

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7399589号
(P7399589)

(45)発行日 令和5年12月18日(2023.12.18)

(24)登録日 令和5年12月8日(2023.12.8)

(51)国際特許分類

F I

A 0 1 N	43/40	(2006.01)	A 0 1 N	43/40	1 0 1 J
A 0 1 C	1/06	(2006.01)	A 0 1 C	1/06	Z
A 0 1 N	43/54	(2006.01)	A 0 1 N	43/54	A
A 0 1 N	43/56	(2006.01)	A 0 1 N	43/56	D
A 0 1 N	43/647	(2006.01)	A 0 1 N	43/647	

請求項の数 28 (全116頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願2020-546030(P2020-546030)
 (86)(22)出願日 令和1年9月10日(2019.9.10)
 (86)国際出願番号 PCT/JP2019/035533
 (87)国際公開番号 WO2020/054712
 (87)国際公開日 令和2年3月19日(2020.3.19)
 審査請求日 令和4年2月21日(2022.2.21)
 (31)優先権主張番号 特願2018-170273(P2018-170273)
 (32)優先日 平成30年9月12日(2018.9.12)
 (33)優先権主張国・地域又は機関
 日本国(JP)
 前置審査

(73)特許権者 000004086
 日本化薬株式会社
 東京都千代田区丸の内二丁目1番1号
 (72)発明者 長谷川 慎二
 日本国茨城県神栖市砂山6番地 日本化
 薬株式会社 アグロ研究所内
 (72)発明者 上野 翔太郎
 日本国茨城県神栖市砂山6番地 日本化
 薬株式会社 アグロ研究所内
 (72)発明者 新子 大樹
 日本国茨城県神栖市砂山6番地 日本化
 薬株式会社 アグロ研究所内
 (72)発明者 小林 武
 日本国茨城県神栖市砂山6番地 日本化
 薬株式会社 アグロ研究所内
 最終頁に続く

(54)【発明の名称】 有害生物防除剤

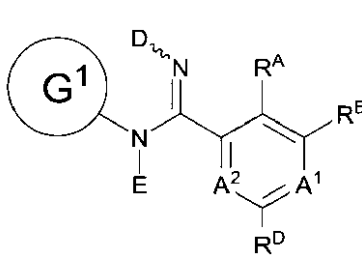
(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】

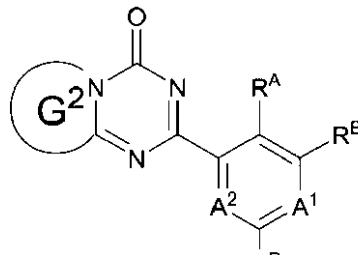
式(1)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシドを有効成分として含有する有害生物防除剤。

[式(1)及び式(3)中、

【化1】



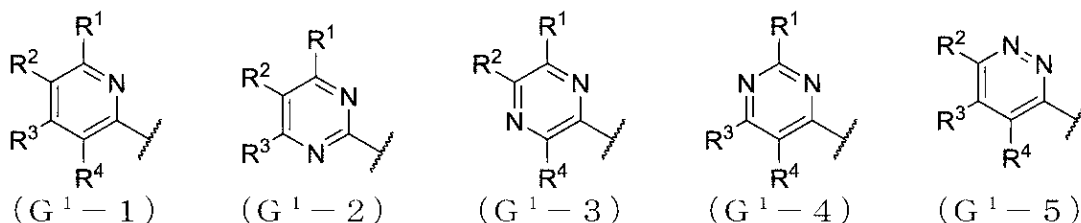
(1)



(3)

G¹は、(G¹-1)、(G¹-2)、(G¹-3)、(G¹-4)又は(G¹-5)で表される構造を表し、

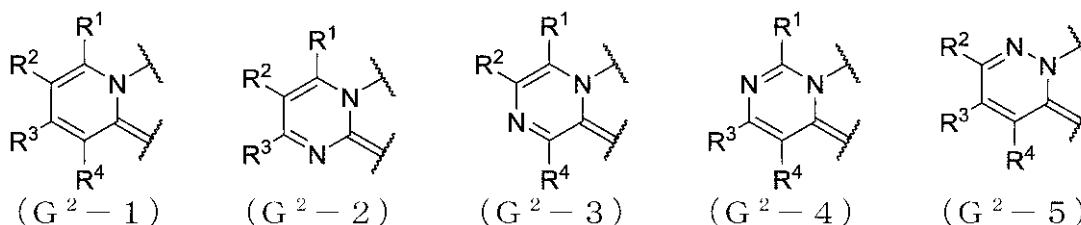
【化 2】



G²は、(G²-1)、(G²-2)、(G²-3)、(G²-4)又は(G²-5)で表される構造を表し、

10

【化 3】



R¹、R²、R³及びR⁴は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、(C=O)NY¹Y²又は-NY¹Y²を表し、

20

A¹は、C-R^C又はNを表し、

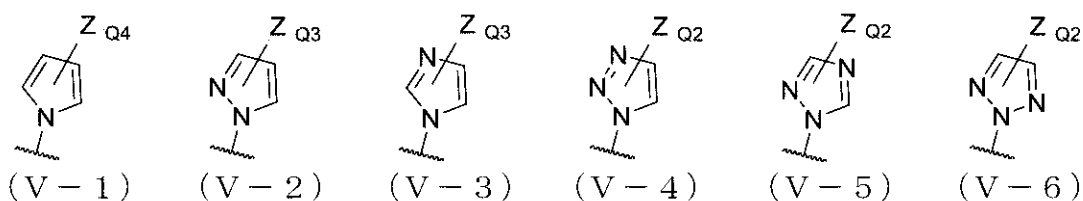
A²は、C-R^E又はNを表し、(ここで、A¹、A²のどちらか一方はNであり、もう一方はC-R^C又はC-R^Eである。)

R^A、R^B、R^C、R^D及びR^Eは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、Uによって置換された(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、5個までのZで置換されても良いフェノキシ基、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、(C=O)NY³Y⁴、-NY³Y⁴、シアノ、ニトロ、5個までのZで置換されても良いフェニル基、4個までのZで置換されても良いピリジル基、3個までのZで置換されても良いピリミジル基、3個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3個までのZで置換されても良いピリダジル基、3個までのZで置換されても良いチエニル基、3個までのZで置換されても良いフラニル基又はVを表し、

30

Vは、(V-1)、(V-2)、(V-3)、(V-4)、(V-5)又は(V-6)で表される構造を表し、

【化 4】



40

Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキル

50

スルホニル、 $-NY^5Y^6$ 、シアノ又はニトロを表し、

Q2、Q3又はQ4はZの置換基数を示し、

Q2は、0、1又は2の整数を表し、

Q3は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q4は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q2、Q3又はQ4が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

Uは、シアノ、 $-C(O)OH$ 又は $-C(O)NH_2$ を表し、

Dは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルオキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルオキシカルボニル、5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

Tは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルコキシを表し、

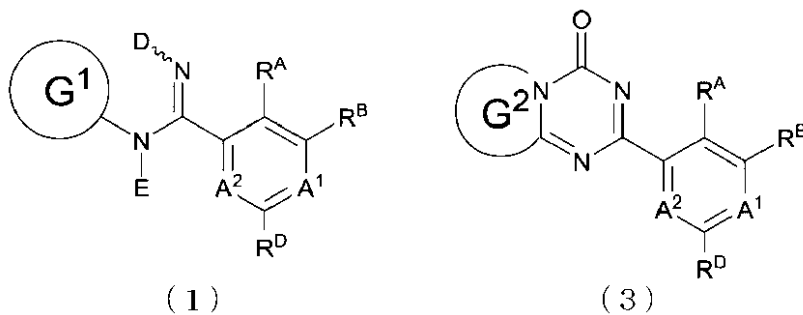
Eは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

【請求項2】

式(1)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキドを有効成分として含有する有害生物防除剤。

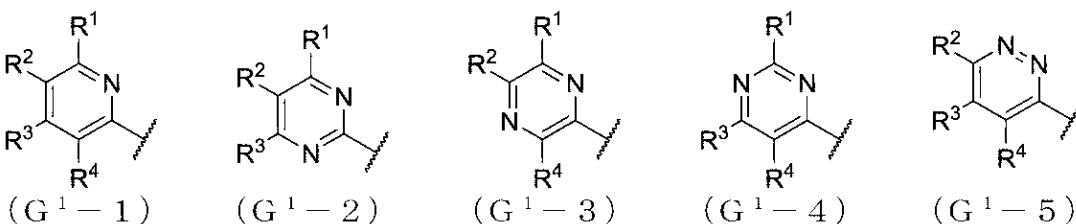
[式(1)及び式(3)中、

【化5】



G^1 は、(G^1-1)、(G^1-2)、(G^1-3)、(G^1-4)又は(G^1-5)で表される構造を表し、

【化6】



G^2 は、(G^2-1)、(G^2-2)、(G^2-3)、(G^2-4)又は(G^2-5)で表される構造を表し、

10

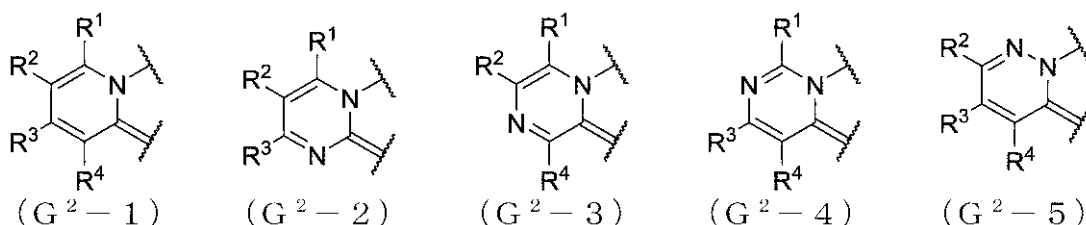
20

30

40

50

【化 7】



R¹、R²、R³及びR⁴は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル又はハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニルを表し、

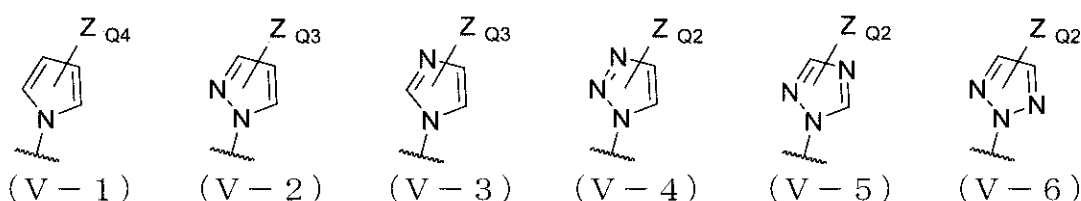
A¹は、C-R^C又はNを表し、

A²は、C-R^E又はNを表し、(ここで、A¹、A²のどちらか一方はNであり、もう一方はC-R^C又はC-R^Eである。)

R^A、R^B、R^C、R^D及びR^Eは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、Uによって置換された(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY³Y⁴、シアノ、ニトロ又はVを表し、

Vは、(V-1)、(V-2)、(V-3)、(V-4)、(V-5)又は(V-6)で表される構造を表し、

【化 8】



Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY⁵Y⁶、シアノ又はニトロを表し、

Q₂、Q₃又はQ₄はZの置換基数を示し、

Q₂は、0、1又は2の整数を表し、

Q₃は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q₂、Q₃又はQ₄が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y³、Y⁴、Y⁵、Y⁶は、各々独立して、水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル又はハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニルを表し、

Uは、複数ある場合には各々独立して、シアノ、-C(O)OH又は-C(O)NH₂を表し、

Dは水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハ

10

20

30

40

50

口 (C₁ ~ C₆) アルキルスルホニルを表し、

E は水素原子、C₁ ~ C₆ アルキル、ハ口 (C₁ ~ C₆) アルキル、C₁ ~ C₆ アルキルカルボニル、ハ口 (C₁ ~ C₆) アルキルカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル、ハ口 (C₁ ~ C₆) アルキルスルホニルを表す。]

【請求項 3】

有効成分が式 (1) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

【請求項 4】

有効成分が式 (1) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

10

【請求項 5】

有効成分が式 (1) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、G¹ が (G¹ - 1) であり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

【請求項 6】

有効成分が式 (1) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、G¹ が (G¹ - 1) であり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

【請求項 7】

有効成分が式 (3) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

20

【請求項 8】

有効成分が式 (3) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

【請求項 9】

有効成分が式 (3) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、G² が (G² - 1) であり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

【請求項 10】

有効成分が式 (3) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドであり、G² が (G² - 1) であり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である、請求項 1 に記載の有害生物防除剤。

30

【請求項 11】

界面活性剤、固体担体及び液体担体からなる群から選択される少なくとも 1 つの成分を含む、請求項 1 ~ 10 の何れか一項に記載の有害生物防除剤。

【請求項 12】

少なくとも 1 つの他の有害生物防除化合物または薬剤をさらに含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の有害生物防除剤。

【請求項 13】

前記の少なくとも 1 つの有害生物防除化合物または薬剤が、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、メトルカルブ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、エチルチオメトン、クロルエトキシホス、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフエンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、クマホス、シアノホス、デメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミ

40

50

フール、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホ
 ス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル = O - (メトキシアミノチオホスホリ
 ルサリチレート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオ
 ン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンエチル、パラ
 チオン、パラチオン - メチル、P A P、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミド
 ン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロペタンホス、プロチオホス、
 ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリミホス、テメ
 ホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン
 、バミドチオン、クロルピリホス - エチル、ジスルフオトン、スルプロホス、フルピラゾ
 ホス、フェントエート、ホノホス、トリブホス、エンドスルフアン、アルファ - エンドス
 ルファン、ガンマ - H C H、ジコホル、クロルデン、ディルドリン、メトキシクロル、ア
 セトプロール、フィプロニル、エチプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、フルフ
 ィプロール、プロフラニリド、アフォキソラネル、フルララネル、サロラネル、フルキサ
 メタミド、ロティラネル、イソシクロシラム、アクリナトリン、アレスリン、d - c i s
 - t r a n s アレスリン、d - t r a n s アレスリン、ピフェントリン、カップ - ピフェ
 ントリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン
 、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ
 - シハロトリン、シペルメトリン、アルファ - シペルメトリン、ベータ - シペルメトリン
 、シータ - シペルメトリン、ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン
 、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンブロックス、フェンプロパトリン
 、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフ
 ェンブロックス、イミプロトリン、カデスリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレト
 リン、プレトリン、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、カップ - テフルト
 リン、フタルスリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、メトキサ
 ジアゾン、メトフルトリン、プロフルトリン、プレトラム、テラレトリン、モンフルオロ
 スリン、ヘプタフルトリン、メペルフルスリン、テトラメチルフルスリン、ジメフルトリ
 ン、クロロパラレスリン、イブシロン - メトフルスリン、イブシロン - モンフルオスリン
 、プロトリフェンブト、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクプロ
 リド、ニテンピラム、チアクロブリド、チアメトキサム、スルホキサフル、フルピラジ
 フロン、トリフルメゾピリム、ジクロロメゾチアズ、フルピリミン、スピノサド、スピネ
 トラム、アバメクチン、イベルメクチン、エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レ
 ピメクチン、ヒドロブレン、キノブレン、ジオフェノラン、メトブレン、ピリプロキシフ
 ェン、ピメトロジン、フロニカミド、エトキサゾール、ジアフェンチウロン、アゾシクロ
 チン、シヘキサチン、酸化フェンブタスズ、プロパルギット、テトラジホン、クロルフェ
 ナピル、トラロピリル、D N O C、ベンスルタップ、カルタップ、チオシクラム、チオス
 ルタップ、チオスルタップ - ナトリウム、ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフ
 ルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌ
 ロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ピストリフル
 ロン、ブプロフェジン、シロマジン、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェ
 ノジド、テブフェノジド、アミトラズ、ヒドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピ
 リム、ピリミノストロピン、フルフェノキシストロピン、フェナザキン、フェンピロキシ
 メート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、ピフルブ
 ミド、メタフルミゾン、スピロジクロフェン、スピロテトラマト、スピロメシフェン、ス
 ピロピディオ、シフルメトフェン、シエノピラフェン、フルベンジアミド、クロラント
 ラニリプロール、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、テトラニリプロール、
 シハロジアミド、テトラクロラントラニリプロール、キノメチオネート、ヘキシチアゾク
 ス、ピフェナゼート、フルフェネリム、ピリフルキナゾン、フロメトキン、フルオピラム
 、フルアザインドリジン、アミドフルメト、チクロピラゾフル、チオキサザフェン、オ
 キサゾスルフィル、

10

20

30

40

ニコチン、クロロピクリン、フッ化スルフルル、クリロチエ、クロフェンテジン、ジフ

50

ロビダジン、ロテノン、インドキサカルブ、ピペロニルブトキシド、クロルジメホルム、ピリダリル、アザジラクチン、ベンゾキシメート、アフィドピロペン、フルヘキサホン、フルエンシルホン、ベンクロチアズ、カルゾール、殺虫性石鹸、ジメヒポ、ニチアジン、ホウ酸塩、メタルデヒド、リアノジン、スルフラミド、アシノナピル、ベンズピリモキサン、3-プロモ-N-(2,4-ジクロロ-6-(メチルカルバモイル)フェニルイル)-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、

メタラキシル、メタラキシル-M、オキサジキシル、オフラセ、ベナラキシル、ベナラキシル-M、キララキシル、オフラス、フララキシル、シプロフラン、ププリメート、ジメチリモール、エチリモール、ヒメキサゾール、ヒドロキシイソキサゾール、オキサチアピプロリン、オクチリノン、オキサソリニック酸、ベノミル、チオファネートメチル、カーベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、デバカルブ、ジエトフェンカルブ、ゾキサミド、エタボキサム、ペンシクロン、フルオピコリド、フルオピモミド、ジフルメトリム、ププリメート、ベノダニル、フルトラニル、メプロニル、イソフェタミド、フェンフラム、オキシカルボキシン、カルボキシン、チフルザミド、フルキサピロキサド、フラメトピル、ペンフルフェン、ペンチオピラド、ベンゾビンジフルピル、ピキサフェン、イソピラザム、セダキサン、インピルフルキサム、フルインダビル、イソフルシブラム、ピラプロポイン、ボスカリド、アゾキシストロピン、コウメトキシストロピン、クレソキシムメチル、トリフロキシストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン、オリサストロピン、フルオキサストロピン、ピラオキシストロピン、ピラメトストロピン、フルフェノキシストロピン、フェナミンストロピン、エノキサストロピン、クモキシストロピン、マンデストロピン、トリクロピリカルブ、ファモキサドン、フェンアミドン、トリクロピリカルブ、ピリベンカルブ、シアゾファミド、アミスルプロム、ピナバクリル、メプチルジノカルブ、ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン、酢酸-フェンチン、塩化フェンチン、水酸化フェンチン、水酸化トリフェニルスズ、酢酸トリフェニルスズ、オキシ銅、シルチオファミン、アメトクトラジン、メパニピリム、ニトラピリン、ピリメサニル、シプロジニル、ブラストサイジンS、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン、キノキシフェン、プロキナジド、フルジオキソニル、フェンピクロニル、フルオロイミド、プロシミドン、イプロジオン、ピンクロゾリン、エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、ゴセイカユブテ抽出物、トリホリン、ピリフェノックス、ピリソキサゾール、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、プロムコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール-M、エボキシコナゾール、フルキンコナゾール、オキスポコナゾール、ペフラゾエート、ジフェノコナゾール、フェンブコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、イマザリル、ピテルタノール、トリフルミゾール、エタコナゾール、プロピコナゾール、ペンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホル、ミクロブタニル、パクロブトラゾール、プロチオコナゾール、シプロコナゾール、テブコナゾール、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、シメコナゾール、イプフェントリフルコナゾール、アルジモルフ、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ、ピペラリン、フェンプロピディン、スピロキサミン、フェンヘキサミド、フェンピラザミン、フェルバム、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、チラム、マンゼブ、マンネブ、ジネブ、ジラム、ポリカーバメート、プロビネブ、チウラム、ピリブチカルブ、バリダマイシン、ミルジオマイシン、ポリオキシ、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブイソプロピル、バリフェナレート、イプロバリカルブ、マンジプロパミド、フェンピコキサミド、フロリルピコキサミド、フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、アシベンゾラル-S-メチル、プロベナゾール、ジクロベンチアゾクス、チアジニル、イソチアニル、シモキサニル、ホセチル、テクロフタラム、トリアゾキシド、フルスルファミド、ジクロメジン

10

20

30

40

50

、シフルフェナミド、メトラフェノン、ピリオフェノン、フルチアニル、テブフロキン、イプフルフェノキン、ホセチルアルミニウム、トルクロホス - メチル、エクロメゾール、トルプロカルブ、メフェントリフルコナゾール、キノフメリン、ピジフルメトフェン、ボルドー混合液、酢酸銅、塩基性硫酸銅、オキシ塩化銅、水酸化第二銅、オキシキノリン銅、銅、硫黄、キャプタン、カプタホール、フォルペット、アニラジン、クロロタロニル、ジクロロフェン、ペンタクロロフェノール及びその塩、ヘキサクロロベンゼン、キントゼン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、アルベシレート、ジチアノン、フルオルイミド、トリルフルアニド、ジクロフルアニド、ジノプトン、ダゾメット、ピラジフルミド、アミノピリフェン、メチルテトラプロール、ピリダクロメチル、

10

ジピメチトロン、ピカルブトラゾクス、テクナゼン、ニトルタール - イソプロピル、ジシクロメット、アシベンゾラル、プロヘキサジオン - カルシウム、プロノポール、ジフェニルアミン、フルメトベル、ベントキサジン、ピフェニル、クロロネブ、CNA、ヨードカルブ、プロチオカルブ、並びに

Bacillus 属、及びそれらにより産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、Bt 作物により産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、昆虫病原性バクテリア、昆虫病原性ウイルスおよび昆虫病原性菌類、からなる群から選択される、請求項 1 2 に記載の有害生物防除剤。

【請求項 1 4】

前記有害生物が動物寄生性害虫であり、動物又は鳥類に投与される請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の有害生物防除剤。

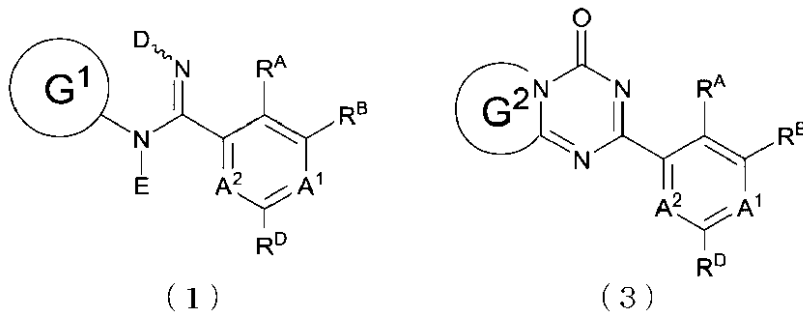
20

【請求項 1 5】

有害生物またはその環境に式 (1) 又は式 (3) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドを有害生物に接触させる、有害生物を防除する方法 (但し、人を治療する方法を除く) 。

