、0.670 mmol)のメタノール(5 mL)溶液に、攪拌しながらヒドロキシルアミン(0.111 mL、2.010 mmol)を窒素雰囲気下0°Cで加えた。反応混合物を25°Cで16時間攪拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、酢酸エチルと2回共蒸留して、3-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アミノ)-N'-ヒドロキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド(0.22 g、0.610 mmol、91%収率)。組成物は次の工程でそのまま繰り越された。

20

【0498】

工程-3: (3-フルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)-6-スルファノン

30

【0499】

3-((3-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファンイリデン)アミノ)-N'-ヒドロキシ-2-メチルイミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-カルボキシミダミド(0.22 g、0.610 mmol)のテトラヒドロフラン(5 mL)中の溶液に、無水トリフルオロ酢酸(0.172 mL、1.221 mmol)を窒素雰囲気下0°Cで加えた。得られた反応混合物を25°Cで16時間攪拌した。反応混合物を重曹の氷冷飽和溶液(25 mL)に注ぎ、酢酸エチル(50 mL)で2回抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して、粗製物(150 mg)を得た。粗生成物をコンビフラッシュにより精製して、捕捉された酢酸を含む120 mgの所望の化合物を得た。次に、材料をテトラヒドロフランに溶解し、炭酸カリウム(50 mg)を加え、25°Cで1時間攪拌し、ろ過し、蒸発乾固して、(3-フルオロフェニル)(メチル)((2-メチル-6-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)-6-スルファノン(0.061 g、0.139 mmol、23%収率)を得た。¹H-NMR(400 MHz, CHLOROFORM-D) 8.98(q, 1H), 7.79(dq, 1H), 7.72(dt, 1H), 7.66(dd, 1H), 7.56(td, 1H), 7.48(dd, 1H), 7.33-7.37(m, 1H), 3.41(s, 3H), 2.31-2.33(m, 3H); LC MS(M+1): 440.05。

40

【0500】

実施例13: (2-フルオロフェニル)(メチル)((2-(トリフルオロメチル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル)イミノ)-6-スルファノン(化合物番号171)の調製

50

【0501】

工程a：2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【0502】

エタノール(50mL)中の2-アミノイソニコチノニトリル(10g、84ミリモル)の攪拌溶液に、3-ブromo-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-オン(13.1mL、126ミリモル)を加え、100°Cで24時間攪拌した。反応を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(70mL)でクエンチした。得られた沈殿物をブフナー漏斗で濾過し、エタノール(10mL)で洗浄して未反応の出発物質を除去した。得られた残留物を空気吸引下で乾燥させて、2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(9.1g、43mmol、51%収率)を得た。

10

【0503】

工程b：3-ブromo-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【0504】

ジクロロメタン(20mL)中の2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(3g、14.21ミリモル)の攪拌溶液に、N-ブromosuccinimide(2.78g、15.63ミリモル)を0で加えた。0でさらに25で15分間攪拌した。反応の完了後、反応を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液(70mL)でクエンチし、酢酸エチル(50mL)に2回抽出した。酢酸エチル層をブライン溶液(25mL)で2回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させて、3-ブromo-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(4g、13.8ミリモル、97%収率)を得た。

20

【0505】

工程c：3-(((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファニリデン)アミノ)-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル

【0506】

攪拌溶液に3-ブromo-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(0.2g、0.7mmol)及び(2-フルオロフェニル)(イミノ)(メチル)-6-スルファノン(0.13g、0.76ミリモル)のトルエン(8mL)中の溶液に、炭酸セシウム(0.52g、1.59ミリモル)、続いて(2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ピナフチル)(0.021g、0.034ミリモル)を加えた。)及び酢酸パラジウム(II)(1.55mg、6.9µmol)を25°Cで加えた。得られた反応混合物を窒素で2分間パージし、110で16時間攪拌した。反応混合物を25に冷却し、セライトのパッドを通して濾過した。フィルターケーキを酢酸エチル(20mL)で洗浄した。濾液を水(5mL)及びブライン溶液(5mL)で洗浄した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。得られた残留物をフラッシュクロマトグラフィーにより精製して、3-(((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファニリデン)アミノ)-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(0.16g、0.42mmol、61%収率)を得た。

30

【0507】

工程d：3-(((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファニリデン)アミノ)-N'-ヒドロキシ-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド

40

【0508】

3-(((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファニリデン)アミノ)-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボニトリル(0.3g、0.78ミリモル)のエタノール(15mL)中の溶液に、攪拌しながらヒドロキシルアミン水溶液(50%)(0.24mL、3.92ミリモル)を加え、得られた反応混合物を60で4時間攪拌した。揮発性物質を減圧下で除去し、得られた残留物をトルエン(10mL)と共蒸発させて、3-(((2-フルオロフェニル)(メチル)(オキソ)-6-スルファニリデン)アミノ)-N'-ヒドロキシ-2-(トリフルオロメチル)イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボ

50

キシイミダミド (0.2 g、0.48 mmol、61% 収率) を得た。

【0509】

工程 e : (2-フルオロフェニル) (メチル) ((2-(トリフルオロメチル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) - 6-スルファノン

【0510】

3-(((2-フルオロフェニル) (メチル) (オキソ) - 6-スルファニリデン) アミノ) -N'-ヒドロキシ-2-(トリフルオロメチル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-カルボキシミダミド (0.2g、0.48ミリモル) のテトラヒドロフラン (2mL) 中の攪拌溶液に、無水トリフルオロ酢酸 (0.1mL、0.72ミリモル) を 5 で 30 分間滴下した。得られた反応混合物を 25 に温め、16 時間攪拌した。反応混合物を重炭酸ナトリウム溶液 (2 mL) でクエンチし、ジクロロメタン (20 mL) で抽出し、水 (5 mL) 及びブライン溶液 (5 mL) で洗浄した。ジクロロメタン層を無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧下で濃縮した。粗製物をヘキサン中の 35% 酢酸エチルのフラッシュクロマトグラフィー溶離液で精製して、(2-フルオロフェニル) (メチル) ((2-(トリフルオロメチル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) - 6-スルファノン (0.14 g、0.28 mmol、58% 収率) を得た。

【0511】

¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) 8.64(dd, 1H), 8.16(q, 1H), 7.76-7.84(m, 2H), 7.50-7.55(m, 2H), 7.40(td, 1H), 3.83(s, 3H) LCMS.

【0512】

表 12 : 以下の化合物は、化合物番号 171 の手順と類似の手順によって調製された。

【0513】

【表 12】

化合物番号	IUPAC 名	分析データ
172	メチル (フェニル) ((2-(トリフルオロメチル)-7-(5-(トリフルオロメチル)-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル) イミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イル) イミノ) - 6-スルファノン	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 8.74-8.65 (m, 1H), 8.24-8.13 (m, 1H), 8.10-7.99 (m, 2H), 7.80-7.60 (m, 3H), 7.57-7.41 (m, 1H), 3.70-3.57 (m, 3H)) LCMS (M+1): 476

【0514】

生物学の例 :

【0515】

本明細書に記載されるように、一般式 (I) の化合物は、重要な農作物を攻撃する多数の植物病原性真菌に関して発揮される殺真菌活性を示す。本発明の化合物は、以下に記載されるようにそれらの活性について評価された。

【0516】

テスト :

【0517】

真菌病原体の生物学的試験例

【0518】

例 1 : *Pyricularia oryzae* (イネいもち菌) :

【0519】

化合物を 0.3% ジメチルスルホキシドに溶解し、ペトリ皿に分注する直前にジャガイモデキストロース寒天培地に添加した。所望の濃度の化合物を含む 5 mL の培地を 60 mm の滅菌ペトリ皿に分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している毒性のある培養プレ

10

20

30

40

50

ートの周囲から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを25°Cの温度と60%の相対湿度の成長チャンバー内で7日間インキュベートした後、放射状の成長を測定し、未処理のコントロールの成長と比較した。化合物12 33 80 87 92 103 113 114 136 138 140 142 146 161は300 ppmで、広範な疾患の発症を示した未治療のチェックと比較した場合、これらのテストで最低70%のコントロールが得られた。

【0520】

例2: *Botrytis cinerea* (灰色かび病) :