[式 (1) 及び式 (3) 中、

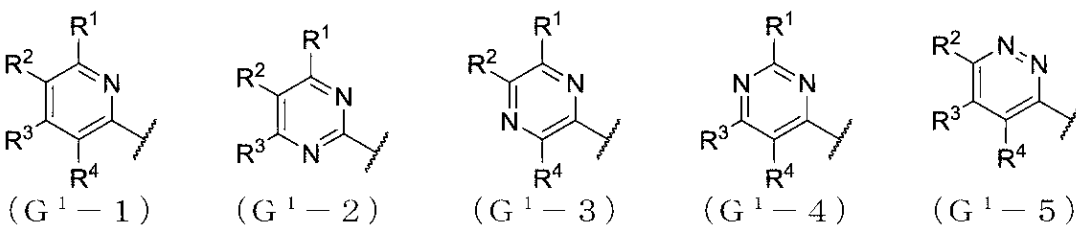
【化 9】



30

G¹ は、(G¹ - 1)、(G¹ - 2)、(G¹ - 3)、(G¹ - 4) 又は (G¹ - 5) で表される構造を表し、

【化 1 0】

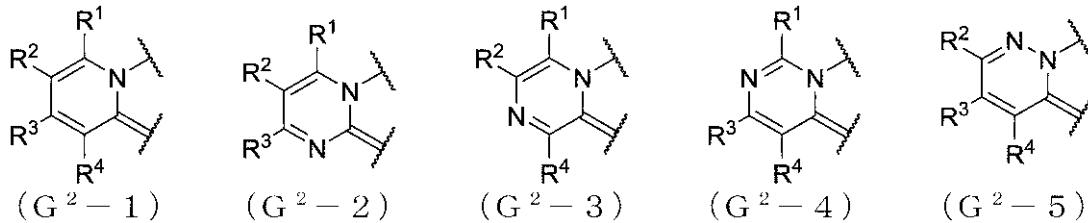


40

G² は、(G² - 1)、(G² - 2)、(G² - 3)、(G² - 4) 又は (G² - 5) で表される構造を表し、

50

【化11】



R¹、R²、R³及びR⁴は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、(C=O)NY¹Y²又は-NY¹Y²を表し、

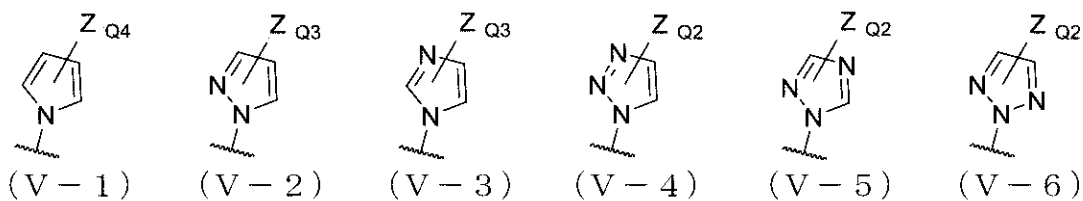
A¹は、C-R^C又はNを表し、

A²は、C-R^E又はNを表し、(ここで、A¹、A²のどちらか一方はNであり、もう一方はC-R^C又はC-R^Eである。)

R^A、R^B、R^C、R^D及びR^Eは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、Uによって置換された(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、5個までのZで置換されても良いフェノキシ基、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、(C=O)NY³Y⁴、-NY³Y⁴、シアノ、ニトロ、5個までのZで置換されても良いフェニル基、4個までのZで置換されても良いピリジル基、3個までのZで置換されても良いピリミジル基、3個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3個までのZで置換されても良いピリダジル基、3個までのZで置換されても良いチエニル基、3個までのZで置換されても良いフラニル基又はVを表し、

Vは、(V-1)、(V-2)、(V-3)、(V-4)、(V-5)又は(V-6)で表される構造を表し、

【化12】



Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY⁵Y⁶、シアノ又はニトロを表し、

Q₂、Q₃又はQ₄はZの置換基数を示し、

Q₂は、0、1又は2の整数を表し、

Q₃は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q₂、Q₃又はQ₄が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y¹、Y²、Y³、Y⁴、Y⁵、Y⁶は、各々独立して、水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルコキシカルボ

10

20

30

40

50

ニル、C₁ ~ C₆アルキルスルホニル又は八口(C₁ ~ C₆)アルキルスルホニルを表し、
Uは、シアノ、-C(O)OH又は-C(O)NH₂を表し、

Dは水素原子、C₁ ~ C₆アルキル、八口(C₁ ~ C₆)アルキル、C₁ ~ C₆アルキルカルボニル、C₃ ~ C₆シクロアルキルカルボニル、八口(C₁ ~ C₆)アルキルカルボニル、C₁ ~ C₆アルキルスルホニル、八口(C₁ ~ C₆)アルキルスルホニル、C₁ ~ C₃アルキルオキシカルボニル、八口(C₁ ~ C₃)アルキルオキシカルボニル、5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

Tは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁ ~ C₃アルキル、八口(C₁ ~ C₃)アルキル、C₁ ~ C₃アルコキシ、八口(C₁ ~ C₃)アルコキシを表し、

Eは水素原子、C₁ ~ C₆アルキル、シクロプロピルメチル、八口(C₁ ~ C₆)アルキル、C₁ ~ C₆アルキルカルボニル、C₃ ~ C₆シクロアルキルカルボニル、八口(C₁ ~ C₆)アルキルカルボニル、C₁ ~ C₆アルキルスルホニル、八口(C₁ ~ C₆)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

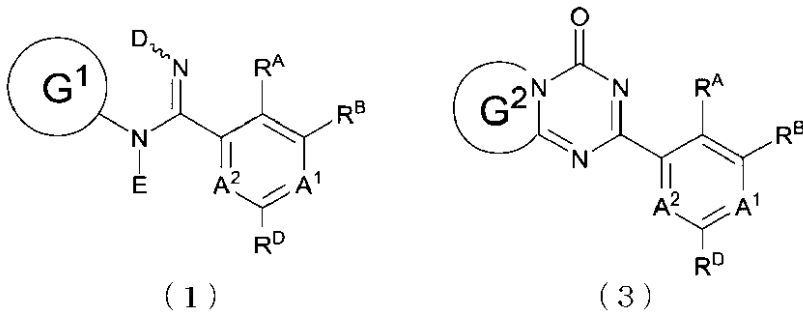
10

【請求項16】

作物の活力を高める方法であって、作物又は作物の種子に式(1)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシドを接触させる、前記方法。

[式(1)及び式(3)中、

【化13】

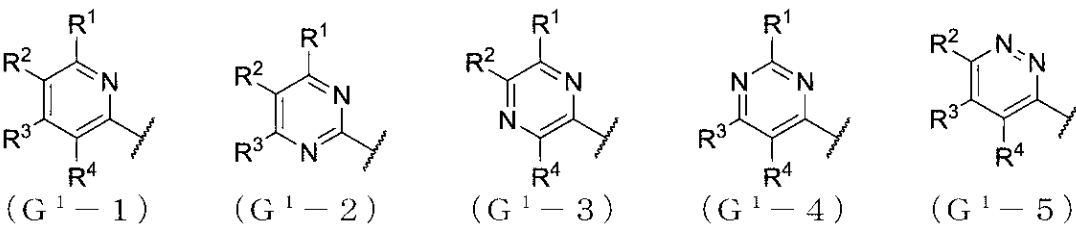


20

G¹は、(G¹-1)、(G¹-2)、(G¹-3)、(G¹-4)又は(G¹-5)で表される構造を表し、

30

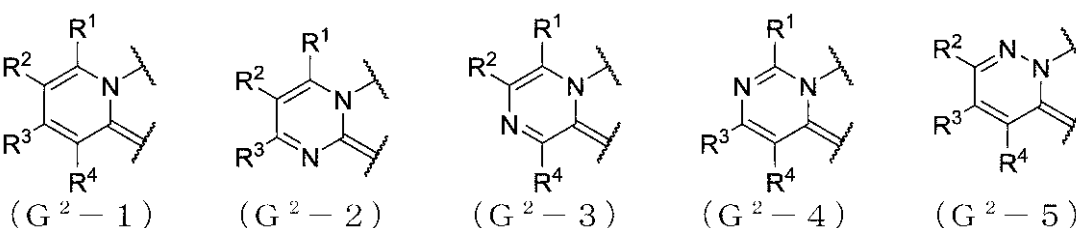
【化14】



G²は、(G²-1)、(G²-2)、(G²-3)、(G²-4)又は(G²-5)で表される構造を表し、

40

【化15】



R¹、R²、R³及びR⁴は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁ ~ C₆アルキル、八口(C₁ ~ C₆)アルキル、C₁ ~ C₆アルコキシ、八口(C₁ ~ C₆)アルコキ

50

シ、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルチオ、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルフィニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニル、($C=O$) NY^1Y^2 又は $-NY^1Y^2$ を表し、

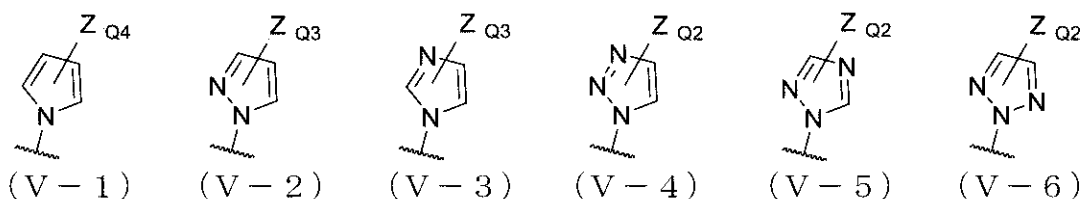
A^1 は、 $C-R^C$ 又は N を表し、

A^2 は、 $C-R^E$ 又は N を表し、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方は N であり、もう一方は $C-R^C$ 又は $C-R^E$ である。)

R^A 、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 U によって置換された ($C_3 \sim C_6$) シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、5 個までの Z で置換されても良いフェノキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニル、($C=O$) NY^3Y^4 、 $-NY^3Y^4$ 、シアノ、ニトロ、5 個までの Z で置換されても良いフェニル基、4 個までの Z で置換されても良いピリジル基、3 個までの Z で置換されても良いピリミジル基、3 個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3 個までの Z で置換されても良いピリダジル基、3 個までの Z で置換されても良いチエニル基、3 個までの Z で置換されても良いフラニル基又は V を表し、

V は、($V-1$)、($V-2$)、($V-3$)、($V-4$)、($V-5$) 又は ($V-6$) で表される構造を表し、

【化 16】



Z は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニル、 $-NY^5Y^6$ 、シアノ又はニトロを表し、

Q_2 、 Q_3 又は Q_4 は Z の置換基数を示し、

Q_2 は、0、1 又は 2 の整数を表し、

Q_3 は、0、1、2 又は 3 の整数を表し、

Q_4 は、0、1、2、3 又は 4 の整数を表し、

Q_2 、 Q_3 又は Q_4 が 2 以上の整数を表す場合には、複数の Z は互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又は八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニルを表し、

U は、シアノ、 $-C(O)OH$ 又は $-C(O)NH_2$ を表し、

D は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルオキシカルボニル、八口 ($C_1 \sim C_3$) アルキルオキシカルボニル、5 個までの T で置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

T は各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、八口 ($C_1 \sim C_3$) アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、八口 ($C_1 \sim C_3$) アルコキシを表し、

E は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シクロプロピルメチル、八口 ($C_1 \sim C_6$) アルキ

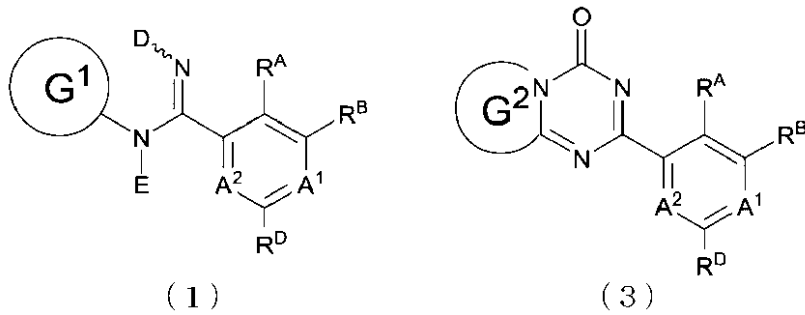
ル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

【請求項 17】

式 (1) 又は式 (3) で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドで処理された種子であって、処理後の種子全体の 0.0001 ~ 50 重量%の量の前記化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドを含む、前記種子。

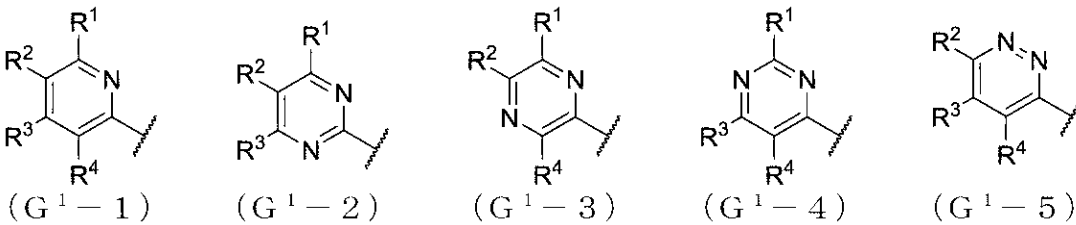
[式 (1) 及び式 (3) 中、

【化 17】



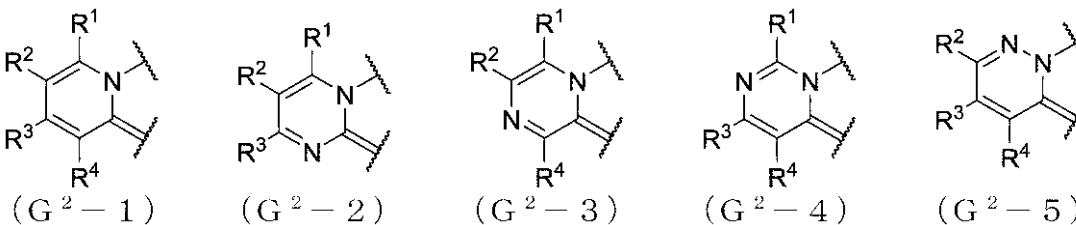
G^1 は、($G^1 - 1$)、($G^1 - 2$)、($G^1 - 3$)、($G^1 - 4$) 又は ($G^1 - 5$) で表される構造を表し、

【化 18】



G^2 は、($G^2 - 1$)、($G^2 - 2$)、($G^2 - 3$)、($G^2 - 4$) 又は ($G^2 - 5$) で表される構造を表し、

【化 19】



R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、($C=O$) NY^1Y^2 又は $-NY^1Y^2$ を表し、

A^1 は、 $C - R^C$ 又は N を表し、

A^2 は、 $C - R^E$ 又は N を表し、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方は N であり、もう一方は $C - R^C$ 又は $C - R^E$ である。)

R^A 、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 U によって置換された ($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、5個までの Z で置換されても良いフェノキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ ($C_1 \sim$

10

20

30

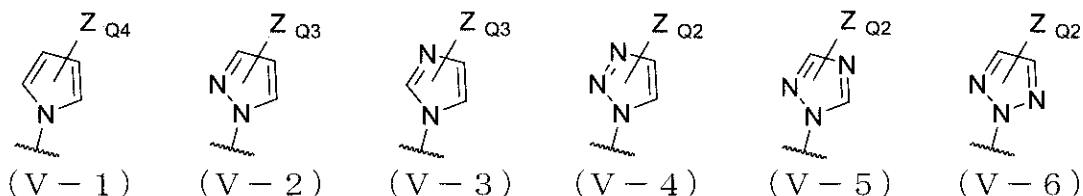
40

50

C₆) アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、(C=O)NY³Y⁴、-NY³Y⁴、シアノ、ニトロ、5個までのZで置換されても良いフェニル基、4個までのZで置換されても良いピリジル基、3個までのZで置換されても良いピリミジル基、3個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3個までのZで置換されても良いピリダジル基、3個までのZで置換されても良いチエニル基、3個までのZで置換されても良いフラニル基又はVを表し、

Vは、(V-1)、(V-2)、(V-3)、(V-4)、(V-5)又は(V-6)で表される構造を表し、

【化20】



Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY⁵Y⁶、シアノ又はニトロを表し、

Q₂、Q₃又はQ₄はZの置換基数を示し、

Q₂は、0、1又は2の整数を表し、

Q₃は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q₂、Q₃又はQ₄が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y¹、Y²、Y³、Y⁴、Y⁵、Y⁶は、各々独立して、水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル又はハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニルを表し、

Uは、シアノ、-C(O)OH又は-C(O)NH₂を表し、

Dは水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₃~C₆シクロアルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、C₁~C₃アルキルオキシカルボニル、ハロ(C₁~C₃)アルキルオキシカルボニル、5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

Tは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₃アルキル、ハロ(C₁~C₃)アルキル、C₁~C₃アルコキシ、ハロ(C₁~C₃)アルコキシを表し、

Eは水素原子、C₁~C₆アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₃~C₆シクロアルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

【請求項18】

式(1)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシドで作物の種子を処理する工程を含む、請求項17に記載の種子の製造方法であって、

処理後の種子が種子全体の0.0001~50重量%の量の前記化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシドを含む、

10

20

30

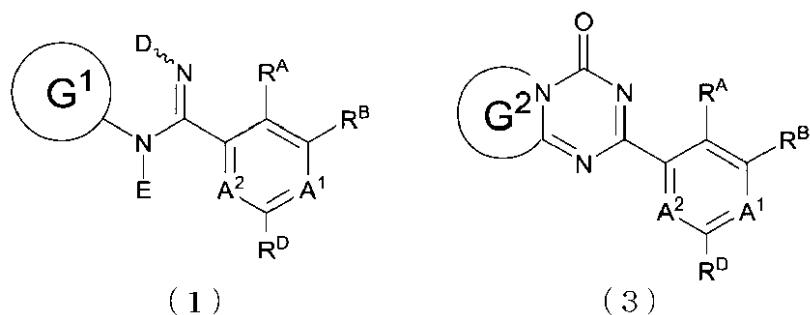
40

50

前記方法。

[式(1)及び式(3)中、

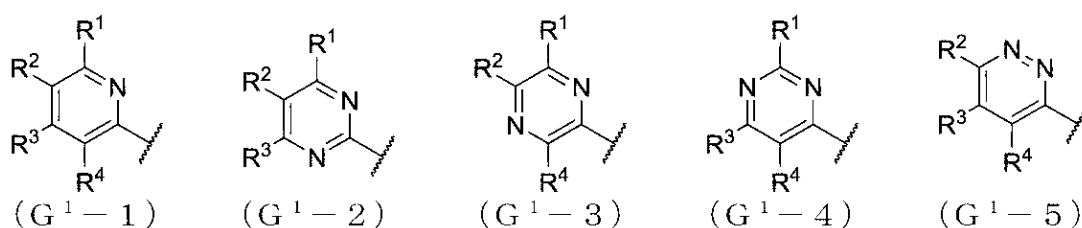
【化21】



10

G^1 は、($G^1 - 1$)、($G^1 - 2$)、($G^1 - 3$)、($G^1 - 4$)又は($G^1 - 5$)で表される構造を表し、

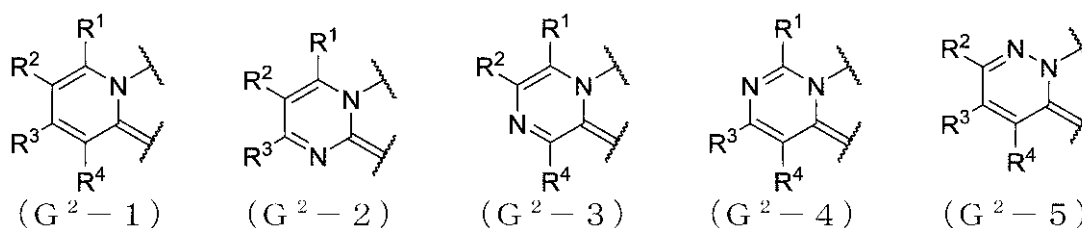
【化22】



20

G^2 は、($G^2 - 1$)、($G^2 - 2$)、($G^2 - 3$)、($G^2 - 4$)又は($G^2 - 5$)で表される構造を表し、

【化23】



30

R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、($C=O$) NY^1Y^2 又は $-NY^1Y^2$ を表し、

A^1 は、 $C-R^C$ 又はNを表し、

A^2 は、 $C-R^E$ 又はNを表し、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方はNであり、もう一方は $C-R^C$ 又は $C-R^E$ である。)

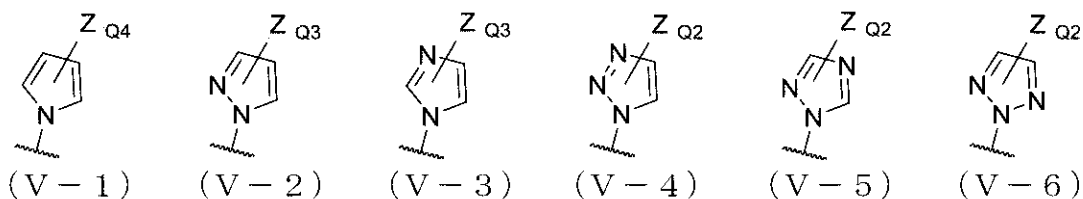
R^A 、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、Uによって置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、5個までのZで置換されても良いフェノキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、($C=O$) NY^3Y^4 、 $-NY^3Y^4$ 、シアノ、ニトロ、5個までのZで置換されても良いフェニル基、4個までのZで置換されても良いピリジル基、3個までのZで置換されても良いピリミジル基、3個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3個までのZで置換されても良いピリダジル基、3個までのZで置換されても良いチエニル基、3個までのZで置換されても良いフラニル基又はVを表し、

40

50

Vは、(V-1)、(V-2)、(V-3)、(V-4)、(V-5)又は(V-6)で表される構造を表し、

【化24】



10

Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY⁵Y⁶、シアノ又はニトロを表し、

Q₂、Q₃又はQ₄はZの置換基数を示し、

Q₂は、0、1又は2の整数を表し、

Q₃は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q₂、Q₃又はQ₄が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

20

Y¹、Y²、Y³、Y⁴、Y⁵、Y⁶は、各々独立して、水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルコキシカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルコキシカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル又はハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニルを表し、

Uは、シアノ、-C(O)OH又は-C(O)NH₂を表し、

Dは水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₃~C₆シクロアルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、C₁~C₃アルキルオキシカルボニル、ハロ(C₁~C₃)アルキルオキシカルボニル、5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

30

Tは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₃アルキル、ハロ(C₁~C₃)アルキル、C₁~C₃アルコキシ、ハロ(C₁~C₃)アルコキシを表し、

Eは水素原子、C₁~C₆アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルキルカルボニル、C₃~C₆シクロアルキルカルボニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルカルボニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

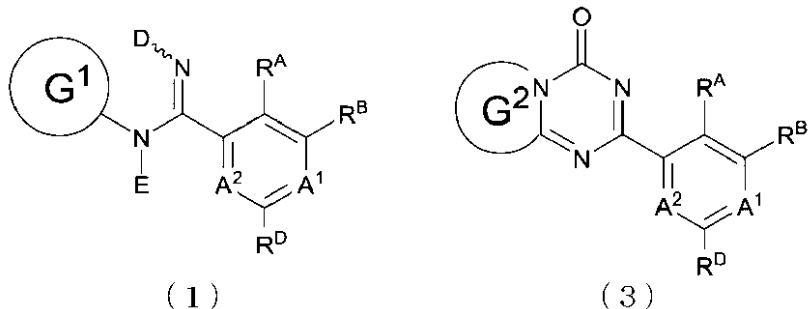
【請求項19】

式(1)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキッド。

40

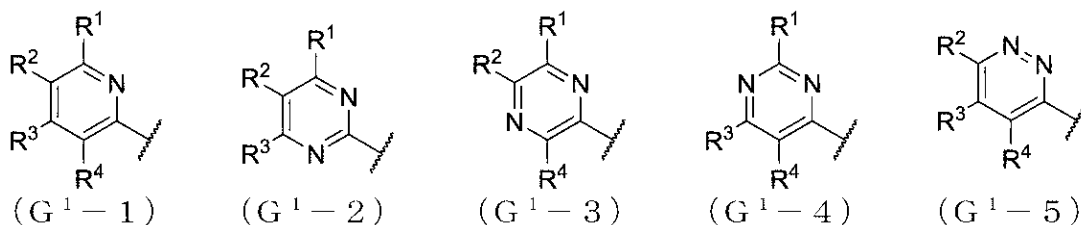
[式(1)及び式(3)中、

【化25】



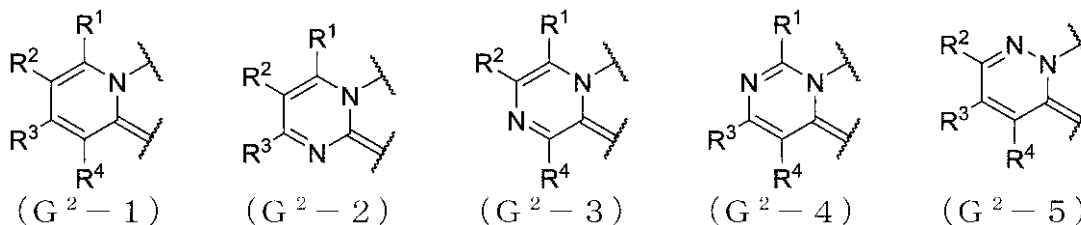
G^1 は、($G^1 - 1$)、($G^1 - 2$)、($G^1 - 3$)、($G^1 - 4$)又は($G^1 - 5$)で表される構造を表し、