【0521】

化合物を0.3%ジメチルスルホキシドに溶解し、ペトリ皿に分注する直前にジャガイモデキストロース寒天培地に添加した。所望の濃度の化合物を含む5mLの培地を60mmの滅菌ペトリ皿に分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している毒性のある培養プレートの周囲から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを22°Cの温度と90%の相対湿度の成長チャンバー内で7日間インキュベートした後、放射状の成長を測定し、未処理のコントロールの成長と比較した。300 ppmの化合物80は、広範な疾患の発症を示した未治療のチェックと比較した場合、これらのテストで最低70%のコントロールを示した。

【0522】

例3: *Alternaria solani* (トマト/ジャガイモの初期の枯死) :

【0523】

化合物を0.3%ジメチルスルホキシドに溶解し、ペトリ皿に分注する直前にジャガイモデキストロース寒天培地に添加した。所望の濃度の化合物を含む5mLの培地を60mmの滅菌ペトリ皿に分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している毒性のある培養プレートの周囲から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを25°Cの温度と60%の相対湿度の成長チャンバー内で7日間インキュベートした後、放射状の成長を測定し、未処理のコントロールの成長と比較した。化合物85 89 92 94 108 113 114 131 138 142 143 146 148 149は300 ppmで、広範な疾患の発症を示した未治療のチェックと比較した場合、これらのテストで最低70%のコントロールが得られた。

【0524】

例4: *Colletotrichum capsici* (炭疽病) :

【0525】

化合物を0.3%ジメチルスルホキシドに溶解し、ペトリ皿に分注する直前にジャガイモデキストロース寒天培地に添加した。所望の濃度の化合物を含む5mLの培地を60mmの滅菌ペトリ皿に分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している毒性のある培養プレートの周囲から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを25°Cの温度と60%の相対湿度の成長チャンバー内で7日間インキュベートした後、放射状の成長を測定し、未処理のコントロールの成長と比較した。300 ppmの化合物46 50 65 69 111 112 116 117は、広範な疾患の発症を示した未治療のチェックと比較した場合、これらのテストで最低70%のコントロールを示した。

【0526】

例5: *Corynespora cassicola* (トマト/大豆の葉の斑点) :

【0527】

化合物を0.3%ジメチルスルホキシドに溶解し、ペトリ皿に分注する直前にジャガイモデキストロース寒天培地に添加した。所望の濃度の化合物を含む5mLの培地を60mmの滅菌ペトリ皿に分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している毒性のある培養プレートの周囲から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを25°Cの温度と70%の相対湿度の成長チャンバー内で7日間インキュベートした後、放射状の成長を測定し、未処理のコントロールの成長と比較した。化合物18 50 100 111 117 300ppmでは、広範な疾患の発症を示した未治療のチェックと比較した場合、これらのテ

ストで最低70%のコントロールを示した。

【0528】

例7：Fusarium culmorum（穀物の腐敗）：

【0529】

化合物を0.3%ジメチルスルホキシドに溶解し、ペトリ皿に分注する直前にジャガイモデキストロス寒天培地に添加した。所望の濃度の化合物を含む5mLの培地を60mmの滅菌ペトリ皿に分注した。固化後、各プレートに、活発に成長している毒性のある培養プレートの周囲から採取した5mmサイズの菌糸体ディスクを播種した。プレートを25°Cの温度と60%の相対湿度の成長チャンパー内で7日間インキュベートした後、放射状の成長を測定し、未処理のコントロールの成長と比較した。300 ppmの化合物116 117は、広範な疾患の発症を示した未治療のチェックと比較した場合、これらのテストで最低70%のコントロールを示した。

10

【0530】

例8：大豆のPhakopsorapachyrhiziテスト

【0531】

化合物を2%ジメチルスルホキシド/アセトンに溶解し、乳化剤を含む水と混合して、校正されたスプレー量を50mLにした。この50mLのスプレー溶液は、さらなる用途のためにスプレーボトルに注がれた。

【0532】

化合物の予防活性をテストするために、温室で育てられた健康な若い大豆植物に、中空コーンノズルを使用してスプレーキャビネット内で指定された適用率で活性化化合物調製物を噴霧した。処理の1日後、植物に 2×10^5 Phakopsora pachyrhizi conidia分生子を含む孢子懸濁液を接種した。次に、接種された植物は、病気の発現のために、22~24の温度及び80~90%の相対湿度の温室チャンパー内に保持された。

20

【0533】

化合物の性能の視覚的評価は、適用後3、7、10、及び15日で処理された植物の病気の重症度（0-100%スケール）を評価することによって実行された。化合物の有効性（%コントロール）は、治療中の疾患評価を未治療の対照のものと比較することによって計算された。噴霧された植物はまた、壊死、白化及び発育阻害などの症状を記録することにより、植物の適合性について評価された。500 ppmの化合物1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 38 40 41 42 43 44 45 46 47 48 57 58 59 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 75 76 77 78 79 82 83 85 87 88 89 90 93 94 99 100 101 103 104 105 106 107 109 110 111 112 116 120 121 122 126 127 129 130 150 164 165 166は、広範な病気の発症を示した未処理のチェックと比較した場合、これらのテストで最低70%のコントロールを示した。

30

【0534】

特定の好ましい態様を参照して本発明を説明してきたが、他の態様は、明細書を検討することにより当業者に明らかになるであろう。本発明の範囲から逸脱することなく、材料及び方法の両方に対する多くの修正を実施できることは当業者には明らかであろう。

40

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/IB2020/053296

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D471/04 A01N43/90 ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D A01N		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,P	WO 2019/155066 A1 (BAYER AG [DE]) 15 August 2019 (2019-08-15) claims 1,3,11,12; examples 1-036 -----	1-19
X	WO 2017/222950 A1 (MERCK SHARP & DOHME [US]; WALJI ABBAS [US] ET AL.) 28 December 2017 (2017-12-28) page 6, line 22 - page 7, line 13; example 35 -----	1-3
X	EP 2 003 132 A1 (ASTELLAS PHARMA INC [JP]) 17 December 2008 (2008-12-17) tables 3,4 -----	18
X	WO 2009/055418 A1 (SMITHKLINE BEECHAM CORP [US]; ADAMS NICHOLAS D [US] ET AL.) 30 April 2009 (2009-04-30) example 45c -----	18
	-/--	
<input checked="" 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 29 July 2020		Date of mailing of the international search report 06/08/2020
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 Johnson, Claire

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/1B2020/053296

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 1 382 603 A1 (EISAI CO LTD [JP]) 21 January 2004 (2004-01-21) production example 244; paragraph [0674] -----	18
Y	WO 2011/057145 A2 (UNIV NOTRE DAME DU LAC [US]; DOW AGROSCIENCES LLC [US] ET AL.) 12 May 2011 (2011-05-12) Schemes 1, 2; paragraph [0060]; claim 1 paragraph [0062] paragraph [0017] paragraph [0110] -----	4-17,19
Y	WO 2018/202491 A1 (BASF SE [DE]) 8 November 2018 (2018-11-08) cited in the application page 87 - page 89; claims 1,13 -----	4-17,19

10

20

30

40

50

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/IB2020/053296

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2019155066 A1	15-08-2019	TW 201936589 A	16-09-2019
		UY 38084 A	30-08-2019
		WO 2019155066 A1	15-08-2019

WO 2017222950 A1	28-12-2017	NONE	

EP 2003132 A1	17-12-2008	AU 2007236707 A1	18-10-2007
		BR P10709866 A2	26-07-2011
		CA 2648303 A1	18-10-2007
		EP 2003132 A1	17-12-2008
		ES 2453372 T3	07-04-2014
		JP 5099005 B2	12-12-2012
		JP WO2007116866 A1	20-08-2009
		KR 20090007740 A	20-01-2009
		MX 356221 B	18-05-2018
		NO 342171 B1	09-04-2018
		PL 2003132 T3	31-10-2014
		PT 2003132 E	26-05-2014
		TW 200815423 A	01-04-2008
		US 2009076070 A1	19-03-2009
US 2010168159 A1	01-07-2010		
WO 2007116866 A1	18-10-2007		