【化26】



G^2 は、($G^2 - 1$)、($G^2 - 2$)、($G^2 - 3$)、($G^2 - 4$)又は($G^2 - 5$)で表される構造を表し、

【化27】



R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 について、各々独立して、その少なくとも1つは、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、($C=O$) NY^1Y^2 又は $-NY^1Y^2$ を表し、

その他は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、($C=O$) NY^1Y^2 又は $-NY^1Y^2$ を表し、

A^1 は、 $C - R^C$ 又はNを表し、

A^2 は、 $C - R^E$ 又はNを表し、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方はNであり、もう一方は $C - R^C$ 又は $C - R^E$ である。)

R^A 、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、Uによって置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、5個までのZで置換されても良いフェノキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、($C=O$) NY^3Y^4 、 $-NY^3Y^4$ 、シアノ、ニトロ、5個までのZで置換されても良いフェニル基、4個までのZで置換されても良いピリジル基、3個までのZで置換されても良いピリミジル基、3個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3個までのZで置換さ

10

20

30

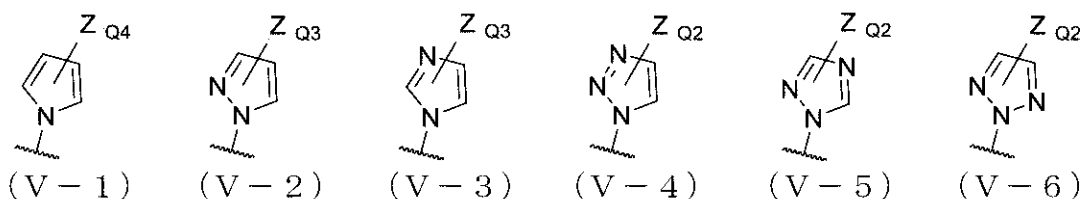
40

50

れても良いピリダジル基、3個までのZで置換されても良いチエニル基、3個までのZで置換されても良いフラニル基又はVを表し、

Vは、(V-1)、(V-2)、(V-3)、(V-4)、(V-5)又は(V-6)で表される構造を表し、

【化28】



10

Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $-NY^5Y^6$ 、シアノ又はニトロを表し、

Q2、Q3又はQ4はZの置換基数を示し、

Q2は、0、1又は2の整数を表し、

Q3は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q4は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q2、Q3又はQ4が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

Uは、シアノ、 $-C(O)OH$ 又は $-C(O)NH_2$ を表し、

Dは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルオキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルオキシカルボニル、5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

Tは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルコキシを表し、

Eは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

【請求項20】

式(1)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

[式(1)及び式(3)中、

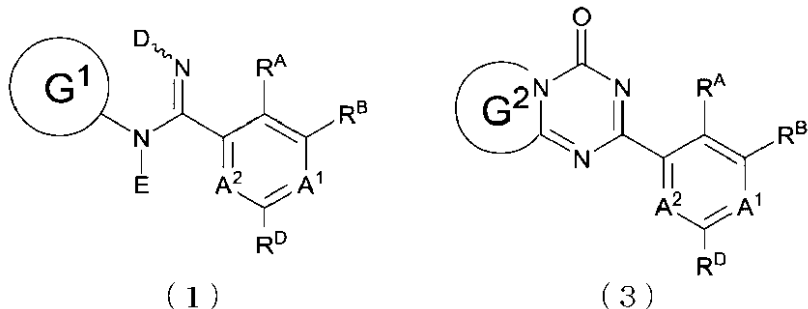
20

30

40

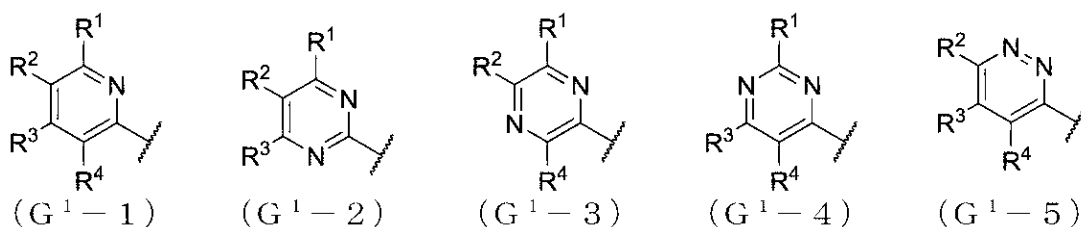
50

【化29】



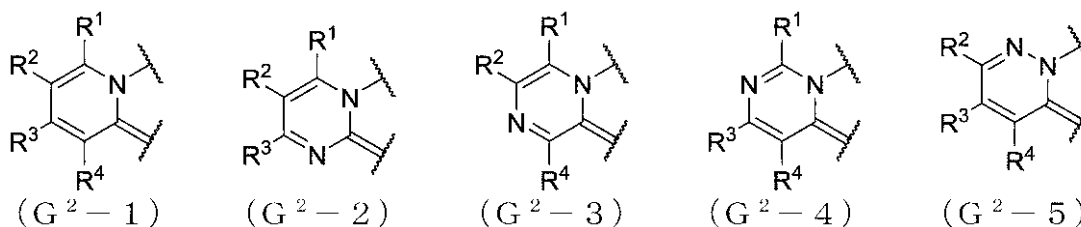
G^1 は、($G^1 - 1$)、($G^1 - 2$)、($G^1 - 3$)、($G^1 - 4$)又は($G^1 - 5$)で表される構造を表し、

【化30】



G^2 は、($G^2 - 1$)、($G^2 - 2$)、($G^2 - 3$)、($G^2 - 4$)又は($G^2 - 5$)で表される構造を表し、

【化31】



R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 について、各々独立して、その少なくとも1つは、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

その他は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

A^1 は、 $C - R^C$ 又はNを表し、

A^2 は、 $C - R^E$ 又はNを表し、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方はNであり、もう一方は $C - R^C$ 又は $C - R^E$ である。)

R^A 、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、Uによって置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $-NY^3Y^4$ 、シアノ、ニトロ又はVを表し、

Vは、(V - 1)、(V - 2)、(V - 3)、(V - 4)、(V - 5)又は(V - 6)で表される構造を表し、

10

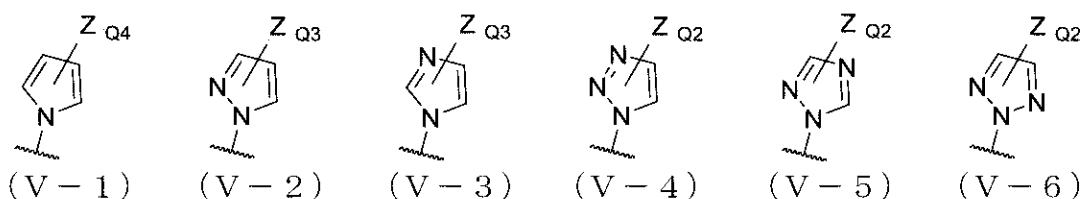
20

30

40

50

【化 3 2】



Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $-NY^5Y^6$ 、シアノ又はニトロを表し、

Q2、Q3又はQ4はZの置換基数を示し、

Q2は、0、1又は2の整数を表し、

Q3は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q4は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q2、Q3又はQ4が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

Uは、複数ある場合には各々独立して、シアノ、 $-C(O)OH$ 又は $-C(O)NH_2$ を表し、

Dは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

Eは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表す。]

【請求項 2 1】

A^1 がNであり、 A^2 がC-R^Eである式(1)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

【請求項 2 2】

A^1 がC-R^Cであり、 A^2 がNである式(1)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

【請求項 2 3】

G^1 が($G^1 - 1$)であり、 A^1 がNであり、 A^2 がC-R^Eである式(1)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

【請求項 2 4】

G^1 が($G^1 - 1$)であり、 A^1 がC-R^Cであり、 A^2 がNである式(1)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

【請求項 2 5】

A^1 がNであり、 A^2 がC-R^Eである式(3)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

【請求項 2 6】

A^1 がC-R^Cであり、 A^2 がNである式(3)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

【請求項 2 7】

10

20

30

40

50

G^2 が $(G^2 - 1)$ であり、 A^1 がNであり、 A^2 がC - R^Eである式(3)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN - オキシド。

【請求項28】

G^2 が $(G^2 - 1)$ であり、 A^1 がC - R^Cであり、 A^2 がNである式(3)で表される、請求項19に記載の化合物若しくはその塩又はそれらのN - オキシド。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、式(1)、式(2)、式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN - オキシドおよびそれを有効成分として含んでなる有害生物防除剤に関する。

10

【背景技術】

【0002】

これまでに有害節足動物の防除を目的として、様々な化合物が検討されており、実用に供されている。例えば、特許文献1、2には、縮合複素環化合物が害虫防除剤として開示されている。また、特許文献3、特許文献4には、2 - (ピリジン - 2 - イル) - [1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリジンを含む請求項の記載がなされているが、実際には合成されておらず、また、特許文献5には、一定の[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5 - a]ピリジン環を有する化合物が害虫防除剤として開示されている。また、特許文献6には、一定のアミド化合物が開示されている。しかしながら、高い有害生物防除活性を有し、実用性の高い化合物は見出されていない。

20

【先行技術文献】

【特許文献】

【0003】

【文献】国際公開第2009/131237号

【文献】国際公開第2013/180194号

【文献】国際公開第2013/191113号

【文献】国際公開第2015/000715号

【文献】特開2018 - 24657号

【文献】国際公開第2015/068719号

【発明の概要】

30

【発明が解決しようとする課題】

【0004】

本発明は、種々の有害生物に対して優れた防除活性を示す新規化合物およびそれを有効成分として含んでなる有害生物防除剤を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0005】

本発明者らは鋭意研究を重ねた結果、式(1)又は式(2)又は式(3)で表される化合物が、高い有害生物防除活性を有することを見出し、本発明を完成させるに至った。

【0006】

すなわち、本発明は以下に関するが、それに限定されない。

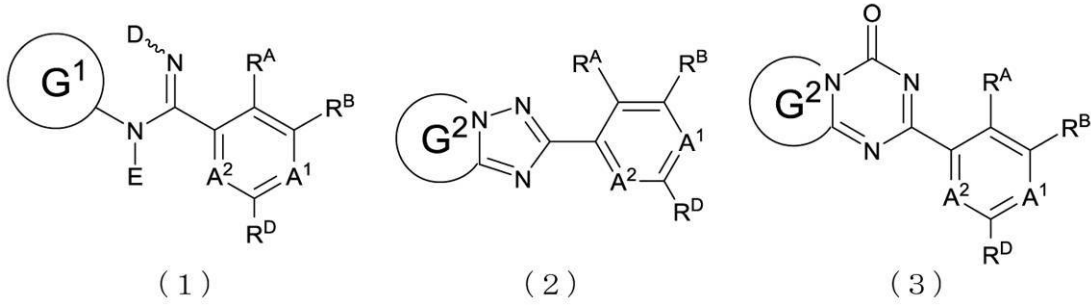
40

< 1 >

式(1)又は式(2)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN - オキシド。

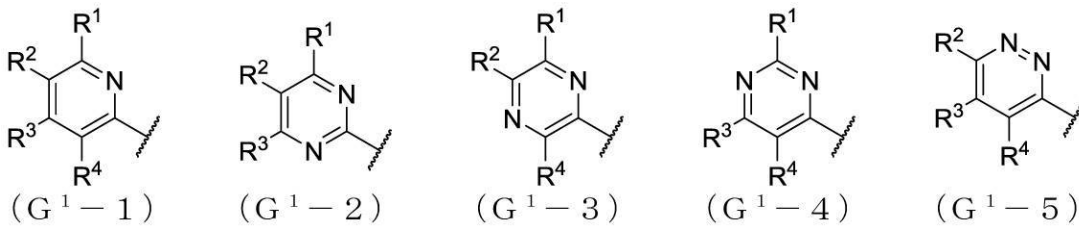
[式(1)、式(2)及び式(3)中、

【化1】



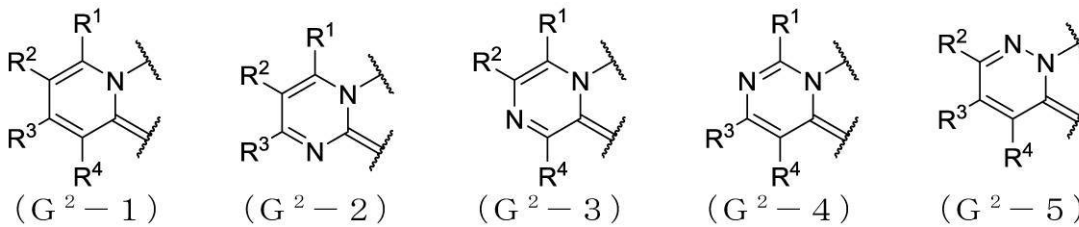
G^1 は、 $G^1 - 1$ 、 $G^1 - 2$ 、 $G^1 - 3$ 、 $G^1 - 4$ 又は $G^1 - 5$ で表される構造を表し、

【化2】



G^2 は、 $G^2 - 1$ 、 $G^2 - 2$ 、 $G^2 - 3$ 、 $G^2 - 4$ 又は $G^2 - 5$ で表される構造を表し、

【化3】



R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $(C=O)NY^1Y^2$ 又は $-NY^1Y^2$ を表し、

A^1 は、 $C - R^C$ 又はNを表し、

A^2 は、 $C - R^E$ 又はNを表し、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方はNであり、もう一方は $C - R^C$ 又は $C - R^E$ である。)

R^A 、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、Uによって置換された($C_3 \sim C_6$)シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、5個までのZで置換されても良いフェノキシ基、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $(C=O)NY^3Y^4$ 、 $-NY^3Y^4$ 、シアノ、ニトロ、5個までのZで置換されても良いフェニル基、4個までのZで置換されても良いピリジル基、3個までのZで置換されても良いピリミジル基、3個までの置換基で置換されても良いピラジル基、3個までのZで置換されても良いピリダジル基、3個までのZで置換されても良いチエニル基、3個までのZで置換されても良いフラニル基又はVを表し、

Vは、V - 1、V - 2、V - 3、V - 4、V - 5又はV - 6で表される構造を表し、

10

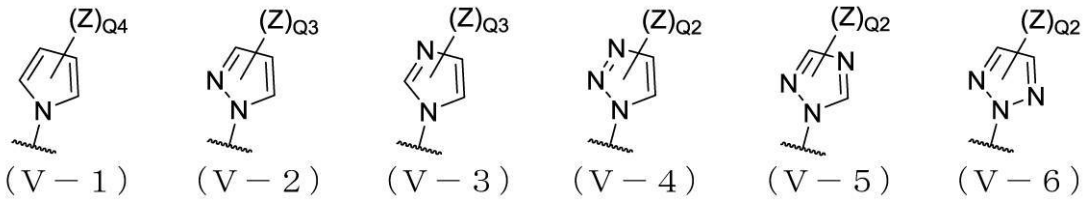
20

30

40

50

【化 4】



Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $-NY^5Y^6$ 、シアノ又はニトロを表し、

Q2、Q3又はQ4はZの置換基数を示し、

Q2は、0、1又は2の整数を表し、

Q3は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q4は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q2、Q3又はQ4が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y^1 、 Y^2 、 Y^3 、 Y^4 、 Y^5 、 Y^6 は、各々独立して、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル又はハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルを表し、

Uは、シアノ、 $-C(O)OH$ 又は $-C(O)NH_2$ を表し、

Dは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルオキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルオキシカルボニル、5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルを表し、

Tは各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルコキシを表し、

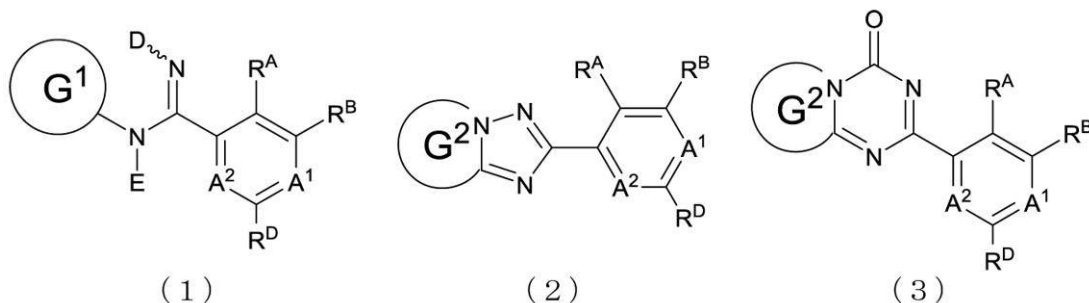
Eは水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルを表す。]

< 2 >

式(1)又は式(2)又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド。

[式(1)、式(2)及び式(3)中、

【化 5】



G^1 は、 G^1-1 、 G^1-2 、 G^1-3 、 G^1-4 又は G^1-5 で表される構造を表し、

10

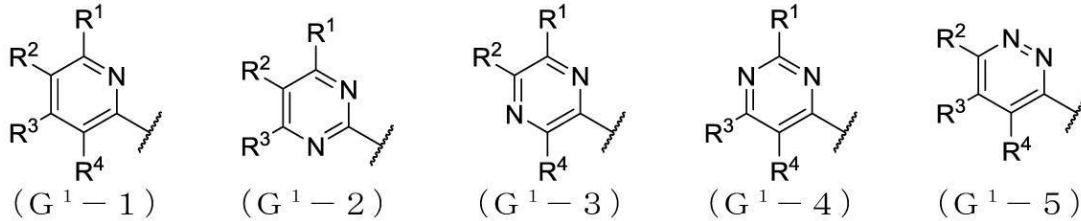
20

30

40

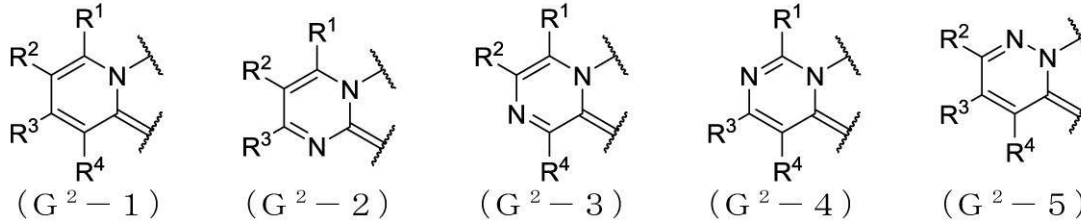
50

【化6】



G²は、G²-1、G²-2、G²-3、G²-4又はG²-5で表される構造を表し、

【化7】



R¹、R²、R³及びR⁴は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル又はハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニルを表し、

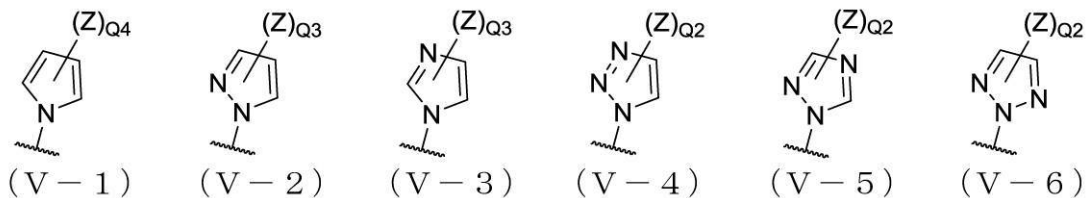
A¹は、C-R^C又はNを表し、

A²は、C-R^E又はNを表し、(ここで、A¹、A²のどちらか一方はNであり、もう一方はC-R^C又はC-R^Eである。)

R^A、R^B、R^C、R^D及びR^Eは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₃~C₆シクロアルキル、Uによって置換された(C₃~C₆)シクロアルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY³Y⁴、シアノ、ニトロ又はVを表し、

Vは、V-1、V-2、V-3、V-4、V-5又はV-6で表される構造を表し、

【化8】



Zは、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁~C₆)アルキル、C₁~C₆アルコキシ、ハロ(C₁~C₆)アルコキシ、C₁~C₆アルキルチオ、ハロ(C₁~C₆)アルキルチオ、C₁~C₆アルキルスルフィニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルフィニル、C₁~C₆アルキルスルホニル、ハロ(C₁~C₆)アルキルスルホニル、-NY⁵Y⁶、シアノ又はニトロを表し、

Q₂、Q₃又はQ₄はZの置換基数を示し、

Q₂は、0、1又は2の整数を表し、

Q₃は、0、1、2又は3の整数を表し、

Q₄は、0、1、2、3又は4の整数を表し、

Q₂、Q₃又はQ₄が2以上の整数を表す場合には、複数のZは互いに同一であっても互いに相異なっても良く、

Y³、Y⁴、Y⁵、Y⁶は、各々独立して、水素原子、C₁~C₆アルキル、ハロ(C₁

10

20

30

40

50

~ C₆) アルキル、C₁ ~ C₆ アルキルカルボニル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキルカルボニル、C₁ ~ C₆ アルコキシカルボニル、八口 (C₁ ~ C₆) アルコキシカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル又は八口 (C₁ ~ C₆) アルキルスルホニルを表し、

U は、複数ある場合には各々独立して、シアノ、-C(O)OH 又は -C(O)NH₂ を表し、

D は水素原子、C₁ ~ C₆ アルキル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキル、C₁ ~ C₆ アルキルカルボニル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキルカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキルスルホニルを表し、

E は水素原子、C₁ ~ C₆ アルキル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキル、C₁ ~ C₆ アルキルカルボニル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキルカルボニル、C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル、八口 (C₁ ~ C₆) アルキルスルホニルを表す。]

10

< 3 >

A¹ が N であり、A² が C - R^E である式 (1) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 4 >

A¹ が C - R^C であり、A² が N である式 (1) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 5 >

G¹ が G¹ - 1 であり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である式 (1) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

20

< 6 >

G¹ が G¹ - 1 であり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である式 (1) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 7 >

A¹ が N であり、A² が C - R^E である式 (2) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 8 >

A¹ が C - R^C であり、A² が N である式 (2) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 9 >

G² が G² - 1 であり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である式 (2) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

30

< 10 >

G² が G² - 1 であり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である式 (2) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 11 >

G² が G² - 1 であり、A¹ が C - R^C であり、A² が N であり、R^A が C₁ ~ C₃ アルキルスルホニルであり、R^B、R^D が水素原子であり、R^C が 5 個までの Z で置換されても良いフェニル基又は V である式 (2) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

40

< 12 >

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 180)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 181)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 174)、

50

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 7 5) 、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 7 6) 、

2 - (5 - (2 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - (エチルスルホニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン、

2 - (5 - (3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - (エチルスルホニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 7 8) 、

10

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 2 1 4) 、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 7 7)

20

< 1 3 >

A¹ が N であり、A² が C - R^E である式 (3) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 1 4 >

A¹ が C - R^C であり、A² が N である式 (3) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 1 5 >

G² が G² - 1 であり、A¹ が N であり、A² が C - R^E である式 (3) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

30

< 1 6 >

G² が G² - 1 であり、A¹ が C - R^C であり、A² が N である式 (3) で表される < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシド。

< 1 7 >

< 1 > ~ < 1 6 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドと、界面活性剤、固体担体及び液体担体からなる群から選択される少なくとも 1 つの成分を含む有害生物防除組成物。

< 1 8 >

少なくとも 1 つの他の有害生物防除化合物または薬剤をさらに含む、< 1 7 > に記載の有害生物防除組成物。

40

< 1 9 >

前記の少なくとも 1 つの有害生物防除化合物または薬剤が、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンダイオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、オキサミル、ピリミカルブ、プロボキスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、メトルカルブ、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、アセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホス - メチル、エチルチオメトン、クロルエトキシホス、カズサホス、クロレトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホスメチ

50

ル、クマホス、シアノホス、デメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロロホス、ジク
 ロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、E P N、エチオン、エトプロホス、ファミ
 フール、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホ
 ス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル = O - (メトキシアミノチオホスホリ
 ルサリチレート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオ
 ン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトンエチル、パラ
 チオン、パラチオン - メチル、P A P、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミド
 ン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロベタンホス、プロチオホス、
 ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリミホス、テメ
 ホス、テルブホス、テトラクロロピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロロホン
 、バミドチオン、クロロピリホス - エチル、ジスルフォトン、スルプロホス、フルピラゾ
 ホス、フェントエート、ホノホス、トリブホス、エンドスルファン、アルファ - エンドス
 ルファン、ガンマ - H C H、ジコホル、クロロデン、ディルドリン、メトキシクロロ、ア
 セトプロール、フィプロニル、エチプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、フルフ
 イプロール、プロフラニリド、アフォキサネル、フルララネル、サロラネル、フルキサ
 メタミド、ロティラネル、イソシクロシラム、アクリナトリン、アレスリン、d - c i s
 - t r a n s アレスリン、d - t r a n s アレスリン、ピフェントリン、カップ - ピフェ
 ントリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル、ピオレスメトリン、シクロプロトリン
 、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ
 - シハロトリン、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン
 、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン
 、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンブロックス、フェンプロパトリン
 、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフ
 ンブロックス、イミプロトリン、カデスリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレト
 リン、ピレトリン、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、カップ - テフルト
 リン、フタルスリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン、メトキサ
 ジアゾン、メトフルトリン、プロフルトリン、ピレトラム、テラレトリン、モンフルオロ
 スリン、ヘプタフルトリン、メペルフルスリン、テトラメチルフルスリン、ジメフルトリ
 ン、クロロパラレスリン、イブシロン - メトフルスリン、イブシロン - モンフルオスリン
 、プロトリフェンブト、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプ
 リド、ニテンピラム、チアクロプリド、チアメトキサム、スルホキサフル、フルピラジ
 フロン、トリフルメゾピリム、ジクロロメゾチアズ、フルピリミン、スピノサド、スピネ
 トラム、アバメクチン、イベルメクチン、エマメクチン安息香酸塩、ミルベメクチン、レ
 ピメクチン、ヒドロブレン、キノブレン、ジオフェノラン、メトブレン、ピリプロキシフ
 ェン、ピメトロジン、フロニカミド、エトキサゾール、ジアフェンチウロン、アゾシクロ
 チン、シヘキサチン、酸化フェンブタスズ、プロパルギット、テトラジホン、クロルフ
 ナピル、トラロピリル、D N O C、ベンスルタップ、カルタップ、チオシクラム、チオス
 ルタップ、チオスルタップ - ナトリウム、ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフ
 ルベンズロン、フルシクロクソン、フルフェノクソン、ヘキサフルムロン、ルフェヌ
 ロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン、ピストリフル
 ロン、ブプロフェジン、シロマジン、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェ
 ノジド、テブフェノジド、アミトラズ、ヒドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピ
 リム、ピリミノストロピン、フルフェノキシストロピン、フェナザキン、フェンピロキシ
 メート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、ピフルブ
 ミド、メタフルミゾン、スピロジクロフェン、スピロテトラマト、スピロメシフェン、ス
 ピロピディオ、シフルメトフェン、シエノピラフェン、フルベンジアミド、クロラント
 ラニリプロール、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、テトラニリプロール、
 シハロジアミド、テトラクロラントラニリプロール、キノメチオネート、ヘキシチアゾク
 ス、ピフェナゼート、フルフェネリム、ピリフルキナゾン、フロメトキン、フルオピラム
 、フルアザインドリジン、アミドフルメト、チクロピラゾフル、チオキサザフェン、オ

10

20

30

40

50

キサゾスルフィル、

ニコチン、クロロピクリン、フッ化スルフルル、クリロチエ、クロフェンテジン、ジフロビダジン、ロテノン、インドキサカルブ、ピペロニルブトキシド、クロルジメホルム、ピリダリル、アザジラクチン、ベンゾキシメート、アフィドピロペン、フルヘキサホン、フルエンシルボン、ベンクロチアズ、カルゾール、殺虫性石鹸、ジメヒポ、ニチアジン、ホウ酸塩、メタアルデヒド、リアノジン、スルフルラミド、アシノナピル、ベンズピリモキサン、3 - ブロモ - N - (2 , 4 - ジクロロ - 6 - (メチルカルバモイル)フェニルイール) - 1 - (3 , 5 - ジクロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、

メタラキシル、メタラキシル - M、オキサジキシル、オフラセ、ベナラキシル、ベナラキシル - M、キララキシル、オフラス、フララキシル、シプロフラン、ブプリメート、ジメチリモール、エチリモール、ヒメキサゾール、ヒドロキシイソキサゾール、オキサチアピプロリン、オクチリノン、オキサリニック酸、ベノミル、チオファネートメチル、カーベンダジム、フベリダゾール、チアベンダゾール、デバカルブ、ジエトフェンカルブ、ゾキサミド、エタボキサム、ペンシクロン、フルオピコリド、フルオピモミド、ジフルメトリム、ブプリメート、ベノダニル、フルトラニル、メプロニル、イソフェタミド、フェンフラム、オキシカルボキシン、カルボキシン、チフルザミド、フルキサピロキサド、フラメトピル、ペンフルフェン、ペンチオピラド、ベンゾビンジフルピル、ピキサフェン、イソピラザム、セダキサン、インピルフルキサム、フルインダピル、イソフルシプラム、ピラプロポイン、ボスカリド、アゾキシストロピン、コウメトキシストロピン、クレソキシムメチル、トリフロキシストロピン、ピコキシストロピン、ピラクロストロピン、ジモキシストロピン、メトミノストロピン、オリサストロピン、フルオキサストロピン、ピラオキシストロピン、ピラメトストロピン、フルフェノキシストロピン、フェナミンストロピン、エノキサストロピン、クモキシストロピン、マンデストロピン、トリクロピリカルブ、ファミキサドン、フェンアミドン、トリクロピリカルブ、ピリベンカルブ、シアゾファミド、アミスルプロム、ピナパクリル、メプチルジノカルブ、ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン、酢酸 - フェンチン、塩化フェンチン、水酸化フェンチン、水酸化トリフェニルスズ、酢酸トリフェニルスズ、オキシ銅、シルチオファミン、アメトクトラジン、メパニピリム、ニトラピリン、ピリメサニル、シプロジニル、プラストサイジン S、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩水和物、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン、キノキシフェン、プロキナジド、フルジオキソニル、フェンピクロニル、フルオロイミド、プロシミドン、イプロジオン、ピンクロゾリン、エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス、イソプロチオラン、プロパモカルブ、プロパモカルブ塩酸塩、ゴセイカユブテ抽出物、トリホリン、ピリフェノックス、ピリソキサゾール、フェナリモル、ヌアリモル、アザコナゾール、ブロムコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、エボキシコナゾール、フルキンコナゾール、オキスポコナゾール、ペフラゾエート、ジフェノコナゾール、フェンブコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、イマザリル、ピテルタノール、トリフルミゾール、エタコナゾール、プロピコナゾール、ペンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、マイクロブタニル、パクロブトラゾール、プロチオコナゾール、シプロコナゾール、テブコナゾール、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、シメコナゾール、イブフェントリフルコナゾール、アルジモルフ、ドデモルフ、酢酸ドデモルフ、トリデモルフ、フェンプロピモルフ、ジメトモルフ、フルモルフ、ピリモルフ、ピペラリン、フェンプロピディン、スピロキサミン、フェンヘキサミド、フェンピラザミン、フェルバム、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、チラム、マンゼブ、マンネブ、ジネブ、ジラム、ポリカーバメート、プロビネブ、チウラム、ピリブチカルブ、バリダマイシン、ミルジオマイシン、ポリオキシシン、ベンチアバリカルブ、ベンチアバリカルブイソプロピル、バリフェナレート、イプロバリカルブ、マンジプロパミド、フェンピコキサミド、フロリルピコキサミド、フサライド、ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジクロシメット、フェノキサニル、アシベンゾラル - S

10

20

30

40

50

- メチル、プロベナゾール、ジクロベンチアゾクス、チアジニル、イソチアニル、シモキサニル、ホセチル、テクロフタラム、トリアゾキシド、フルスルファミド、ジクロメジン、シフルフェナミド、メトラフェノン、ピリオフェノン、フルチアニル、テブフロキン、イプフルフェノキン、ホセチルアルミニウム、トルクロホス - メチル、エクロメゾール、トルプロカルブ、メフェントリフルコナゾール、キノフメリン、ピジフルメトフェン、ボルドー混合液、酢酸銅、塩基性硫酸銅、オキシ塩化銅、水酸化第二銅、オキシキノリン銅、銅、硫黄、キャプタン、カプタホール、フォルペット、アニラジン、クロロタロニル、ジクロロフェン、ペンタクロロフェノール及びその塩、ヘキサクロロベンゼン、キントゼン、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン酢酸塩、アルベシレート、ジチアノン、フルオルイミド、トリルフルアニド、ジクロフルアニド、ジノプトン、ダゾメット、ピラジフルミド、アミノピリフェン、メチルテトラプロール、ピリダクロメチル、

10

ジピメチロン、ピカルブトラゾクス、テクナゼン、ニトルタール - イソプロピル、ジシクロメット、アシベンゾラル、プロヘキサジオン - カルシウム、プロノポール、ジフェニルアミン、フルメトベル、ベントキサジン、ピフェニル、クロロネブ、CNA、ヨードカルブ、プロチオカルブ、並びに

Bacillus 属、及びそれらにより産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、Bt 作物により産生された殺虫性タンパク、殺菌性タンパク、昆虫病原性バクテリア、昆虫病原性ウイルスおよび昆虫病原性菌類

からなる群から選択される、< 18 > に記載の有害生物防除組成物。

20

< 20 >

前記有害生物が動物寄生性害虫であり、動物又は鳥類に投与される < 18 > に記載の有害生物防除組成物。

< 21 >

有害生物またはその環境に < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドを有害生物に接触させる、有害生物を防除する方法。

< 22 >

作物の活力を高める方法であって、作物又は作物の種子に < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドを接触させる、前記方法。

< 23 >

< 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドで処理された種子であって、処理後の種子全体の約 0.0001 ~ 約 50 重量%の量の < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドを含む、前記種子。

30

< 24 >

< 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドで作物の種子を処理する工程を含む、種子の製造方法であって、

処理後の種子が種子全体の約 0.0001 ~ 約 50 重量%の量の < 1 > に記載の化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドを含む、

前記方法。

【発明の効果】

40

【0007】

本発明による式(1)、式(2)、式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらの N - オキシドは、有害生物に対して極めて優れた防除効果を示し、有害生物防除剤として有用である。

【発明を実施するための形態】

【0008】

本明細書において、以下の用語の定義や意味は、それぞれ次のとおりである。

【0009】

また、本発明に包含される化合物は、1個又は2個以上の不斉炭素原子又は不斉硫黄原子又は軸不斉の存在に起因する光学活性体が存在するが、本発明は全ての光学活性体又は

50

ラセミ体を包含する。

【 0 0 1 0 】

また、本発明に包含される化合物には、置換基の種類によって互変異性体が存在する場合があるが、本発明は全ての互変異性体又は任意の割合で含む互変異性体の混合物を包含するものである。

【 0 0 1 1 】

また、本発明に包含される化合物には、イミノ基に起因する幾何異性体が存在する場合があるが、本発明は全ての幾何異性体又は任意の割合で含む幾何異性体の混合物を包含するものである。

【 0 0 1 2 】

イミノ基に起因する幾何異性体は、例えば、式(1)で表されるDと、イミノ基窒素原子との波線で表される結合からなり、E体、Z体又はE体とZ体を任意の割合で含む異性体の混合物であることを示す。

【 0 0 1 3 】

本発明に包含される化合物のうちで、常法に従って塩にすることができるものは、例えば、フッ化水素酸、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸等のハロゲン化水素酸の塩、硝酸、硫酸、リン酸、塩素酸、過塩素酸等の無機酸の塩、メタンスルホン酸、エタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルエンスルホン酸等のスルホン酸の塩、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸、フマル酸、酒石酸、蓚酸、マレイン酸、リンゴ酸、コハク酸、安息香酸、マンデル酸、アスコルビン酸、乳酸、グルコン酸、クエン酸等のカルボン酸の塩、グルタミン酸、アスパラギン酸等のアミノ酸の塩、リチウム、ナトリウム、カリウムといったアルカリ金属の塩、カルシウム、バリウム、マグネシウムといったアルカリ土類金属の塩、アルミニウムの塩、テトラメチルアンモニウム塩、テトラブチルアンモニウム塩、ベンジルトリメチルアンモニウム塩等の四級アンモニウム塩である。

【 0 0 1 4 】

本発明化合物において、N-オキシドとは、複素環上の環を構成する窒素原子が酸化された化合物である。N-オキシドを形成しうる複素環としては、例えば、ピリジン環を含む縮合環が挙げられる。

【 0 0 1 5 】

次に、本明細書において示した各置換基の具体例を以下に示す。ここで、n-はノルマル、i-はイソ、s-はセカンダリー、tert-はターシャリー、及びc-はシクロを各々意味する。

【 0 0 1 6 】

本明細書における「ハロゲン原子」としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子が挙げられる。尚、本明細書中「ハロ」の表記もこれらのハロゲン原子を表す。

【 0 0 1 7 】

本明細書における「C_a~C_bアルキル」の表記は、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、i-プロピル基、n-ブチル基、i-ブチル基、s-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、1,1-ジメチルプロピル基、n-ヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 1 8 】

本明細書における「ハロ(C_a~C_b)アルキル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が任意の数のハロゲン原子によって置換された、炭素原子数がa~b個よりなる直鎖状又は分岐鎖状の炭化水素基を表し、このとき、2個以上のハロゲン原子によって置換されている場合、それらのハロゲン原子は互いに同一でも、互いに相異なってもよい。例えば、フルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、ヨードメチル基、ジフルオロメチル基、ジクロロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロジフルオロメチル基、トリクロロメチル基、プロモジフルオロメチル基、1-フルオロエチル基、2-フルオロ

10

20

30

40

50

エチル基、2 - クロロエチル基、2 - ブロモエチル基、2, 2 - ジフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチル基、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチル基、2, 2, 2 - トリクロロエチル基、2 - ブロモ - 2, 2 - ジフルオロエチル基、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル基、2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエチル基、2 - クロロ - 1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2, 2 - ジフルオロプロピル基、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル基、3 - ブロモ - 3, 3 - ジフルオロプロピル基、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロピル基、2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロピル基、1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - (メチル)エチル基、2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル)エチル基、1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル)エチル基、2, 2, 3, 4, 4, 4 - ヘキサフルオロブチル基、2, 2, 3, 3, 4, 4, 4 - ヘプタフルオロブチル基、ノナフルオロブチル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0019】

「 $C_a \sim C_b$ シクロアルキル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる環状の炭化水素基を表わし、3員環から6員環までの単環又は複合環構造を形成することが出来る。また、各々の環は指定の炭素原子数の範囲でアルキル基によって任意に置換されていてもよい。例えばシクロプロピル基、1 - メチルシクロプロピル基、2 - メチルシクロプロピル基、2, 2 - ジメチルシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0020】

「 $C_a \sim C_b$ アルコキシ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル - O - 基を表わし、例えばメトキシ基、エトキシ基、 n - プロピルオキシ基、 i - プロピルオキシ基、 n - ブチルオキシ基、 i - ブチルオキシ基、 s - ブチルオキシ基、 $tert$ - ブチルオキシ基、2 - エチルヘキシルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0021】

「 $C_a \sim C_b$ アルコキシ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル - O - 基を表わし、例えばジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロジフルオロメトキシ基、プロモジフルオロメトキシ基、2 - フルオロエトキシ基、2 - クロロエトキシ基、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ基、2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエトキシ基、1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロピルオキシ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0022】

「 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル - S - 基を表わし、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、 n - プロピルチオ基、 i - プロピルチオ基、 n - ブチルチオ基、 i - ブチルチオ基、 s - ブチルチオ基、 $tert$ - ブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0023】

本明細書における「 $C_a \sim C_b$ アルキルチオ」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル - S - 基を表し、例えば、ジフルオロメチルチオ基、トリフルオロメチルチオ基、クロロジフルオロメチルチオ基、プロモジフルオロメチルチオ基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルチオ基、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチルチオ基、2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエチルチオ基、ペンタフルオロエチルチオ基、1, 1, 2, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロピルチオ基、ヘプタフルオロプロピルチオ基、1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル)エチルチオ基、ノナフルオロブチルチオ基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

20

30

40

50

【 0 0 2 4 】

「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルフィニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル - S (O) - 基を表わし、例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、 n - プロピルスルフィニル基、 i - プロピルスルフィニル基、 n - ブチルスルフィニル基、 i - ブチルスルフィニル基、 s - ブチルスルフィニル基、 $t e r t$ - ブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 2 5 】

本明細書における「 $ハロ(C_a \sim C_b)$ アルキルスルフィニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味である $ハロアルキル - S (O) - 基$ を表し、例えば、ジフルオロメチルスルフィニル基、トリフルオロメチルスルフィニル基、クロロジフルオロメチルスルフィニル基、プロモジフルオロメチルスルフィニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィニル基、1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル)エチルスルフィニル基、ノナフルオロブチルスルフィニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

10

【 0 0 2 6 】

「 $C_a \sim C_b$ アルキルスルホニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル - S O₂ - 基を表わし、例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、 n - プロピルスルホニル基、 i - プロピルスルホニル基、 n - ブチルスルホニル基、 i - ブチルスルホニル基、 s - ブチルスルホニル基、 $t e r t$ - ブチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

20

【 0 0 2 7 】

本明細書における「 $ハロ(C_a \sim C_b)$ アルキルスルホニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味である $ハロアルキル - S O_2 - 基$ を表し、例えば、ジフルオロメチルスルホニル基、トリフルオロメチルスルホニル基、クロロジフルオロメチルスルホニル基、プロモジフルオロメチルスルホニル基、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニル基、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチルスルホニル基、2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエチルスルホニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【 0 0 2 8 】

「 $C_a \sim C_b$ アルキルカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル - C (O) - 基を表わし、例えば、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、パレリル基、イソパレリル基、2 - メチルブタノイル基、ピバロイル基、ヘキサノイル基、ヘプタノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

30

【 0 0 2 9 】

「 $ハロ(C_a \sim C_b)$ アルキルカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味である $ハロアルキル - C (O) - 基$ を表わし、例えば、フルオロアセチル基、クロロアセチル基、ジフルオロアセチル基、ジクロロアセチル基、トリフルオロアセチル基、クロロジフルオロアセチル基、プロモジフルオロアセチル基、トリクロロアセチル基、ペンタフルオロプロピオニル基、ヘプタフルオロブタノイル基、3 - クロロ - 2, 2 - ジメチルプロパノイル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

40

【 0 0 3 0 】

「 $C_a \sim C_b$ アルコキシカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるアルキル - O - C (O) - 基を表わし、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、 n - プロピルオキシカルボニル基、 i - プロピルオキシカルボニル基、 n - ブトキシカルボニル基、 i - ブトキシカルボニル基、 s - ブトキシカルボニル基、 $t e r t$ - ブトキシカルボニル基、2 - エチルヘキサノオキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

50

【0031】

「ハロ($C_a \sim C_b$)アルコキシカルボニル」の表記は、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるハロアルキル - O - C(O) - 基を表わし、例えば、クロロメトキシカルボニル基、2 - クロロエトキシカルボニル基、2, 2 - ジフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2, - トリフルオロエトキシカルボニル基、2, 2, 2, - トリクロロエトキシカルボニル基等が具体例として挙げられ、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。

【0032】

「Uによって置換された($C_a \sim C_b$)シクロアルキル」の表記は、炭素原子に結合した水素原子が任意の数のUによって置換された、炭素原子数が $a \sim b$ 個よりなる前記の意味であるシクロアルキル基を表わし、各々の指定の炭素原子数の範囲で選択される。このとき、それぞれの($C_a \sim C_b$)シクロアルキル基上の置換基Uが2個以上存在するとき、それぞれのUは互いに同一でも異なってもよい。

10

【0033】

本発明の式(1)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN - オキシドにおいて、好ましくは、 G^1 は、 $G^1 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルフィニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニルであり、 R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルスルホニル、1H - ピラゾール - 1 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、 A^1 は、C - R^C 又はNであり、 A^2 は、C - R^E 又はNであり、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方はNであり、もう一方はC - R^C 又はC - R^E である。)、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、各々独立して5個までのZで置換されても良いフェニル、V - 2、V - 4、V - 5、V - 6であり、Dは水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルオキシカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルオキシカルボニル、各々独立して5個までのTで置換されても良いベンゼンカルボニルであり、Tは水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルコキシであり、Eは、水素原子、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルカルボニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、ハロ($C_1 \sim C_6$)アルキルスルホニル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルである。

20

30

【0034】

本発明の式(1)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN - オキシドにおいて、より好ましくは、 G^1 は、 $G^1 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は水素原子、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルであり、 R^A は、エチルチオ、エチルスルホニル、1H - ピラゾール - 1 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、 A^1 は、C - R^C であり、 A^2 は、Nであり、 R^B 、 R^D は、水素原子であり、 R^C は各々独立して2個までのZで置換されても良いフェニル、1H - ピラゾール - 1 - イル、2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、Zは、水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシであり、Dは水素原子、アセチルであり、Eは、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルである。

40

50

【 0 0 3 5 】

本発明の式(1)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN-オキシドにおいて、より好ましくは、 G^1 は、 G^1-1 であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は水素原子、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキルであり、 R^A は、エチルチオ、エチルスルホニル、1H-ピラゾール-1-イル、2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イルであり、 A^2 は、 $C-R^E$ であり、 A^1 は、Nであり、 R^B 、 R^D は、水素原子であり、 R^C は各々独立して2個までのZで置換されても良いフェニル、1H-ピラゾール-1-イル、2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イルであり、Zは、水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシであり、Dは水素原子、アセチルであり、Eは、水素原子、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、シクロプロピルメチル、ハロ($C_1 \sim C_3$)アルキル、メトキシメチル、エトキシメチル、シアノメチル、シアノエチル、メチルチオメチル、メチルスルホニルメチルである。

10

【 0 0 3 6 】

本発明の式(1)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN-オキシドにおいて、さらに好ましくは、 R^A は、エチルチオ、エチルスルホニルである。

【 0 0 3 7 】

本発明の式(1)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN-オキシドにおいて、特に好ましくは、

3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号91)、

20

3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-N-(4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号100)、

N-((3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2-イル)(4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号101)、

3-(エチルスルホニル)-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号103)、

3-(エチルスルホニル)-5-(1H-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号105)、

30

N-((3-(エチルスルホニル)-5-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-2-イル)(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号106)、

N-((3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2-イル)(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号108)、

3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)-N-(6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号109)、

N-((3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2-イル)(6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号110)、

40

N-((3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2-イル)(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチレン)-2, 2, 2-トリフルオロアセタミド(化合物番号111)、

3-(エチルスルホニル)-5-(1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号120)、

5-(ジメチルアミノ)-3-(エチルスルホニル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号125)、