WO 2009055418 A1	30-04-2009	EP 2211615 A1	04-08-2010
		JP 2011500823 A	06-01-2011
		US 2010311736 A1	09-12-2010
		WO 2009055418 A1	30-04-2009

EP 1382603 A1	21-01-2004	AT 402164 T	15-08-2008
		EP 1382603 A1	21-01-2004
		EP 2048142 A2	15-04-2009
		ES 2310202 T3	01-01-2009
		JP 4310109 B2	05-08-2009
		JP WO2002088107 A1	19-08-2004
		US 7074801 B1	11-07-2006
WO 02088107 A1	07-11-2002		

WO 2011057145 A2	12-05-2011	CN 102762556 A	31-10-2012
		CN 106866667 A	20-06-2017
		CN 110483499 A	22-11-2019
		EP 2496578 A2	12-09-2012
		EP 3257854 A1	20-12-2017
		HK 1248676 A1	19-10-2018
		IL 219564 A	31-01-2017
		RU 2012122653 A	10-12-2013
		US 2012220457 A1	30-08-2012
		US 2016318925 A1	03-11-2016
		US 2018354944 A1	13-12-2018
		WO 2011057145 A2	12-05-2011
		ZA 201204028 B	27-11-2013

WO 2018202491 A1	08-11-2018	AR 111850 A1	28-08-2019
		WO 2018202491 A1	08-11-2018

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (April 2005)

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

A 0 1 N	47/02 (2006.01)	A 0 1 N	53/14
A 6 1 P	31/04 (2006.01)	A 0 1 N	47/02
A 6 1 K	31/437(2006.01)	A 6 1 P	31/04
A 6 1 K	31/444(2006.01)	A 6 1 K	31/437
A 6 1 K	31/5377(2006.01)	A 6 1 K	31/444
A 0 1 G	7/06 (2006.01)	A 6 1 K	31/5377
		A 0 1 G	7/06

A

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,N
E,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,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JO,JP,KE,K
G,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,N
I,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,
TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

カルナータカ, ハヌマン ナガー, バンダー ロード シックス ス クロス

(72)発明者

テンブヘア ニティン ラメシュ

インド共和国 4 4 1 9 1 1 ゴンディア - マハーラーシュトラ, テシル - ティロラ, ピーオー - タ
ネガアン, エーティー - メンドハ

(72)発明者

アウトカール サントーシュ シュリダール

インド共和国 4 4 4 3 0 2 アコラ - マハーラーシュトラ, タルカ バラブル, エーティー ポスト
ビアラ

(72)発明者

ガーグ ルチ

インド共和国 2 2 1 0 1 0 ワーラーナシー - ユーピー, マームアガンジ, トゥルシプル, ピー
3 8 / 4 7 シー - 1 - ケー

(72)発明者

ガーデ ヴィシュワナート

インド共和国 4 0 0 6 0 1 ターナー ウエスト - マハーラーシュトラ, ナシク ロード, マジワ
ダ, ラスタムジー アッジャーノ, ジェイ ウィング, フラット ナンバー 2 5 0 4

(72)発明者

クラウゼナー アレクサンダー ジー . エム .

ドイツ連邦共和国 5 0 2 5 9 プルハイム, シフゲスウェグ 1 8

(72)発明者

ラーマクリシュナ ビサンナガリ

インド共和国 5 0 9 2 1 6 ランガレッディ - テランガーナ, マンダール - ケスハンペット, ビレ
ッジ - パピレディグーダ

(72)発明者

スワルンカール ソナリー

インド共和国 カパサン - ラージャスターン, ダマーナ ロード, ニアー カイラス トーキーズ

(72)発明者

ワググメア ヴィノード スニール

インド共和国 4 1 3 1 1 4 プネー - マハーラーシュトラ, タル - インドラプル, ピーオー - ワ
ールチャンドナガー, エーティー - ナーヴダール

F ターム (参考)

2B022 AA01 EA10

4C065 AA01 AA03 BB05 CC01 DD02 EE02 HH05 HH10 JJ01 KK03

KK08 LL01 PP12 PP16 QQ05

4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 CB05 MA01 MA04 NA05 NA14 ZB35

4H011 AA01 BB09 BB11 BB15 DD03