50

- 3 - (エチルスルホニル) - 5 - フェニル - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号127)、
- 5 - (4 - クロロメチル) - 3 - (エチルスルホニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号131)、
- 5 - (3,5 - ジクロロフェニル) - 3 - (エチルスルホニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号133)、
- 3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号137)、
- 3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号139)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン - 2 - イル)(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号140)、
- 3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号142)、
- 5 - (2,4 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル) - 3 - (エチルスルホニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号144)、
- 5 - (3,5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル) - 3 - (エチルスルホニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号146)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (1H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン - 2 - イル)(メチル(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号199)、
- 3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメトキシ)フェニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド(化合物番号200)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピリジン - 2 - イル)(メチル(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号204)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン - 2 - イル)(メチル(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号205)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン - 2 - イル)(メトキシメチル)(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号207)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピリジン - 2 - イル)(メトキシメチル)(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号209)、
- N - ((エトキシメチル)(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)(3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン - 2 - イル)メチレン)アセタミド(化合物番号211)、
- N - ((シアノメチル)(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)(3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン - 2 - イル)メチレン)アセタミド(化合物番号213)、
- N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピリジン - 2 - イル)(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号220)、
- N - ((エチル(5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミノ)(3 - (エ

チルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピリジン - 2 - イル)
メチレン)アセタミド、

N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピ
リジン - 2 - イル) (プロピル (5 - (トリフルオロメトキシ)ピリジン - 2 - イル)ア
ミノ)メチレン)アセタミド、

N - (((2 - シアノエチル) (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)アミ
ノ) (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピ
リジン - 2 - イル)メチレン)アセタミド、

N - ((3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ)フェニル)ピ
リジン - 2 - イル) ((メチルスルホニル)メチル) (5 - (トリフルオロメチル)ピ
リジン - 2 - イル)アミノ)メチレン)アセタミド、

10

である。

【 0 0 3 8 】

本発明の式 (2) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおい
て、好ましくは、 G^2 は、 $G^2 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、各々独立して、
水素原子、ハロゲン原子、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキルチオ
、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルフィニル、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニルであ
り、 R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキル
チオ、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、ハロ ($C_1 \sim C_3$)
アルキルスルホニル、1 H - ピラゾール - 1 - イル、2 H - 1, 2, 3 - トリアゾール
- 2 - イルであり、 A^1 は、 $C - R^C$ 又は N であり、 A^2 は、 $C - R^E$ 又は N であり、 (
ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方は N であり、もう一方は $C - R^C$ 又は $C - R^E$ である。
)、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アル
コキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキ
ルスルホニル、各々独立して 5 個までの Z で置換されても良いフェニル、V - 2、V - 4
、V - 5、V - 6 である。

20

【 0 0 3 9 】

本発明の式 (2) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおい
て、より好ましくは、 G^2 は、 $G^2 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は水素原子、ハ
ロ ($C_1 \sim C_3$) アルキルであり、 R^A は、エチルチオ、エチルスルホニル、1 H - ピラゾ
ール - 1 - イル、2 H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、 A^1 は、 $C - R^C$
であり、 A^2 は、N であり、 R^B 及び R^D は、水素原子であり、 R^C は各々独立して 2 個ま
での Z で置換されても良いフェニル、1 H - ピラゾール - 1 - イル、2 H - 1, 2, 3 -
トリアゾール - 2 - イル、ジメチルアミノであり、Z は、水素、フッ素、塩素、トリフル
オロメチル、トリフルオロメトキシである。

30

【 0 0 4 0 】

本発明の式 (2) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおい
て、さらに好ましくは、 R^A は、エチルチオ、エチルスルホニルである。

【 0 0 4 1 】

本発明の式 (2) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおい
て、特に好ましくは、

2 - (3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル)ピリジン - 4 - イル) - 6 - (トリフルオロ
メチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 4 6)、

2 - (3 - (2 H - 1, 2, 3 - トリアゾロ - 2 イル)ピリジン - 4 - イル) - 6 - (ト
リフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 4
8)、

2 - (3 - (2 H - 1, 2, 3 - トリアゾロ - 2 - イル)ピリジン - 4 - イル) - 7 - (
トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号
1 7 0)、

5 - (エチルスルホニル) - N, N - ジメチル - 6 - (6 - (トリフルオロメチル) - [

40

50

1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン - 2 - イル) ピリジン - 3 - アミン (化合物番号 173)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 174)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 175)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 176)、

2 - (5 - (2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - (エチルスルホニル)) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 214)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 177)、

2 - (5 - (3, 5 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - (エチルスルホニル)) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 178)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (ピリミジン - 5 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 179)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (1H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 180)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 181)

である。

【0042】

本発明の式(2)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN-オキシドにおいて、最も好ましくは、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 174)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 175)、

2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 176)、

2 - (5 - (2, 4 - ビス(トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - (エチルスルホニル)) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1

10

20

30

40

50

, 5 - a] ピリジン、
 2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン、
 2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (3 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 2 1 4)、
 2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 7 7)、
 2 - (5 - (3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル) - 3 - (エチルスルホニル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 7 8)、
 2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 8 0)、
 2 - (3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル) ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 - a] ピリジン (化合物番号 1 8 1)
 である。

【 0 0 4 3 】

本発明の式 (3) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおいて、好ましくは、 G^2 は、 $G^2 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキル、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキルチオ、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルフィニル、ハロ ($C_1 \sim C_6$) アルキルスルホニルであり、 R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルキルスルホニル、1 H - ピラゾール - 1 - イル、2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、 A^1 は、 $C - R^C$ 又は N であり、 A^2 は、 $C - R^E$ 又は N であり、(ここで、 A^1 、 A^2 のどちらか一方は N であり、もう一方は $C - R^C$ 又は $C - R^E$ である。)、 R^B 、 R^C 、 R^D 及び R^E は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、各々独立して 5 個までの Z で置換されても良いフェニル、V - 2、V - 4、V - 5、V - 6 である。

【 0 0 4 4 】

本発明の式 (3) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおいて、より好ましくは、 G^2 は、 $G^2 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は水素原子、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルキルであり、 R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルであり、 A^1 は、 $C - R^C$ であり、 A^2 は、N であり、 R^B 及び R^D は、水素原子であり、 R^C は各々独立して 2 個までの Z で置換されても良いフェニル、1 H - ピラゾール - 1 - イル、2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、Z は、水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシである。

【 0 0 4 5 】

本発明の式 (3) で表される化合物若しくはその塩類又はそれらの N - オキシドにおいて、より好ましくは、 G^2 は、 $G^2 - 1$ であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は水素原子、ハロ ($C_1 \sim C_3$) アルキルであり、 R^A は、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルであり、 A^2 は、 $C - R^E$ であり、 A^1 は、N であり、 R^B 及び R^D は、水素原子であり、 R^C は各々独立して 2 個までの Z で置換されても良いフェニル、1 H - ピラゾール - 1 - イル、2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イルであり、Z は、水素、フッ素、塩素、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシである。

【0046】

本発明の式(3)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN-オキシドにおいて、さらに好ましくは、 R^A は、エチルチオ、エチルスルホニルである。

【0047】

本発明の式(3)で表される化合物若しくはその塩類又はそれらのN-オキシドにおいて、さらに好ましくは、

2-(3-(エチルスルホニル)-5-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン(化合物番号193)

2-(3-(エチルスルホニル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン(化合物番号215)、

2-(3-(エチルスルホニル)-5-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン(化合物番号216)、

2-(3-(エチルスルホニル)-5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン(化合物番号217)、

2-(3-(エチルスルホニル)-5-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン(化合物番号218)、

2-(3-(エチルスルホニル)-5-(4-(トリフルオロメトキシトリフルオロメトキシ)フェニル)ピリジン-2-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン(化合物番号219)、

である。

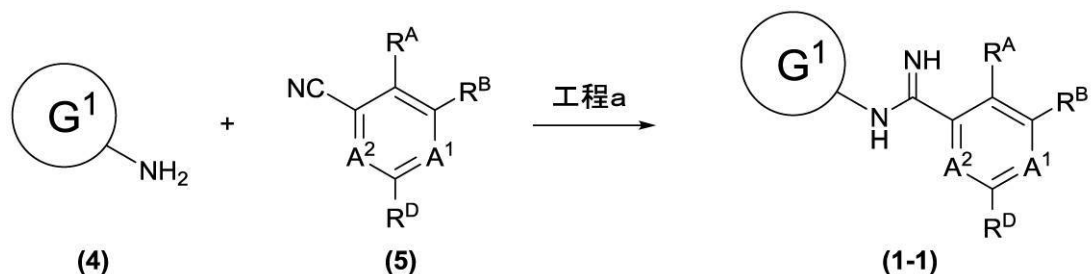
【0048】

本発明の式(1)、式(2)、又は式(3)で表される化合物若しくはその塩又はそれらのN-オキシド(以下、本発明の化合物ともいう)は、例えば下記製造方法によって製造することができるが、本発明はこれらに限定されるものではない。

【0049】

<製造方法1>

【化9】



{式中、 R^A 、 R^B 、 R^D 、 A^1 、 A^2 及び G^1 は前記と同じであることを示す。}

【0050】

工程 a

式(4)で表されるアミン化合物と式(5)で表されるシアノ化合物とを、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応させることにより式(1-1)で表されるアミジン化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法(Journal of Organic Chemistry, 2014, 79(10), p. 4687-4693)に準じて行うことができる。

【0051】

本反応で使用できる塩基としては、例えば、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素

化カリウム、水素化カルシウム等の水素化アルカリ金属、ノルマルブチルリチウム、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムジイソプロピルアミン等が挙げられるが、本反応で使用できる反応剤はこれに限らない。塩基の使用量は式(4)で表される化合物に対して通常約1倍モル~3倍モルの範囲で使用される。

【0052】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

10

【0053】

本反応における反応温度は通常-78 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。式(5)で表されるシアノ化合物は式(4)で表されるアミノ化合物に対して通常約1/3倍モル~1倍モル又は約1倍モル~3倍モルの範囲で使用される。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

20

【0054】

工程 a の別法

式(4)で表されるアミン化合物と式(5)で表されるシアノ化合物とを、ルイス酸の存在下、反応させることにより式(1-1)で表されるアミジン化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法(J. Med. Chem. 2002, 45, 21, 4655-4668)に準じて行うことができる。

【0055】

本反応で使用できるルイス酸としては、例えば、トリメチルアルミニウム、塩化アルミニウム、四塩化チタン等が挙げられるが、本反応で使用できる反応剤はこれに限らない。ルイス酸の使用量は式(4)で表される化合物に対して通常約1倍モル~3倍モルの範囲で使用される。

30

【0056】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化溶剤挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0057】

本反応における反応温度は通常0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。式(5)で表されるシアノ化合物は式(4)で表されるアミノ化合物に対して通常約1倍モル~3倍モルの範囲で使用される。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

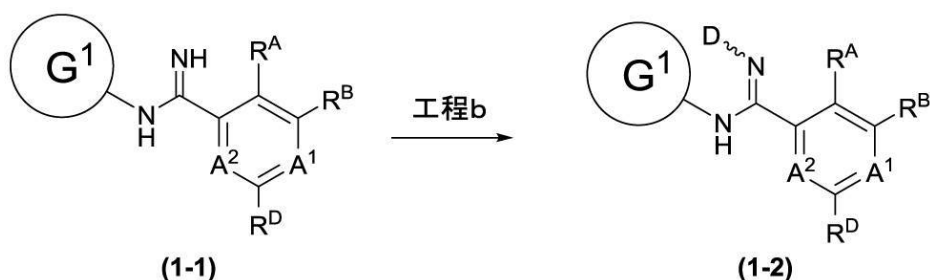
40

【0058】

工程 b

50

【化10】



Dが水素原子ではない場合、式(1-1)で表されるアミジン化合物を、場合により塩基及び不活性溶媒の存在下、反応剤と反応させることにより式(1-2)で表されるアミジン化合物を製造することができる。

{式中、 R^A 、 R^B 、 R^D 、 A^1 、 A^2 、 G^1 及びDは前記と同じであることを示す。}

【0059】

本発明で使用できる反応剤としては、例えば、塩化アセチル、塩化トリフルオロアセチル、クロロ炭酸メチル、メタンスルホン酸塩化物、トリフルオロメタンスルホン酸塩化物等の酸塩化物、無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、無水トリフルオロスルホン酸等の酸無水物；ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、1,1,1-トリフルオロ-2-ヨードエタン、硫酸ジメチル等のアルキル化剤等が挙げられるが、本反応で使用できる反応剤はこれに限らない。反応剤の使用量は、式(1-1)で表される化合物に対して通常約1倍モル～3倍モルの範囲で適宜選択すればよく、また無水酢酸等の反応剤は過剰に加えることで無溶媒で反応させることができる。

【0060】

本発明で使用できる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等の水素化アルカリ金属、ノルマルブチルリチウム、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムジイソプロピルアミン等を挙げることができ、その使用量は、式(8)で表される化合物に対して通常約1倍モル～5倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【0061】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリノン等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0062】

本反応における反応温度は通常約-78から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分～48時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0063】

工程c

10

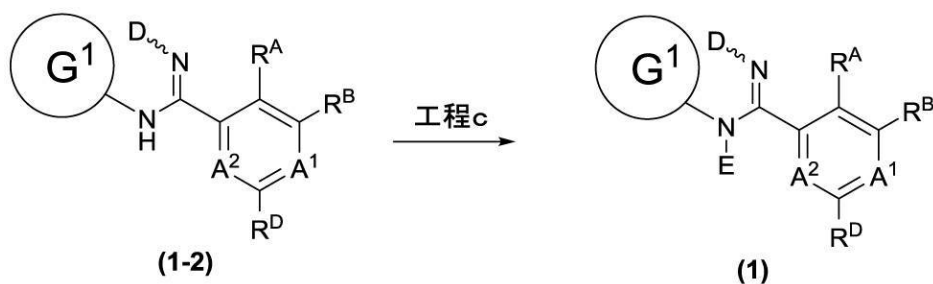
20

30

40

50

【化 1 1】



E が水素原子ではない場合、式 (1 - 2) で表されるアミジン化合物を、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応剤と反応させることにより式 (1) で表されるアミジン化合物を製造することができる。

{ 式中、 R^A 、 R^B 、 R^D 、 A^1 、 A^2 、 G^1 、 D 及び E は前記と同じであることを示す。 }

【 0 0 6 4】

本発明で使用できる反応剤としては、例えば、塩化アセチル、塩化トリフルオロアセチル、クロロ炭酸メチル、メタンスルホン酸塩化物、トリフルオロメタンスルホン酸塩化物等の酸塩化物；無水酢酸、無水トリフルオロ酢酸、無水トリフルオロスルホン酸等の酸無水物；ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、1, 1, 1 - トリフルオロ - 2 - ヨードエタン、硫酸ジメチル等のアルキル化剤が挙げられるが、本反応で使用できる反応剤はこれに限らない。反応剤の使用量は、式 (1 - 2) で表される化合物に対して通常約 1 倍モル ~ 3 倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【 0 0 6 5】

本発明で使用できる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、 N, N - ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウム等の水素化アルカリ金属、ノルマルブチルリチウム、ナトリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、リチウムジイソプロピルアミン等を挙げることができ、その使用量は、式 (1 - 2) で表される化合物に対して通常約 1 倍モル ~ 5 倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【 0 0 6 6】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、 N, N - ジメチルホルムアミド、 N, N - ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリノン等の極性溶媒を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

【 0 0 6 7】

本反応における反応温度は通常約 - 78 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分 ~ 48 時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【 0 0 6 8】

< 製造方法 2 >
工程 d

10

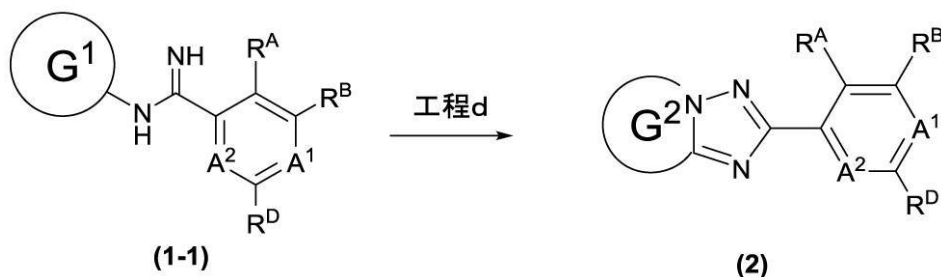
20

30

40

50

【化12】



式(1-1)で表されるアミジン化合物を、不活性溶媒の存在下、反応剤と反応させることにより式(2)で表されるアミジン化合物を製造することができる。本反応は文献記載の方法(Journal of Organic Chemistry, 2014, 79(10), p. 4687-4693)に準じて行うことができる。

{式中、 R^A 、 R^B 、 R^D 、 A^1 、 A^2 、 G^1 及び G^2 は前記と同じであることを示す。}

【0069】

本発明で使用できる反応剤としては、例えば、ヨードベンゼンジアセテート、(ビス(トリフルオロアセトキシ)ヨード)ベンゼン、ヨードシルベンゼン、(ヒドロキシ(トシルオキシ)ヨード)ベンゼン、2-ヨードキシ安息香酸、Dess-Martinペルヨージナン等の超原子化ヨウ素化合物等の酸化剤が挙げられるが、本反応で使用できる反応剤はこれに限らない。反応剤の使用量は、式(1-1)で表される化合物に対して通常約1倍モル~5倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【0070】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジクロロメタン、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化溶剤、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、2,2,2-トリフルオロエタノール、ヘキサフルオロ-2-プロパノール等のアルコール溶剤、酢酸エチル、アセトニトリル等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

【0071】

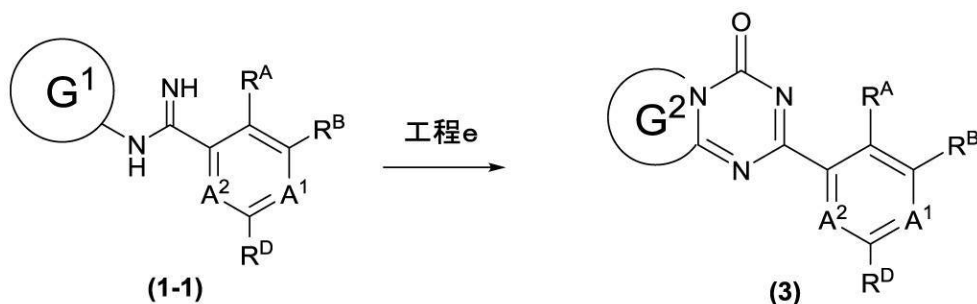
本反応における反応温度は通常約0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分~48時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【0072】

<製造方法3>

工程e

【化13】



式(1-1)で表されるアミジン化合物を、塩基及び不活性溶媒の存在下、反応剤と反応させることにより式(3)で表されるアミジン化合物を製造することができる。

{ 式中、 R^A 、 R^B 、 R^D 、 A^1 、 A^2 、 G^1 及び G^2 は前記と同じであることを示す。 }

【 0 0 7 3 】

本発明で使用できる反応剤としては、例えば、クロロ炭酸メチル、クロロ炭酸エチル、クロロギ酸フェニル、クロロギ酸 4 - ニトロフェニル、クロロギ酸 4 - クロロフェニル、ホスゲン、トリホスゲン、カルボニルジイミダゾール等が挙げられるが、本反応で使用できる反応剤はこれに限らない。反応剤の使用量は、式 (1 - 1) で表される化合物に対して通常約 1 倍モル ~ 5 倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

【 0 0 7 4 】

本発明で使用できる塩基としては、例えば、トリエチルアミン、 N, N - ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン等を挙げることができ、その使用量は、式 (1 - 1) で表される化合物に対して通常約 1 倍モル ~ 5 倍モルの範囲で適宜選択すればよい。

10

【 0 0 7 5 】

本反応で使用できる不活性溶媒としては、本反応を著しく阻害しないものであれば良く、例えば、ジクロロメタン、1, 2 - ジクロロエタン等のハロゲン化溶剤、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の鎖状又は環状エーテル類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、 N, N - ジメチルホルムアミド、 N, N - ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシド、1, 3 - ジメチル - 2 - イミダゾリノン等の極性溶媒、酢酸エチル、アセトニトリル等を挙げることができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2 種以上混合して使用することができる。

20

【 0 0 7 6 】

本反応における反応温度は通常約 0 から使用する溶媒の沸点の範囲で行えばよく、反応時間は反応規模、反応温度等により一定しないが、数分 ~ 48 時間の範囲で適宜選択すれば良い。また本反応は、例えば窒素ガスやアルゴンガスのような不活性ガスの雰囲気下で行うこともできる。反応終了後、目的物を含む反応系から常法により目的物を単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

【 0 0 7 7 】

防除対象

本発明において防除の対象とする有害生物は特に限定されるものではなく、広範な農園芸における害虫、ダニ、線虫、土壌害虫の防除 - 殺虫を含む - に用いる事ができる。これらの有害生物を本発明中において、農園芸用害虫と定義する。好ましい防除対象虫種としては、例えば、以下のものが挙げられる。

30

鱗翅目害虫 (Lepidoptera) { 例えば、ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、Darkhead ed stem borer (*Chilo polychrysus*)、White stem borer (*Scirpophaga innotata*)、イッテンオオメイガ (*Scirpophaga incertulas*)、*Rupela albina*、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、*Marasmia patnalis*、イネハカジノメイガ (*Marasmia exigua*)、ワタノメイガ (*Notarcha derogata*)、アワノメイガ (*Ostrinia furnacalis*)、European corn borer (*Ostrinia nubilalis*)、ハイマダラノメイガ (*Hellula undalis*)、モンキクロノメイガ (*Herpetogramma luctuosale*)、シバツトガ (*Pediasia teterrellus*)、ライスケースワーム (*Nymphula depunctalis*)、Sugarcane borer (*Diatraea saccharalis*) 等のツトガ科 (Crambidae)；モロコシマダラメイガ (*Elasmopalpus lignosellus*)、ノシメマダラメイガ (*Plodia interpunctella*) 等のメイガ科 (Pyralidae)；ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Mythimna separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、シロナヨトウ (*Spodoptera mauritia*)、フタオビコヤガ (*Naranga aenescens*)、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*)、アフリカシロナヨトウ (*Spodoptera exempta*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、タマナギンウワバ (*Autographa nigrisigna*)、イネキンウワバ (*Plusia festucae*)、Soybean looper (*Chrysodeixis includens*)、トリコプルシア属 (*Trichoplu*

40

50

sia spp.)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 等のヘリオティス属 (*Heliothis* spp.)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 等のヘリコベルパ属 (*Helicoverpa* spp.)、Velvetbean caterpillar (*Anticarsia gemmatilis*)、Cotton leafworm (*Alabama argillacea*)、Hop vine borer (*Hydraecia immanis*) 等のヤガ科 (Noctuidae)；モンシロチョウ (*Pieris rapae*) 等のシロチョウ科 (Pieridae)；ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、スモモヒメシンクイ (*Grapholita dimorpha*)、マメシンクイガ (*Leguminivora glycinivorella*)、アズキサヤムシガ (*Matsumuraeses azukivora*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes honmai*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、ミダレカクモンハマキ (*Archips fuscocupreanus*)、コドリガ (*Cydia pomonella*)、カンシャシンクイハマキ (*Tetramoera schistaceana*)、Bean Shoot Borer (*Epinotia aporema*)、Citrus fruit borer (*Ecdytophaga aurantiana*) 等のハマキガ科 (Tortricidae)；チャノホソガ (*Caloptilia theivora*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*) のホソガ科 (Gracillariidae)；モモシンクイガ (*Carposina sasakii*) 等のシンクイガ科 (Carposinidae)；Coffee Leaf miner (*Leucoptera coffeella*)、モモハモグリガ (*Lyonetia clerkella*)、ギンモンハモグリガ (*Lyonetia prunifoliella*) 等のハモグリガ科 (Lyonetiidae)；マイマイガ (*Lymantria dispar*) 等のリマントリア属 (*Lymantria* spp.)、チャドクガ (*Euproctis pseudoconspersa*) 等のユープロクティス属 (*Euproctis* spp.) 等のドクガ科 (Lymantriidae)；コナガ (*Plutella xylostella*) 等のコナガ科 (Pluteliidae)；モモキバガ (*Anarsia lineatella*)、イモキバガ (*Helcystogramma triannulella*)、ワタアカミムシガ (*Pectinophora gossypiella*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、*Tuta absoluta* 等のキバガ科 (Gelechiidae)；アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) 等のヒトリガ科 (Arctiidae)；Giant Sugarcane borer (*Telchin licus*) 等のカストニアガ科 (Castniidae)；ヒメボクトウ (*Cossus insularis*) 等のボクトウガ科 (Cossidae)；ヨモギエダシャク (*Ascotis selenaria*) 等のシャクガ科 (Geometridae)；ヒロヘリアオイラガ (*Parasa lepida*) 等のイラガ科 (Limacodidae)；カキノヘタムシガ (*Stathmopoda masinissa*) 等のニセマイコガ科 (Stathmopodidae)；クロメンガタスズメ (*Acherontia lachesis*) 等のスズメガ科 (Sphingidae)；キクビスカシバ (*Nokona feralis*) 等のスカシバガ科 (Sesiidae)；イネツトムシ (*Parnara guttata*) 等のセセリチョウ科 (Hesperiidae) }。

半翅目害虫 (Hemiptera) { 例えば、ヒメトビウンカ (*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、キタウンカ (*Javesella pellucida*)、クロフツノウカ (*Perkinsiella saccharicida*)、*Tagosodes orizicolus* 等のウンカ科 (Delphacidae)；ツマグロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*)、ジャガイモヒメヨコバイ (*Empoasca fabae*)、コーンリーフホッパー (*Dalbulus maidis*)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*) 等のヨコバイ科 (Cicadellidae)；*Mahanarva posticata*、*Mahanarva fimbriolata* 等のコガシラアワフキムシ科 (Cercopidae)；マメクロアブラムシ (*Aphis fabae*)、ダイズアブラムシ (*Aphis glycines*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、ヨーロッパリンゴアブラムシ (*Aphis pomi*)、ユキヤナギアブラムシ (*Aphis spiraeicola*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ムギワラギクオマルアブラムシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、Rosy apple aphid (*Dysaphis plantaginea*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lipaphis erysimi*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、レタスヒゲナガアブラムシ (*Nasonovia ribisnigri*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhopalosiphum padi*)、トウモロコシアブラムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、ミカンクロアブ

ラムシ (*Toxoptera citricida*)、モモコフキアブラムシ (*Hyalopterus pruni*)、ヒエノアブラムシ (*Melanaphis sacchari*)、オカボノクロアブラムシ (*Tetraneura nigri abdominalis*)、カンシャワタアブラムシ (*Ceratovacuna lanigera*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*) 等のアブラムシ科 (*Aphididae*) ; ブドウネアブラムシ (*Daktulosphaira vitifoliae*)、Pecan phylloxera (*Phylloxera devastatrix*)、Pecan leaf phylloxera (*Phylloxera notabilis*)、Southern pecan leaf phylloxera (*Phylloxera russellae*) 等のネアブラムシ科 (*Phylloxeridae*) ; ツガカサアブラムシ (*Adelges tsugae*)、*Adelges piceae*、ヒメカサアブラムシ (*Aphrastasia pectinatae*) 等のカサアブラムシ科 (*Adelgidae*) ; イネクロカメムシ (*Scotinophara lurida*)、Malayan rice black bug (*Scotinophara coarctata*)、アオクサカメムシ (*Nezara antennata*)、トゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris aeneus*)、オオトゲシラホシカメムシ (*Eysarcoris lewisi*)、シラホシカメムシ (*Eysarcoris ventralis*)、ムラサキシラホシカメムシ (*Eysarcoris annamita*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、Brown stink bug (*Euschistus heros*)、Red banded stink bug (*Piezodorus guildinii*)、*Oebalus pugnax*、*Dichelops melacanthus* 等のカメムシ科 (*Pentatomidae*) ; Burrower brown bug (*Scaptocoris castanea*) 等のツチカメムシ科 (*Cydnidae*) ; ホソヘリカメムシ (*Riptortus pedestris*)、クモヘリカメムシ (*Leptocorisa chinensis*)、ホソクモヘリカメムシ (*Leptocorisa acuta*) 等のホソヘリカメムシ科 (*Alydidae*) ; ホソハリカメムシ (*Cletus punctiger*)、アシビロヘリカメムシ (*Leptoglossus australis*) 等のヘリカメムシ科 (*Coreidae*) ; カンシャコバネナガカメムシ (*Caverelius saccharivorus*)、コバネヒョウタンナガカメムシ (*Togo hemipterus*)、アメリカコバネナガカメムシ (*Blissus leucopterus*) 等のナガカメムシ科 (*Lygaeidae*) ; アカヒゲホソミドリカスミカメ (*Trigonotylus caelestialium*)、アカスジカスミカメ (*Stenotus rubrovittatus*)、フタトゲムギカスミカメ (*Stenodema calcarata*)、サビイロカスミカメ (*Lygus lineolaris*) 等のカスミカメムシ科 (*Miridae*) ; オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ミカンコナジラミ (*Dialeurodes citri*)、ミカントゲコナジラミ (*Aleurocanthus spiniferus*)、チャトゲコナジラミ (*Aleurocanthus camelliae*)、ヒサカキワタフキコナジラミ (*Pealius euryae*) 等のコナジラミ科 (*Aleyrodidae*) ; シュロマルカイガラムシ (*Abgrallaspis cyanophylli*)、アカマルカイガラムシ (*Aonidiella aurantii*)、ナシマルカイガラムシ (*Diaspidiotus perniciosus*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanonensis*)、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri*) 等のマルカイガラムシ科 (*Diaspididae*) ; ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*) 等のカタカイガラムシ科 (*Coccidae*) ; イセリアカイガラムシ (*Icerya purchasi*)、キイロワタフキカイガラムシ (*Icerya seychellarum*) 等のワタフキカイガラムシ科 (*Margarodidae*) ; ナスコナカイガラムシ (*Phenacoccus solani*)、クロテンコナカイガラムシ (*Phenacoccus solenopsis*)、フジコナカイガラムシ (*Planococcus kraunhiae*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ミカンコナカイガラムシ (*Planococcus citri*)、ガハニコナカイガラムシ (*Pseudococcus calceolariae*)、ナガオコナカイガラムシ (*Pseudococcus longispinus*)、タトルミーリーバグ (*Brevennia rehi*) 等のコナカイガラムシ科 (*Pseudococcidae*) ; ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ミカントガリキジラミ (*Trioza erytrae*)、ナシキジラミ (*Cacopsylla pyrisuga*)、チュウゴクナシキジラミ (*Cacopsylla chinensis*)、ジャガイモトガリキジラミ (*Bactericera cockerelli*)、Pear psylla (*Cacopsylla pyricola*) 等のキジラミ科 (*Psyllidae*) ; プラタナスグンバイ (*Corythucha ciliata*)、アワダチソウグンバイ (*Corythucha marmorata*)、ナシグンバイ (*Stephanitis nashi*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyrioides*) 等のグンバイムシ科 ; トコジラミ (*Cimex lectularius*) 等のトコジラミ科 (*Cimicidae*) 及び Giant Cicada (*Quesada gigas*) 等のセミ科 (*Cicadidae*) }。

甲虫目害虫 (Coleoptera) { 例えば、ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgif*

era virgifera)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ノザンコーンルートワーム (*Diabrotica barberi*)、メキシカンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera zea*)、バンデッドキューカンパービートル (*Diabrotica balteata*)、Cucurbit Beetle (*Diabrotica speciosa*)、ビーンリーフビートル (*Cerotoma trifurcata*)、クビアカクビホソハムシ (*Oulema melanopus*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、Cabbage flea beetle (*Phyllotreta cruciferae*)、Western black flea beetle (*Phyllotreta pusilla*)、Cabbage stem flea beetle (*Psylliodes chrysocephala*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、グレープ・コラスピス (*Colaspis brunnea*)、コーン・フレアビートル (*Chaetocnema pulicaria*)、サツマイモヒサゴトビハムシ (*Chaetocnema confinis*)、ポテト・フレアビートル (*Epitrix cucumeris*)、イネトゲハムシ (*Di cladispa armigera*)、southern corn leaf beetle (*Myochrous denticollis*)、ヨツモンカメノコハムシ (*Lacoptera quadrimaculata*)、タバコノミハムシ (*Epitrix hirtipennis*) 等のハムシ科 (*Chrysomelidae*) ; Seedcorn beetle (*Stenolophus lecontei*)、Slender seedcorn beetle (*Clivina impressifrons*) 等のオサムシ科 (*Carabidae*) ; ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*)、アオドウガネ (*Anomala albopilosa*)、マメコガネ (*Popillia japonica*)、ナガチャコガネ (*Heptophylla picea*)、European Chafer (*Rhizotrogus majalis*)、クロマルコガネ (*Tomarus gibbosus*)、Holotrichia属 (*Holotrichia* spp.)、ジューン・ビートル (*Phyllophaga crinita*) 等のPhyllophaga属 (*Phyllophaga* spp.)、Diloboderus abderus等のDiloboderus属 (*Diloboderus* spp.) 等のコガネムシ科 (*Scarabaeidae*) ; ワタミヒゲナガゾウムシ (*Araecerus coffeae*)、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*)、イモゾウムシ (*Euscepes postfasciatus*)、アルファルフアタコゾウムシ (*Hypera postica*)、コクゾウムシ (*Sitophilus zeamais*)、イネゾウムシ (*Echinocnemus squameus*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、シロスジオサゾウムシ (*Rhabdoscelus lineatocollis*)、ワタミハナゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus*)、Southern Corn Billbug (*Sphenophorus callosus*)、Soybean stalk weevil (*Sternechus subsignatus*)、Sugarcane weevil (*Sphenophorus levis*)、サビヒョウタンゾウムシ (*Scepticus griseus*)、トビイロヒョウタンゾウムシ (*Scepticus uniformis*)、ブラジルマメゾウムシ (*Zabrotes subfasciatus*)、マツノキクイムシ (*Tomicus piniperda*)、Coffee Berry Borer (*Hypothenemus hampei*)、Aracanthus mourei等のAracanthus属 (*Aracanthus* spp.)、cotton root borer (*Eutinobothrus brasiliensis*)等のゾウムシ科 (*Curculionidae*) ; コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、ヒラタコクヌストモドキ (*Tribolium confusum*) 等のゴミムシダマシ科 (*Tenebrionidae*) ; ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のテントウムシ科 (*Coccinellidae*) ; ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*) 等のナガシンクイムシ科 (*Bostrychidae*) ; ヒョウホンムシ科 (*Ptinidae*) ; ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、Migdolus fryanus等のカミキリムシ科 (*Cerambycidae*) ; オキナワカンシャクシコメツキ (*Melanotus okinawensis*)、トビイロムナボソコメツキ (*Agriotes fuscicollis*)、クシコメツキ (*Melanotus legatus*)、アシプトコメツキ属 (*Anchastus* spp.)、コノデルス属 (*Conoderus* spp.)、クテニセラ属 (*Ctenicera* spp.)、リモニウス属 (*Limonium* spp.)、Aeolus属 (*Aeolus* spp.) 等のコメツキムシ科 (*Elateridae*) ; アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 等のハネカクシ科 (*Staphylinidae*) }。

総翅目害虫 (*Thysanoptera*) { 例えば、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、チャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、モトジロアザミウマ (*Echinothrips americanus*) 等のアザミウマ科 (*Thripidae*) ; イネクダア

ザミウマ (*Haplothrips aculeatus*) 等のクダアザミウマ科 (*Phlaeothripidae*) }。

双翅目害虫 (*Diptera*) { 例えば、タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*) 等のハナバエ科 (*Anthomyiidae*) ; シュガービートルートマゴット (*Tetanops myopaeformis*) 等のハネフリバエ科 (*Ulidiidae*) ; イネハモグリバエ (*Agromyza oryzae*)、トマトハモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、ナモグリバエ (*Chromatomyia horticola*) 等のハモグリバエ科 (*Agromyzidae*) ; イネキモグリバエ (*Chlorops oryzae*) 等のキモグリバエ科 (*Chloropidae*) ; ウリミバエ (*Bactrocera cucurbitae*)、ミカンコミバエ (*Bactrocera dorsalis*)、ナスミバエ (*Bactrocera latifrons*)、オリーブミバエ (*Bactrocera oleae*)、クインスランドミバエ (*Bactrocera tryoni*)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*) 等のミバエ科 (*Tephritidae*) ; イネヒメハモグリバエ (*Hydrellia griseola*)、トウヨウイネクキミギワバエ (*Hydrellia philippina*)、イネクキミギワバエ (*Hydrellia sasakii*) 等のミギワバエ科 (*Ephydriidae*) ; オウトウショウジョウバエ (*Drosophila suzukii*) 等のショウジョウバエ科 ; オオキモンノミバエ (*Megaselia spiracularis*) 等のノミバエ科 (*Phoridae*) ; オオチョウバエ (*Clogmia albipunctata*) 等のチョウバエ科 ; チビクロバネキノコバエ (*Bradysia difformis*) 等のクロバネキノコバエ科 (*Sciaridae*) ; ヘシアンバエ (*Mayetiola destructor*)、イネノシントメタマバエ (*Orseolia oryzae*) 等のタマバエ科 (*Cecidomyiidae*) ; *Diopsis macrophthalma* 等のシュモクバエ科 (*Diopsidae*) ; キリウジガガンボ (*Tipula aino*)、Common crane fly (*Tipula oleracea*)、European crane fly (*Tipula paludosa*) 等のガガンボ科 (*Tipulidae*) }。

膜翅目害虫 (*Hymenoptera*) { 例えば、カブラハバチ (*Athalia rosae*)、ニホンカブラバチ (*Athalia japonica*) 等のハバチ科 (*Tenthredinidae*) ; ファイヤールアント (*Solenopsis spp.*) 科、Brown leaf-cutting ant (*Atta capiguara*) 等のアリ科 (*Formicidae*) 等 }。

直翅目害虫 (*Orthoptera*) { 例えば、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、モロッコトビバッタ (*Doclostaurus maroccanus*)、オーストラリアトビバッタ (*Chortoicetes terminifera*)、アカトビバッタ (*Nomadacris septemfasciata*)、Brown Locust (*Locustana pardalina*)、Tree Locust (*Anacridium melanorhodon*)、Italian Locust (*Calliptamus italicus*)、Differential grasshopper (*Melanoplus differentialis*)、Two striped grasshopper (*Melanoplus bivittatus*)、Migratory grasshopper (*Melanoplus sanguinipes*)、Red-Legged grasshopper (*Melanoplus femurrubrum*)、Clearwinged grasshopper (*Camnula pellucida*)、サバクワタリバッタ (*Schistocerca gregaria*)、Yellow-winged locust (*Gastrimargus musicus*)、Spur-throated locust (*Austracris guttulosa*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*)、ハネナガイナゴ (*Oxya japonica*)、タイワンツチイナゴ (*Patanga succincta*) 等のバッタ科 (*Acrididae*) ; ケラ (*Gryllotalpa orientalis*) 等のケラ科 (*Gryllotalpidae*) ; ヨーロッパイエコオロギ (*Acheta domestica*)、エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*) 等のコオロギ科 (*Gryllidae*) ; Mormon cricket (*Anabrus simplex*) 等のキリギリス科 (*Tettigoniidae*) }。

ゴキブリ目害虫 (*Blattodea*) { 例えば、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 等のチャバネゴキブリ科 (*Blattellidae*) ; クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*)、コワモンゴキブリ (*Periplaneta australasiae*) 等のゴキブリ科 (*Blattidae*) ; ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、アメリカカンザイシロアリ (*Incisitermes minor*)、ダイコクシロアリ (*Cryptotermes domesticus*)、タイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*)、コウシュンシロアリ (*Neotermes koshunensis*)、サツマシロアリ (*Glyptotermes satsumensis*)、ナカジマシロアリ (*Glyptotermes nakajimai*)、カタンシロアリ (*Glyptotermes fuscus*)、オオシロアリ (*Hodotermopsis sjostedti*)、コウシュウイエシロアリ (

10

20

30

40

50

Coptotermes guangzhouensis)、アマミシロアリ (*Reticulitermes amamianus*)、ミヤタケシロアリ (*Reticulitermes miyatakei*)、カンモンシロアリ (*Reticulitermes kanmonensis*)、タカサゴシロアリ (*Nasutitermes takasagoensis*)、ニトベシロアリ (*Pericapritermes nitobei*)、ムシャシロアリ (*Sinocapritermes mushae*)、*Cor nitermes cumulans*等のシロアリ科 (*Termitidae*) }。

ダニ目害虫 (*Acari*) { 例えば、ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、ミツユビナミハダニ (*Tetranychus evansi*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、オリゴニカス属 (*Oligonychus spp.*) 等のハダニ科 (*Tetranychidae*) ; ミカンサビダニ (*Aculops pelek assi*)、リュウキュウミカンサビダニ (*Phyllocoptruta citri*)、トマトサビダニ (*Aculops lycopersici*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theavagrans*)、ニセナシサビダニ (*Eriophyes chibaensis*)、リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*)、カキサビダニ (*Aceria diospyri*)、*Aceria tosicella*、シソサビダニ (*Shevtchenkella sp.*) 等のフシダニ科 (*Eriophyidae*) ; チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) 等のホコリダニ科 (*Tarsonemidae*) ; ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*) 等のヒメハダニ科 (*Tenuipalpidae*) ; ケナガハダニ科 (*Tuckerellidae*) ; フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、タイワンカクマダニ (*Dermacentor taiwanensis*)、アメリカイヌカクマダニ (*Dermacentor variabilis*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツマダニ (*Ixodes persulcatus*)、ブラックレグドチック (*Ixodes scapularis*)、アメリカキララマダニ (*Amblyomma americanum*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) 等のマダニ科 (*Ixodidae*) ; ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescentiae*)、ホウレンソウケナガコナダニ (*Tyrophagus similis*) 等のコナダニ科 (*Acaridae*) ; コナヒョウヒダニ (*Dermatophagoides farinae*)、ヤケヒョウヒダニ (*Dermatophagoides pteronyssinus*) 等のチリダニ科 (*Pyroglyphidae*) ; ホソツメダニ (*Cheyletus eruditus*)、クワガタツメダニ (*Cheyletus malaccensis*)、ミナミツメダニ (*Cheyletus moorei*)、イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*) 等のツメダニ科 (*Cheyletidae*) ; ミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*)、ヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) 等のヒゼンダニ科 (*Sarcoptidae*) ; イヌニキビダニ (*Demodex canis*) 等のニキビダニ科 (*Demodicidae*) ; ズツキダニ科 (*Listrophoridae*) ; イエササラダニ科 (*Haplochthoniidae*) ; イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、トリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*) 等のオオサシダニ科 (*Macronyssidae*) ; ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ科 (*Dermanyssidae*) ; アカツツガムシ (*Leptotrombidium akamushi*) 等のツツガムシ科 (*Trombiculidae*) 等 }。

植物寄生性線虫 { 例えば、イネシンガレセンチュウ (*Aphelenchoides besseyi*)、イチゴセンチュウ (*Aphelenchoides fragariae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides rizemabosi*)、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) 等の葉線虫目 (*Aphelenchida*) 線虫、ジャガイモシロシストセンチュウ (*Globodera pallida*)、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*)、ムギシストセンチュウ (*Heterodera avenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*)、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、リンゴネコブセンチュウ (*Meloidogyne mali*)、ミナミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus coffeae*)、ノコギリネグサレセンチュウ (*Pratylenchus drenatus*)、チャネグサレセンチュウ (*Pratylenchus loosi*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)、カンキツネモグリセンチュウ (*Radopholus citrophilus*)、バナナネモグリセンチ

10

20

30

40

50

ユウ (*Radopholus similis*) 等のハリセンチュウ目 (Tylenchida) }。

【 0 0 7 8 】

本発明の化合物は、さらに、衛生害虫、貯穀害虫、衣類害虫、家屋害虫、寄生虫などの有害生物の防除にも使用できる。特に人獣に害をなす有害な無脊椎生物に対する防除効果にも優れ、これらの有害生物を本発明中において、動物寄生性害虫と定義する。防除の対象となる動物寄生性害虫としては、宿主動物の背、脇下、下腹部、内股部などに寄生して動物・鳥類から血液やフケなどの栄養源を得て生息するもの、および宿主動物の背、臀部などに飛来して動物・鳥類から血液やフケなどの栄養源を得て生息するものを包含する。動物寄生性害虫としては、ダニ類、シラミ類、ノミ類などが挙げられる。

【 0 0 7 9 】

本発明の防除剤が有効な宿主動物としては、ヒト、イヌ、ネコ、マウス、ラット、ハムスター、モルモット、リス、ウサギ、フェレット；愛玩鳥（例えば、ハト、オウム、九官鳥、文鳥、インコ、ジュウシマツ、カナリア）；ウシ、ウマ、ブタ、ヒツジ、ヤギ；家禽（例えば、アヒル、ニワトリ、ウズラ、ガチョウ）；ミツバチ（例えば、セイヨウミツバチ、ニホンミツバチ）；などが挙げられる。

【 0 0 8 0 】

すなわち、本発明の有害生物防除剤は、前記の動物・鳥類を保護対象とした動物寄生性害虫防除剤として有効である。

【 0 0 8 1 】

対象となるダニ類 (Acari) としては以下の害虫が挙げられる。
 中気門目 (Mesostigmata) のダニ類 (mite) { 例えば、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) 等のワクモ科 (*Dermanyssidae*) ; イエダニ属 (*Ornithonyssus* spp.) のトリサシダニ (*Ornithonyssus sylviarum*)、ネッタイトリサシダニ (*Ornithonyssus bursa*)、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*) を含むオオサシダニ科 (*Macronyssidae*) のダニ ; トゲダニ属種 (*Laelaps* spp.) のネズミトゲダニ (*Laelaps echidninus*)、ホクマントゲダニ (*Laelaps jettmari*)、ミツバチトゲダニ (*Tropilaelaps clarae*) を含むトゲダニ科 (*Laelapidae*) のダニ ; ヘギダニ属種 (*Varroa* spp.) のミツバチヘギイタダニ (*Varroa destructor*)、バロアジャコブソニ (*Varroa jacobsoni*)、バロアアンデルウッドイ (*Varroa underwoodi*) を含むヘギダニ科 (*Varroidae*) のダニ }。
 後気門目 (Metastigmata) のマダニ類 (tick) { 例えば、ナガヒメダニ属種 (*Argas* sp.) のナガヒメダニ (*Argas persicus*)、アルガス・リフレクサス (*Argas reflexus*)、ヒメダニ属種 (*Ornithodoros* spp.) のオルニトドラス・モウバータ (*Ornithodoros moubata*) を含むヒメダニ科 (*Argasidae*) のマダニ ; チマダニ属種 (*Haemaphysalis* spp.) のヘマフィサリス・コンシナ (*Haemaphysalis concinna*)、ヘマフィサリス・パンクタータ (*Haemaphysalis punctata*)、ヘマフィサリス・シンアバリナ (*Haemaphysalis cinnabarina*)、ヘマフィサリス・オトフィラ (*Haemaphysalis otophila*)、ヘマフィサリス・レアチ (*Haemaphysalis leachi*)、フタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*)、マゲシマチマダニ (*Haemaphysalis mageshimaensis*)、イエンチマダニ (*Haemaphysalis yeni*)、ツリガネチマダニ (*Haemaphysalis campanulata*)、クロウサギチマダニ (*Haemaphysalis pentalagi*)、キチマダニ (*Haemaphysalis flava*)、オオトゲチマダニ (*Haemaphysalis megapinosa*)、ヤマトチマダニ (*Haemaphysalis japonica*)、ダグラスチマダニ (*Haemaphysalis douglasi*)、キララマダニ属種 (*Amblyomma* spp.) のアンブリオマ・アメリカナム (*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・バリエガタム (*Amblyomma variegatum*)、アンブリオマ・マキュラタム (*Amblyomma maculatum*)、アンブリオマ・ヘブラエウム (*Amblyomma hebraeum*)、アンブリオマ・カジェネンス (*Amblyomma cajennense*)、タカサゴキララマダニ (*Amblyomma testudinarium*)、マダニ属種 (*Ixodes* spp.) のマダニ (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ヘキサゴナス (*Ixodes hexagonus*)、イクソデス・キャニスガ (*Ixodes canisuga*)、イクソデス・ピロサス (*Ixodes pilosus*)、イクソデス・ルビキュンダス (*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカプラリス (*Ixodes scap*

10

20

30

40

50

ularis)、イクソデス・ホロシクルス (*Ixodes holocyclus*)、ヤマトマダニ (*Ixodes ovatus*)、シュルツェマダニ (*Ixodes persulcatus*)、タネガタマダニ (*Ixodes nipponensis*)、ウシマダニ亜属種 (*Boophilus* spp.) のオウシマダニ (*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*)、リピセファラス (ブーフィラス)・デコロラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*)、リピセファラス (ブーフィラス)・アニュラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) annulatus*)、リピセファラス (ブーフィラス)・カルセラタス (*Rhipicephalus (Boophilus) calceratus*)、コイタマダニ属種 (*Rhipicephalus* spp.) のリピセファラス・エベルトシ (*Rhipicephalus evertsi*)、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファラス・ブルサ (*Rhipicephalus bursa*)、リピセファラス・アッペンディキュラタス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファラス・キャペンシス (*Rhipicephalus capensis*)、リピセファラス・ツラニカス (*Rhipicephalus turanicus*)、リピセファラス・ザンベジエンシス (*Rhipicephalus zambeziensis*)、カクマダニ属種 (*Dermacentor* spp.) のデルマセントール・マルギナタス (*Dermacentor marginatus*)、デルマセントール・レティキュラタス (*Dermacentor reticulatus*)、デルマセントール・ピクタス (*Dermacentor pictus*)、デルマセントール・アルビピクタス (*Dermacentor albipictus*)、デルマセントール・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*)、デルマセントール・バリアビリス (*Dermacentor variabilis*) を含むマダニ科 (*Ixodidae*) のダニ}。

10

無気門目 (*Astigmata*) のコナダニ類 (*Acaridida*) { 例えばキュウセンヒゼンダニ属種 (*Psoroptidae* spp.) のヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*)、ウサギキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes cuniculi*)、ウマキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes equi*)、シヨクヒヒゼンダニ属種 (*Chorioptes* spp.) のシヨクヒヒゼンダニ (*Chorioptes bovis*)、オトデクテス属種 (*Otodectes* spp.) のミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*) を含むキュウセンヒゼンダニ科 (*Psoroptidae*) のダニ；ヒゼンダニ属種 (*Sarcoptes* spp.) のセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*)、イヌセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes canis*)、ウシセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes bovis*)、ヒツジセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes ovis*)、サルコプテス・ルピカブラエ (*Sarcoptes rupicaprae*)、ウマセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes equi*)、ブタセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes suis*)、ノトエドス属種 (*Notoedres* spp.) のネコシヨウセンコウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) を含むヒゼンダニ科 (*Sarcoptidae*) のダニ；トリアシヒゼンダニ属種 (*Knemidokoptes* spp.) のトリアシヒゼンダニ (*Knemidokoptes mutans*) を含むトリヒゼンダニ科 (*Knemidokoptidae*) のダニ}。

20

30

前気門目 (*Prostigmata*) のケダニ類 (*Actinedida*) { 例えばニキビダニ属種 (*Demodex* spp.) のイヌニキビダニ (*Demodex canis*)、ウシニキビダニ (*Demodex bovis*)、ヒツジニキビダニ (*Demodex ovis*)、ヤギニキビダニ (*Demodex caprae*)、ウマニキビダニ (*Demodex equi*)、デモデックス・カバリ (*Demodex caballi*)、ブタニキビダニ (*Demodex suis*)、ネコニキビダニ (*Demodex cati*) を含むニキビダニ科 (*Demodixidae*) のダニ；ツツガムシ属種 (*Trombicula* spp.) のトロンビキュラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、トロンビキュラ・アカムシ (*Trombicula akamushi*) を含むツツガムシ科 (*Trombiculidae*) }。

40

シラミ類 (*Phthiraptera*) としては以下の害虫が挙げられる。

シラミ亜目 (*Anoplura*) のシラミ類 (*louse*) { 例えばブタジラミ属種 (*Haematopinus* spp.) のウマジラミ (*Haematopinus asini*)、ウシジラミ (*Haematopinus eurysterus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*) を含むケモノジラミ科 (*Haematopinidae*) のシラミ；リノグナツス属種 (*Linognathus* spp.) のイヌジラミ (*Linognathus setosus*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*)、リノグナサス・オビラス (*Linognathus ovillus*)、リノグナサス・オビフォルミス (*Linognathus oviformis*)、リノグナサス・ペダリス (*Linognathus pedalis*)、ヤギホソジラミ (*Linognathus stenopsis*)、ソレノポテス属種 (*Solenopotes* spp.) のケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) を含むケモノホソジラミ科 (*Linognathidae*) のシラミ}。

50

タンカクハジラミ亜目 (Amblycera)のハジラミ類 (biting louse) { 例えばメナカンツス属種 (Menacanthus spp.) のニワトリオオハジラミ (Menacanthus stramineus)、ニワトリツノハジラミ (Menacanthus cornutus)、ウスイロニワトリハジラミ (Menacanthus pallidulus)、例えばメノポン属種 (Menopon spp.) のニワトリハジラミ (Menopon gallinae) を含むタンカクハジラミ科 (Menoponidae) のハジラミ }。

チョウカクハジラミ亜目 (Ischnocera) のハジラミ類 (biting louse) { 例えばコランビコーラ属種 (Columbicola spp.) のハトナガハジラミ (Columbicola columbae)、クルクロトガステル属種 (Cuclotogaster spp.) のハバピロナガハジラミ (Cuclotogaster heterographus)、ゴニオデス属種 (Goniodes spp.) のカクアゴハジラミ (Goniodes dissimilis)、マルハジラミ (Goniodes gigas)、ヒメニワトリハジラミ (Goniodes gallinae)、リペウルス属種 (Lipeurus spp.) のニワトリナガハジラミ (Lipeurus caponis) を含むチョウカクハジラミ科 (Phloptoridae) のハジラミ；ボビコーラ属種 (Bovicola spp.) のウシハジラミ (Bovicola bovis)、ヒツジハジラミ (Bovicola ov is)、ボビコーラ・リンバータ (Bovicola limbata)、ヤギハジラミ (Bovicola caprae)、ウマハジラミ (Bovicola equi)、ケモノハジラミ属種 (Trichodectes spp.) のイヌハジラミ (Trichodectes canis)、フェリコーラ属種 (Felicola spp.) のネコハジラミ (Felicola subrostrata) を含むケモノハジラミ科 (Trichodectidae) のハジラミ }。

ノミ類 (Siphonaptera) としては以下の害虫が挙げられる。

例えばスナノミ属種 (Tunga spp.) のスナノミ (Tunga penetrans) を含むスナノミ科 (Tungidae) のノミ；イヌノミ属種 (Ctenocephalides spp.) のイヌノミ (Ctenocephalides canis)、ネコノミ (Ctenocephalides felis)、アルカエオプシラ属種 (Archaeopsylla spp.) のハリネズミノミ (Archaeopsylla erinacei)、ネズミノミ属種 (Xenopsylla spp.) の東洋ネズミノミ (Xenopsylla cheopis)、ヒトノミ属種 (Pulex spp.) のヒトノミ (Pulex irritans)、エチドノファガ属種 (Echidnophaga spp.) のニワトリフトノミ (Echidnophaga gallinacea) を含むヒトノミ科 (Pulicidae) のノミ；ナガノミ属種 (Ceratophyllus spp.) のトリノミ (Ceratophyllus gallinae)、ヤマトネズミノミ (Ceratophyllus anisus)、ノソプスルラス属種 (Nosopsyllus spp.) のヨーロッパネズミノミ (Nosopsyllus fasciatus) を含むナガノミ科 (Ceratophyllidae) のノミ；ホソノミ属種 (Leptopsylla spp.) のメクラネズミノミ (Leptopsylla segnis) を含むホソノミ科 (Leptopsyllidae) のノミ。

その他にも、対象となる動物寄生性害虫としては、半翅目 (Hemiptera) の害虫が挙げられる。半翅目 (Hemiptera) の害虫としては以下の害虫が挙げられる。例えば、シメックス属種 (Cimex spp.) のトコジラミ (Cimex lectularius) を含むトコジラミ科 (Cimicidae) の昆虫；パンストロンギラス属種 (Panstrongylus spp.)、ロドニウス属種 (Rhodnius spp.) のベネズエラサシガメ (Rhodnius prolixus)、サシガメ属種 (Triatoma spp.) のサシガメ (Triatoma infestans) を含むサシガメ科 (Reduviidae) の昆虫。

その他にも、刺咬性昆虫 (咀嚼性ハエ、吸血成虫ハエ、移動性双翅類の幼虫、寄生バエのウジ) である双翅目 (Diptera) 害虫にも有効である。ハエ類 (Diptera) の害虫としては以下の害虫が挙げられる。長角亜目 (Nematocera) { 例えば (a) イエカ属種 (Culex spp.) のネッタイエカ (Culex quinquefasciatus)、アカイエカ (Culex pipiens pallens)、キュレックス・タルサリス (Culex tarsalis)、チカイエカ (Culex pipiens molestus)、ネッタイエカ (Culex pipiens fatigans)、コガタアカイエカ (Culex tritaeniorhynchus summorosus)、アルミゲレス属種 (Armigeres spp.) のオオクロヤブカ (Armigeres subalbatus)、ハマダラカ属種 (Anopheles spp.) のガンビアハマダラカ (Anopheles gambiae)、アノフェレス・マキュリペニス (Anopheles maculipennis)、シナハマダラカ (Anopheles sinensis)、オオツルハマダラカ (Anopheles lesteri)、ヤブカ属種 (Aedes spp.) のネッタイシマカ (Aedes aegypti)、ヒトスジシマカ (Aedes albopictus)、イーデス・タエニオリンクス (Aedes taeniorhynchus)、トウゴウヤブカ (Aedes togoi)、キンイロヤブカ (Aedes vexans nipponii) を含むカ科 (Culicidae) のカ； (b) ブユ属種 (Simulium spp.) のシムリウム・レブ

10

20

30

40

50

タンス (*Simulium reptans*)、ツメトゲブユ (*Simulium ornatum*)、ヒメアシマダラ
 ブユ (*Simulium venustum*)、ウマブユ (*Simulium salopiense*)、プロシムリウム属
 種 (*Prosimulium spp*) のキアシオオブユ (*Prosimulium yezoense*) を含むブユ科 (
Simuliidae) のブユ；クリコイデス属種 (*Culicoides spp.*) のニワトリヌカカ (*Culicoides arakawae*)、
 ウシシロフヌカカ (*Culicoides pictimargo*)、キブネヌカカ (*Culicoides kibunensis*)、セマダラヌカカ (*Culicoides homotomus*)、ウシヌカカ (*Culicoides oxystoma*)、ニッポンヌカカ (*Culicoides nipponensis*)、ホシヌカカ (*Culicoides punctatus*)、ミヤマヌカカ (*Culicoides maculatus*)、マツザワヌカカ (*Culicoides matsuzawai*) を含むヌカカ科 (*Ceratopogonidae*) のヌカカ。 }。短角亜目 {
 例えば、 (a) 例えばアブ属種 (*Tabanus spp.*) のタバヌス・プロミウス (*Tabanus bromius*)、
 タバヌス・スポドプテルス (*Tabanus spodopterus*)、タバヌス・アトラタ
 ス (*Tabanus atratus*)、タバヌス・スデチカス (*Tabanus sudeticus*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、アカウシアブ (*Tabanus chrysurus*)、シロフアブ (*Tabanus trigeminus*)、キスジアブ (*Tabanus fulvemedioides*)、イヨシロオピアブ (*Tabanus iyoensis*)、メクラアブ属種 (*Chrysops spp.*) のクリソプス・カエキュチエンス (*Chrysops caecutiens*)、クリソプス・レリクタス (*Chrysops relictus*)、キンメアブ (*Chrysops suavis*)、クロキンメアブ (*Chrysops japonicus*) を含むアブ科 (*Tabanidae*) のアブ；イエバエ属種 (*Muscina spp.*) のイエバエ (*Musca domestica*)、クロイ
 エバエ (*Musca bezzii*)、ノイエバエ (*Musca hervei*)、ウスイロイエバエ (*Musca conducens*)、オオイエバエ (*Musca stabulans*)、サシバエ属種 (*Stomoxys spp.*)
 のサシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、ノサシバエ属種 (*Haematobia spp.*) のノサシ
 バエ (*Haematobia irritans*)、ヘマトビア・イリタンス・エクシグア (*Haematobia irritans exigua*)、ヘマトビア・スティミュランス (*Haematobia stimulans*)、ヒメイ
 エバエ属種 (*Fannia spp.*) のヒメイエバエ (*Fannia canisularis*) を含むイエバエ科 (*Muscidae*) のハエ；シェシェバエ属種 (*Glossina spp.*) を含むツエツエバエ科 (*Glossinidae*) のハエ；メロファガス属種 (*Melophagus spp.*) のシラミバエ (*Melophagus ovinus*) を含むシラミバエ科 (*Hippoboscidae*) のハエ；クロバエ属種 (*Calliphora*) の
 、オオクロバエ (*Calliphora lata*) ；、キンバエ属種 (*Lucilia spp.*) のヒツジキンバ
 エ (*Lucilia (Phaenicia) cuprina*) ヒロズキンバエ (*Lucilia (Phaenicia) sericata*)
 、ミドリキンバエ (*Lucilia illustris*)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia spp.*) のラセ
 ンウジバエ (*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・クロロピガ (*Chrysomya chloropyga*)、クリソミア・ベジアナ (*Chrysomya bezziana*) を含むクロバエ科 (*Calliphoridae*) のハエ；カワモグリバエ亜科 (*Cuterebrinae*) のウサギヒフバエ属種 (*Cuterebra spp.*)、ウシバエ亜科 (*Hypodermatinae*) のさらにはウシバエ属種 (*Hypoderma spp.*) のウシバエ (*Hypoderma bovis*)、キスジウシバエ (*Hypoderma lineatum*)、ウマバエ亜科 (*Gasterophilinae*) のさらにはウマバエ属種 (*Gasterophilus spp.*) のウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*)、アトアカウマバエ (*Gasterophilus haemorroidalis*)、ガステロフィラス・イネルミス (*Gasterophilus inermis*)、ムネアカウマバエ (*Gasterophilus nasalis*)、ガステロフィラス・ニグリコルニス (*Gasterophilus nigricornis*)、アカウマバエ (*Gasterophilus pecorum*)、ヒツジバエ亜科 (*Oestrinae*) のさらにはヒツジバエ属種 (*Oestrus spp.*) のヒツジバエ (*Oestrus ovis*) を含むヒツジバエ科 (*Oestridae*) のハエ。

【 0 0 8 2 】

本発明の化合物を農園芸用害虫防除剤として用いる場合、本発明の化合物をそのまま用いても良いが、適当な固体担体、液体担体、ガス状担体等、界面活性剤、分散剤、その他の製剤用補助剤、等とともに混合して農薬製剤を調製して用いても良い。前記農薬製剤として、好ましくは、乳剤、EW剤、液剤、懸濁剤、水和剤、顆粒水和剤、粉剤、DL粉剤、粉粒剤、粒剤、錠剤、油剤、エアゾル、フロアブル剤、ドライフロアブル剤、マイクロカプセル剤、等を挙げる事ができる。これら農薬製剤として任意に選択される剤型として用いることができる。本発明での担体とは固体担体、液体担体、ガス状担体等を指す。

10

20

30

40

50

【 0 0 8 3 】

前記固体担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレー、カオリン、ケイソウ土、パーミキュライト、ホワイトカーボン、炭酸カルシウム、酸性白土、珪砂、珪石、ゼオライト、パーライト、アタパルジャイト、軽石、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウム、尿素等が挙げられる。

前記液体担体としては、例えば、メタノール、エタノール、n - ヘキサノール、エチレングリコール、プロピレングリコール等のアルコール類、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等のケトン類、n - ヘキサン、ケロシン、灯油等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸エチル等のエステル類、アセトニトリル、イソブチロニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等の酸アミド類、ダイズ油、綿実油等の植物油類、ジメチルスルホキシド、水等が挙げられる。

また、前記ガス状担体としてはL P G、空気、窒素、炭酸ガス、ジメチルエーテル等があげられる。

前記界面活性剤および前記分散剤としては、例えば、アルキル硫酸エステル類、アルキル(アリール)スルホン酸塩類、ポリオキシアルキレンアルキル(アリール)エーテル類、多価アルコールエステル類、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩のホルマリン縮合物、ポリカルボン酸塩、P O E ポリスチリルフェニルエーテル硫酸塩およびリン酸塩、P O E ・ P O P ブロックポリマー等が挙げられる。

さらに、前記製剤用補助剤としては、例えば、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルアルコール、キサントガム、化デンブ、アラビアガム、ポリビニルピロリドン、エチレン-アクリル酸共重合体、エチレン-酢酸ビニル共重合体、ポリエチレングリコール、流動パラフィン、ステアリン酸カルシウム、及び消泡剤、防腐剤等が挙げられる。

前記の各種担体、界面活性剤、分散剤、および製剤用補助剤は、必要に応じて各々単独で、あるいは組み合わせて用いることができる。

【 0 0 8 4 】

当該農薬製剤中における有効成分である本発明の化合物の含有量は、特に限定されないが、好ましくは、乳剤で1 ~ 75重量%、粉剤では0.3 ~ 25重量%、水和剤では1 ~ 90重量%、粒剤では0.1 ~ 10重量%である。

【 0 0 8 5 】

本発明の化合物をウシ、ブタなどの家畜類、イヌ、ネコなどのペット類の動物に寄生するダニ類の防除剤とする場合には、使用量は特に限定されないが、例えば、宿主動物1kgに対して、有効成分が、0.01 ~ 1000mgの割合となる量で使用することができる。

本発明の化合物は、公知の獣医学的手法で宿主動物へ施用することができる。その方法として、例えば、全身的抑制を目的とする場合には、錠剤、カプセル、浸漬液、飼料混入、坐薬、注射(筋肉内、皮下、静脈内、腹腔内など)などにより動物に投与方法などが挙げられ、非全身的抑制を目的とする場合は、油性または水性液剤を噴霧、注ぎかけ(pour-on)、滴下(spot-on)などにより投与方法、樹脂に本化合物を練り込み、該混練物を首輪、耳札などの適当な形状に成形し、それを動物に装着する方法などが挙げられる。

【 0 0 8 6 】

本発明による有害生物防除剤は、そのまま、または希釈して用いることができる。また、本発明による有害生物防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺菌剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合または併用することができる。混合または併用することができる薬剤としては、例えば、ペスティサイドマニュアル(第17版、The British Crop Protection Council発行)およびシブヤインデックス(SHIBUYA INDEX 第17版、2014年、SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP発行)およびアイラックモードオブア

10

20

30

40

50

クシオンクラシフィケーションスキーム (Mode of Action Classification Scheme Version 8 . 2 版、IRAC発行)、エフラックコードリスト(FRAC Code List (c)*2017: Fungicides sorted by mode of action、2017年度版、FRAC発行)に記載のものやインターネットで構造が特定できるもの (<http://www.alanwood.net/pesticides/sitemap.html>) が挙げられる。

【 0 0 8 7 】

より具体的には、殺虫剤は、例えば、アラニカルブ(alanycarb)、アルジカルブ(aldicarb)、ベンダイオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ブトカルボキシム(butocarboxim)、ブトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、ホルメタネート(formetanate)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロボキスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオフアノックス(thiofanox)、トリアザメート(triazamate)、トリメタカルブ(trimethacarb)、X M C、キシリルカルブ(xylylcarb)、メトルカルブ(metolcarb)、フェノチオカルブ(fenothiocarb)、フェノキシカルブ(fenoxycarb)のようなカーバメート系化合物、

アセフェート (acephate)、アザメチホス(azamethiphos)、アジンホス-エチル(azinphos-ethyl)、アジンホス-メチル(azinphos-methyl)、エチルチオメトン(ethylthiometon)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、カズサホス(cadusafos)、クロレトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルメホス(chlormephos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホスメチル(chlorpyrifos-methyl)、クマホス(coumaphos)、シアノホス(cyanophos)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、ダイアジノン(diazinon)、ジクロルボス (dichlorvos)、ジクロトホス(dicrotophos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、E P N、エチオン(ethion)、エトプロホス(etoprophos)、ファミフル(famphur)、フェナミホス(fenamifos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ヘプテノホス(heptenophos)、イミシアホス(imicyafos)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロピル=O-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート[isopropyl O-(methoxyaminothiophosphoryl)salicylate]、イソキサチオン(isoxathion)、マラチオン(malathion)、メカルバム(mecarbam)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレド(naled)、オメトエート(omethoate)、オキシジメトンエチル(dioxydemeton ethyl)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、P A P、ホレート(phorate)、ホサロン(phosalone)、ホスメット(phosmet)、ホスファミドン(phosphamidon)、ホキシム(phoxim)、ピリミホス-メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profenofos)、プロペタンホス(propetamphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、キナルホス(quinalphos)、スルホテップ(sulfotep)、テブピリミホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テルブホス(terbufos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、チオメトン(thiometon)、トリアゾホス(triazophos)、トリクロルホン(trichlorfon)、バミドチオン(vamidothion)、クロルピリホス-エチル(chlorpyrifos-ethyl)、ジスルフオトン(disulfoton)、スルプロホス(sulprofos)、フルピラゾホス(flupyrzophos)、フェントエート(phenthoate)、ホノホス(fonofos)、トリブホス(tribufos)のような有機リン酸エステル系化合物、

エンドスルファン(endosulfan)、アルファ-エンドスルファン(alpha-endosulfan)、ガンマ-H C H (gamma-HCH)、ジコホル(dicofol)、クロルデン(chlordane)、ディルドリン(diieldrin)、メトキシクロル(methoxyclor)のような有機塩素系化合物、

アセトプロール(acetoprole)、フィプロニル(fipronil)、エチプロール(ethiprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)、ピリプロール(pyriprole)、フルフィプロール(flufipro

10

20

30

40

50

le)のようなフェニルピラゾール系化合物、
 プロフラニリド(broflanilide)のようなメタジアミド系化合物、
 アフォキサネル(afoxolaner)、フルララネル(fluralaner)、サロラネル(sarolaner)、
 フルキサメタミド(fluxametamide)、ロティラネル(lotilaner)、イソシクロシラム(isocycloseram)のようなイソキサゾリン系化合物、
 アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、d-c i s-t r a n sアレスリン、
 d-t r a n sアレスリン(d-cis-trans allethrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、
 カッパ-ビフェントリン(kappa-bifenthrin)、ピオアレスリンS-シクロペンテニル(bioallethrin S-cyclopentenyl)、
 ピオレスメトリン(bioresmethrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、
 ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダ-シハロトリン(ramda-cyhalothrin)、
 ガンマ-シハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、アルファ-シペルメトリン(alpha-cypermethrin)、
 ベータ-シペルメトリン(beta-cypermethrin)、シータ-シペルメトリン(theta-cypermethrin)、ゼータ-シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、
 シフェノトリン(cyphenothrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エンペントリン(empenethrin)、
 エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(ethofenprox)、
 フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、
 フルメトリン(flumethrin)、タウ-フルバリネート(tau-fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、
 イミプロトリン(imiprothrin)、カデスリン(kadethrin)、ペルメトリン(permethrin)、
 フェノトリン(phenothrin)、ブラレトリン(prallethrin)、ピレトリン(pyrethrin)、
 レスメトリン(resmethrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、
 カッパ-テフルトリン(kappa-tefluthrin)、フタルスリン(phthalthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、
 トラロメトリン(tralomethrin)、トランスフルトリン(transfluthrin)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、
 メトフルトリン(metofluthrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ピレトラム(pyrethrum)、
 テラレトリン(terallethrin)、モンフルオロスリン(momfluorothrin)、ヘプタフルトリン(heptafluthrin)、
 メペルフルスリン(meperfluthrin)、テトラメチルフルスリン(tetramethylfluthrin)、ジメフルトリン(dimefluthrin)、
 クロロパラレスリン(chloroprallethrin)、イプシロン-メトフルスリン(ipsilon-metofluthrin)、
 イプシロン-モンフルオロスリン(ipsilon-momfluorothrin)、プロトリフェンブト(protrifenbut)のようなピレスロイド系化合物、
 アセタミプリド(acetamiprid)、クロチアニジン(chlothianidin)、ジノテフラン(dinotefuran)、
 イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、チアクロプリド(thiacloprid)、
 チアメトキサム(thiamethoxam)のようなネオニコチノイド化合物、
 スルホキサフロル(sulfoxaflor)のようなスルホキサミン系化合物、
 フルピラジフロン(flupyradifurone)のようなブテノライド系化合物、
 トリフルメゾピリム(triflumezopyrim)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)のようなメソイオン系化合物、
 フルピリミン(flupyrimin)のような2 - アミノピリジン系化合物
 スピノサド(spinosad)、スピネトラム(spinetoram)のようなスピノシン系化合物、
 アバメクチン(abamectin)、イベルメクチン(ivermectin)、エマメクチン安息香酸塩(emamectin benzoate)、
 ミルベメクチン(milbemectin)、レピメクチン(lepimectin)のようなマクロライド系化合物、
 ヒドロプレン(hydroprene)、キノプレン(quinoprene)、ジオフェノラン(Diofenolan)、
 メトプレン(methoprene)のような幼若ホルモン様化合物、
 ピリプロキシフェン(pyriproxifene)のような4-フェノキシフェノキシ系化合物、
 ピメトロジン(pymetrozine)のようなピリジンアゾメチン系化合物、
 フロニカミド(flonicamid)のようなピリジンカルボキサミド系化合物、
 エトキサゾール(ethoxazole)のようなオキサゾール系化合物、
 B.t. subsp. israelensis、B.t. subsp. aizawai、B.t. subsp. kurstaki、B.t. subsp. te

10

20

30

40

50

nebrionisのようなBacillus thuringiensisおよびBacillus sphaericus剤及びそれらが
 産生する殺虫性タンパク、

前記に該当するB t作物(Bacillus thuringiensisの毒素を産生する遺伝子を組み込み害
 虫抵抗性を持たせた遺伝子組み換え作物)が産生する殺虫性タンパク、

ジアフェンチウロン(diafenthiuron)のようなチオウレア系化合物、

アゾシクロチン(azocyclotin)、シヘキサチン(cyhexatin)、酸化フェンブタスズ(fenbut
 atin oxide)のような有機金属系化合物、

プロパルギット(propargite)のような亜硫酸エステル系・ジフェニルエーテル系化合物、

テトラジホン(tetradifon)のようなジフェニルスルホン系化合物、

クロルフェナビル(chlorfenapyr)、トラロピリル(tralopyril)のようなピロール系化合
 物、 10

D N O Cのようなジニトロ系化合物、

ベンスルタップ(bensultap)、カルタップ(cartap)、チオシクラム(thiocyclam)、チオス
 ルタップ(thiosultap)、チオスルタップ-ナトリウム(thiosultap sodium)のようなネラ
 イストキシン類縁体、

ビストリフルロン(bistrifluron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジフルベン
 ズロン(diflubenzuron)、フルシクロクスロン(flucyclooxuron)、フルフェノクスロン(fl
 ufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフエヌロン(lufenuron)、ノバル
 ロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron
)、トリフルムロン(triflumuron)、ビストリフルロン(bistrifluron)のようなベンゾイル
 ウレア系化合物、 20

ブプロフェジン(buprofezin)のようなチアジアジン系化合物、

シロマジン(cyromazine)のようなトリアゾール系化合物、

クロマフェノジド(chromafenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、メトキシフェノ
 ジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)のようなジアシルヒドラジン
 系化合物、

アミトラズ(amitraz)のようなアミジン系化合物、

ヒドラメチルノン(hydramethylnon)のようなアミジノヒドラゾン系化合物、

アセキノシル(acequinocyl)のようなナフトキノン系化合物、

フルアクリピリム(flucacrypyrim)、ピリミノストロビン(pyriminostrobin)、フルフェ
 ノキシストロビン(Flufenoxystrobin)のようなストロビルリン系化合物、 30

フェナザキン(fenazaquin)のようなキナゾリン系化合物、

フェンピロキシメート(fenpyroximate)のようなフェノキシピラゾール系化合物、

ピリミジフェン(pyrimidifen)のようなフェノキシエチルアミン系化合物、

ピリダベン(pyridaben)のようなピリダジノン系化合物、

テブフェンピラド(tebufenpyrad)、トルフェンピラド(tolfenpyrad)、ピフルブミド(py
 flubumide)のようなピラゾールカルボキサミド系化合物、

メタフルミゾン(metaflumizone)のようなヒドラジンカルボキサミド系化合物、

スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロテトラマト(spirotetaramat)、スピロメシ
 フェン(spiromesifen)、スピロピディオソ(spiropidion)のようなテトロン酸およびテト
 ラミン酸系化合物、 40

シフルメトフェン(cyflumetofen)、シエノピラフェン(cyenopyrafen)のようなベータ
 ケトニトリル系化合物、

フルベンジアミド(flubendiamide)のようなフタル酸アミド系化合物、

クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)、シアントラニリプロール(cyantranil
 iprole)、シクラニリプロール(cyclaniliprole)、テトラニリプロール(tetraniliprole)、
 シハロジアミド(cyhalodiamide)、テトラクロラントラニリプロール(tetrachlorantran
 iliprole)のようなアントラニル酸アミド系化合物、

キノメチオネート(quinomethionate)のようなキノキサリン系化合物、

ヘキシチアゾクス(hexythiazox)のようなチアゾリジノン系化合物、 50

ピフェナゼート(bifenazate)のようなヒドラジン系化合物、
フルフェネリム(flufenerim)のようなピリジナミン系化合物、
ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)のようなアミノキナゾリン系化合物、
フロメトキン(flometoquin)のような6-フェノキシキノリン系化合物、
フルオピラム(fluopyram)のようなピリジニルエチルベンズアミド系化合物、
フルアザインドリジン(fluzaindolizine)、アミドフルメト(amidoflumet)のようなスルホンアミド系化合物

チクロピラゾフロル(tylopyrazoflor)のようなピリジルピラゾール系化合物
チオキサザフェン(tioxazafen)のようなオキサジアゾール系化合物、
オキサゾスルフィル(oxazosulfyl)のようなベンゾオキサゾール系化合物
であり得る。

10

また、その他の殺虫剤として、ニコチン(nicotine)、クロロピクリン(chloropicrin)、フッ化スルフルル(sulfuryl fluoride)、クリロチエ(crylotie)、クロフェンテジン(clofentazine)、ジフロピダジン(diflovidazin)、ロテノン(rotenone)、インドキサカルブ(indoxacarb)、ピペロニルブトキシド(piperonyl butoxide)、クロルジメホルム(chlordimeform)、ピリダリル(pyridalyl)、アザジラクチン(azadirachtin)、ベンゾキシメート(benzoximate)、アフィドピロペン(afidopyropen)、フルヘキサホン(fluhexafon)、フルエンスルホン(fluensulfone)、ベンクロチアズ(benclothiaz)、カルゾール(carzole)、殺虫性石鹸、ジメヒポ(dimethypo)、ニチアジン(nithiazine)、ホウ酸塩(borate salt)、メタアルデヒド(metaaldehyde)、リアノジン(ryanodine)、スルフルラミド(sulfluramid)、アシノナピル(acynonapyr)、ベンズピリモキサン(benzpyrimoxan)、3-プロモ-N-(2,4-ジクロロ-6-(メチルカルバモイル)フェニルイル)-1-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミドのような化合物が挙げられる。更に、本発明による有害生物防除剤は、昆虫病原性バクテリア、昆虫病原性ウイルスおよび昆虫病原性菌類などのような微生物農薬とも、混用または併用することもできる。

20

【0088】

用いられる殺菌剤は、例えば、メタラキシル(metalaxyl)、メタラキシル-M(metalaxyl-M)、オキサジキシル(oxadixyl)、オフラセ(ofurase)、ベナラキシル(benalaxyl)、ベナラキシル-M(benalaxyl-M)、キララキシル(kiralaxyl)、オフラース(ofurace)、フララキシル(furalaxyl)、シプロフラン(cyprofuram)のようなフェニルアミド系化合物、
ブプリメート(bupyrimate)、ジメチリモール(dimethylimol)、エチリモール(ethylimol)のようなヒドロキシピリミジン系化合物、

30

ヒメキサゾール(hymexazole)、ヒドロキシイソキサゾール(hydroxyisoxazole)のようなイソキサゾール系化合物、

オキサチアピプロリン(oxathiapiprolin)のようなピペリジニルチアゾールイソキサゾリン系化合物、

オクチリノン(octhilinone)のようなイソチアゾロン系化合物、

オキシリニック酸(oxolinic acid)のようなカルボン酸系化合物、

ベノミル(benomyl)、チオファネートメチル(thiophanate-methyl)、カーベンダジム(carbendazole)、フベリダゾール(fuberidazole)、チアベンダゾール(thiabendazole)、デバカルブ(debacarb)のようなベンズイミダゾール・チオファネート系化合物、

40

ジエトフェンカルブ(diethofencarb)のようなN-フェニルカーバメート系化合物、

ゾキサミド(zoxamide)のようなトルアミド系化合物、

エタボキサム(ethaboxam)のようなエチルアミノチアゾールカルボキサミド系化合物、

ペンシクロン(pencycuron)のようなフェニルウレア系化合物、

フルオピコリド(fluopicolide)、フルオピモミド(fluopimomide)のようなピリジニルメチルベンズアミド系化合物、

ジフルメトリム(diflumetorim)、ブプリメート(bupirimate)、のようなピリミジンアミン系化合物、

ベノダニル(benodanil)、フルトラニル(flutolanil)、メプロニル(mepronil)のようなベ

50

ンズアニリド系化合物、
 イソフェタミド(isofetamid)のようなフェニルオキシエチルチオフェンアミド系化合物、
 フルオピラム(fluopyram)のようなピリジニルエチルベンズアミド系化合物、
 フェンフラム(fenfuram)のようなフランカルボキサミド系化合物、
 オキシカルボキシン(oxycarboxin)、カルボキシン(carboxin)のようなオキサチンカル
 ボキサミド系化合物、
 チフルザミド(thifluzamide)のようなチアゾールカルボキサミド系化合物、
 フルキサピロキサド(fluxapyroxad)、フラメトビル(furametpyr)、ペンフルフェン(pen
 flufen)、ペンチオピラド(penthiopyrad)、ベンゾピンジフルピル(benzovindiflupyr)
 、ピキサフェン(bixafen)、イソピラザム(isopyrazam)、セダキサン(sedaxane)、イン
 ピルフルキサム(inpyrfluxam)、フルインダピル(fluidapyr)、イソフルシプラム(isofl
 ucypram)、ピラプロポイン(pyrapropoyne)のようなピラゾール-4-カルボキサミド系化
 合物、
 ボスカリド(boscalid)のようなピリジニルカルボキサミド系化合物、
 アゾキシストロビン(azoxystrobin)、コウメトキシストロビン(coumetoxystrobin)、ク
 レソキシムメチル(kresoxym-methyl)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)、ピ
 コキシストロビン(picoxystrobin)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)、ジモキシス
 トロビン(dimoxystrobin)、メトミノストロビン(metominostrobin)、オリサストロビ
 ン(orysastrobin)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)、ピラオキシストロビン(pyr
 aoxystrobin)、ピラメトストロビン(pyrametostrobin)、フルフェノキシストロビン(fl
 ufenoxystrobin)、フェナミンストロビン(fenaminstrobin)、エノキサストロビン(eno
 xastrobin)、クモキシストロビン(coumoxystrobin)、マンデストロビン(mandestrobi
 n)、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)のようなストロビルリン系化合物、
 ファモキサドン(famoxadon)のようなオキサゾリジンジオン系化合物、
 フェンアミドン(fenamidone)のようなイミダゾリノン系化合物、
 トリクロピリカルブ(triclopyricarab)、ピリベンカルブ(pyribencarb)のようなベンジ
 ルカーバメート系化合物、
 シアゾファミド(cyazofamid)のようなシアノイミダゾール系化合物、
 アミスルブロム(amisulbrom)のようなスルファモイルトリアゾール系化合物、
 ビナパクリル(binapacryl)、メプチルジノカルブ(meptyldinocap)、ジノカップ(dinoca
 p)のようなジニトロフェニルクロトン系化合物、
 フルアジナム(fluzazinam)のような2,6-ジニトロアニリン系化合物、
 フェリムゾン(ferimzone)のようなピリミジノンヒドラゾン系化合物、
 酢酸-フェンチン(fentin-acetate)、塩化フェンチン(fentin chloride)、水酸化フェンチ
 ン(fentin hydroxide)、水酸化トリフェニルスズ(fenthin hydroxide)、酢酸トリフェニ
 ルスズ(fenthin acetate)、オキシン銅(oxine copper)のような有機・無機金属系化合物、
 シルチオフアム(silthiofam)のようなチオフェンカルボキサミド系化合物、
 アメトクトラジン(ametoctradin)のようなトリアゾロピリミジンアミン系化合物、
 メパニピリム(mepanipyrim)、ニトラピリン(nitrapyrin)、ピリメサニル(pyrimetha
 nil)、シプロジニル(cyprodinil)のようなアニリノピリミジン系化合物、プラストサイジ
 ンS(blasticidin-S)のようなエノピラヌロン酸抗生物質、
 カスガマイシン(kasugamycin)、カスガマイシン塩酸塩水和物(kasugamycin hydrochl
 oride hydrate)のようなヘキソピラノシル抗生物質、
 ストレプトマイシン(streptomycin)のようなグルコピラノシル抗生物質、
 オキシテトラサイクリン(oxytetracycline)のようなテトラサイクリン抗生物質、キノキ
 シフェン(quinoxyfen)のようなアリルオキシキノリン系化合物、
 プロキナジド(proquinazid)のようなキナゾリン系化合物、
 フルジオキシニル(fludioxonil)、フェンピクロニル(fenpiclonil)のようなシアノピロー
 ル系化合物、
 フルオロイミド(fluoroimid)、プロシミドン(procymidone)、イプロジオン(iprodione)

10

20

30

40

50

、ビンクロゾリン(vinchlozolin)のようなジカルボキシイミド系化合物、
 エジフェンホス(edifenphos)、イプロベンホス(iprobenfos)、ピラゾホス(pyrazophos)
 のようなホスホロチオレート系化合物、
 イソプロチオラン(isoprothiolane)のようなジチオラン系化合物、
 プロパモカルブ(propamocarb)、プロパモカルブ塩酸塩(propamocarb hydrochloride)
)のようなプロピルカーバメート系化合物、
 Bacillus subtilis (QST713、FZB24、MBI600、D747株) のようなBacillus属および
 産生された殺菌性タンパク類、および、
 前記B t 作物により産生された殺菌性タンパク類、
 ゴセイカユブテの抽出物のようなテルペン炭化水素類とテルペンアルコール類、
 トリホリン(triforine)のようなピペラジン系化合物、
 ピリフェノックス(pyrifenox)、ピリソキサゾール(pyrisoxazole)のようなピリジン系化
 合物、
 フェナリモル(fenarimol)、ヌアリモル (nuarimol)のようなピリミジン系化合物、
 アザコナゾール(azaconazole)、ブロムコナゾール(bromuconazole)、ジニコナゾール(
 diniconazole)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)、エポキシコナゾール(epoxycon
 azole)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、オキシポコナゾール(oxpoconazole)
 、ペフラゾエート(pefurazoate)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、フェンブコナ
 ザール(fenbuconazole)、イミベンコナゾール(imibenconazole)、イプコナゾール(ipc
 onazole)、メトコナゾール(metconazole)、テトラコナゾール(tetraconazole)、トリア
 ジメホン(triadimefon)、トリアジメノール(triadimenol)、トリチコナゾール(triticon
 azole)、ウニコナゾール(uniconazole)、イマザリル(imazalil)、ビテルタノール(bitert
 anol)、トリフルミゾール(triflumizole)、エタコナゾール(etaconazole)、プロピコナゾ
 ール(propiconazole)、ペンコナゾール(penconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、
 フルトリアホール(flutriafol)、ミクロブタニル(myclobutanil)、パクロブトラゾール(p
 aclobutrazol)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、シプロコナゾール(cyprocon
 azole)、テブコナゾール(tebuconazole)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)、プロクロ
 ラズ(prochloraz)、シメコナゾール(simeconazole)、イプフェントリフルコナゾール(ip
 fentrifluconazole)、メフェントリフルコナゾール (mefentrifluconazole) のような
 アゾール系化合物、
 アルジモルフ(aldimorph)、ドデモルフ(dodemorph)、酢酸ドデモルフ(dodemorph ac
 etate)、トリデモルフ(tridemorph)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、ジメトモ
 ルフ(dimethomorph)、フルモルフ(flumorph)、ピリモルフ(pyrimorph)のようなモル
 フォリン系化合物、
 ピペラリン(piperalin)、フェンプロピディン(fenpropidin)のようなピペリジン系化合物
 、
 スピロキサミン(spiroxamine)のようなスピロケタールアミン系化合物、
 フェンヘキサミド(fenhexamid)のようなヒドロキシアニリド系化合物、
 フェンピラザミン(fenpyrazamine)のようなアミノピラゾリノン系化合物、
 フェルバム(ferbam)、メタム(metam)、メタスルホカルブ(metasulphocarb)、メチラム
 (metiram)、チラム(thiram)、マンゼブ(mancozeb)、マンネブ(maneb)、ジネブ(zineb
)、ジラム(ziram)、ポリカーバメート(polycarbamate)、プロピネブ(propineb)、チウ
 ラム(thiuram)、ピリプチカルブ(pyributicarb)のようなチオカーバメート・ジチオカー
 バメート系化合物、
 バリダマイシン(validamycin)のようなグルコピラノシル抗生物質、
 ミルジオマイシン(mildiomycin)、ポリオキシシン(polyoxin)のようなヌクレオシド系抗生
 物質、
 ベンチアバリカルブ(benthiavalicarb)、ベンチアバリカルブイソプロピル(benthiavali
 carb-isopropyl)、バリフェナレート(valifenalate)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)
 のようなバリンアミドカーバメート系化合物、

10

20

30

40

50

マンジプロパミド(mandipropamid)のようなマンデル酸アミド系化合物、
 フェンピコキサミド(fenpicoxamid)、フロリルピコキサミド(florylpicoxamid)のよ
 うなピコリナミド系化合物、
 フサライド(ftthalide)のようなイソベンゾフラノン系化合物、
 ピロキロン(pyroquilon)のようなピロロキノリン系化合物、
 トリシクラゾール(tricyclazole)のようなトリアゾロベンゾチアゾール系化合物、
 カルプロパミド(carpropamid)のようなシクロプロパンカルボキサミド系化合物、
 ジクロシメット(diclocymet)のようなカルボキサミド系化合物、
 フェノキサニル(fenoxanil)のようなプロピオンアミド系化合物、
 アシベンゾラル S-メチル(acibenzolar-S-methyl)のようなベンゾチアジアゾール系化合
 物、 10
 プロベナゾール(probenazole)、ジクロベンチアゾクス(dichlobentiazox)のようなベン
 ゾイソチアゾール系化合物、
 チアジニル(tiadinil)のようなチアジアゾールカルボキサミド系化合物、
 イソチアニル(isotianil)のようなイソチアゾールカルボキサミド系化合物、
 シモキサニル(cymoxanil)のようなシアノアセトアミド=オキシム系化合物、
 ホセチル(fosetyl)のようなエチルホスホネート系化合物、
 テクロフタラム(techlophthalam)のようなフタラミン酸系化合物、
 トリアゾキシド(triazoxide)のようなベンゾトリアジン系化合物、
 フルスルファミド(flusulfamide)のようなベンゼンスルホン酸系化合物、 20
 ジクロメジン(diclomezine)のようなピリダジノン系化合物、
 シフルフェナミド(cyflufenamide)のようなフェニルアセトアミド系化合物、
 メトラフェノン(metrafenopne)のようなベンゾフェノン系化合物、
 ピリオフェノン(pyriofenone)のようなベンゾイルピリジン系化合物、
 フルチアニル(flutianil)のようなシアノメチレンチアゾリジン系化合物、
 テブフロキン(tebufloquin)のような 4-キノリル酢酸系化合物、
 イプフルフェノキン(ipflufenquin)のような 3-フェノキシキノリン系化合物、
 ホセチルアルミニウム(fosetyl-aluminium)、トルクロホス - メチル(tolclofos-methyl)
 のような有機リン系化合物、
 エクロメゾール(echlomezole)のような 1, 2, 4-チアジアゾール系化合物、 30
 トルプロカルブ(tolprocarb)のようなトリフルオロエチルカーバメート系化合物、
 ピジフルメトフェン(pydiflumetofen)のようなピラゾールカルボキサミド系化合物、
 ボルドー(Bordeaux)混合液、酢酸銅(copper acetate)、塩基性硫酸銅(basic copper su
 lfate)、オキシ塩化銅(oxy copper chloride)、水酸化第二銅(copper hydroxide)、オ
 キシキノリン銅(oxine-copper)のような銅系化合物、
 銅、硫黄のような無機化合物、
 キャプタン(captan)、カプタホール(captafol)、フォルペット(folpet)のような N - ハロ
 ゲノチオアルキル系化合物、
 アニラジン(anilazine)、クロロタロニル(chlorothalonil)、ジクロロフェン(dichlorop
 hen)、ペンタクロロフェノール(pentachlorophenol)及びその塩、ヘキサクロロベンゼ
 ン(hexachlorobenzene)、キントゼン(quintozene)のような有機塩素系化合物、 40
 イミノクタジン酢酸塩(iminoctadine triacetate salt)、イミノクタジンアルベシル酸塩
 (iminoctadine albesilate)、グアニジン(guanidine)、ドジン(dodine)、ドジン遊離塩
 基(dodine free base)、グアザチン(guazatine)、グアザチン酢酸塩(guazatine acetate
 salt)、アルベシレート(albesilate)のようなグアニジン系化合物、
 ジチアノン(dithianon)のようなアントラキノン系化合物、
 キノメチオネート(quinomethionate)のようなキノキサリン系化合物、
 フルオルイミド(fluoroimide)のようなマレイミド系化合物、
 トリルフルアニド(tolylfluanid)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)のようなスルフェ
 ン酸系化合物、 50

ジノブトン(dinobuton)のようなジニトロフェノール系化合物、
 ダゾメット(dazomet)のような環状ジチオカーバメート系化合物
 ピラジフルミド(pyraziflumid)のようなアニリド系化合物、
 アミノピリフェン(aminopyrifen)のようなニコチン酸エステル系化合物、
 メチルトetraプロール(metyltetraprole)のようなテトラゾリノン系化合物、
 ピリダクロメチル(pyridachlometry)のようなピリダジン系化合物
 があり得る。

また、その他の殺菌剤として、キノフメリン(quinofumelin)、ジピメチロン(dipym
 etitron)、ピカルブトラゾクス(picarbutrazox)、テクナゼン(tecnazen)、ニトルター
 ル-イソプロピル(nitrthal-isopropyl)、ジシクロメット(dicyclomet)、アシベンゾラル(
 acibenzolar)、プロヘキサジオン-カルシウム(prohexadione-calcium)、プロノポール(
 bronopol)、ジフェニルアミン(diphenylamine)、フルメトベル(flumetover)、ベント
 キサジン(bethoxazin)、ビフェニル(biphenyl)、クロロネブ(chloroneb)、C N A、ヨ
 ードカルブ(iodcarb)、プロチオカルブ(prothiocarb)などが挙げられる。

【0089】

本発明の化合物またはその農園芸上許容可能な酸付加塩は、その有効量を、植物、土壌
 に適用することにより、対象の有害生物の防除に使用することができる。その製剤中の有
 効成分量は0.01~90重量%である。水和剤、乳剤、懸濁剤、フロアブル剤、水溶剤
 、および顆粒水和剤は水で所望の濃度に希釈して、溶解液、懸濁液あるいは乳濁液の状態
 で、粉剤・粒剤はそのまま、植物あるいは土壌に散布することができる。また、本発明
 の化合物またはその農園芸上許容可能な酸付加塩を防疫用として使用する場合には、乳剤
 、水和剤、フロアブル剤等は水で所望の濃度に希釈して施用することができ、油剤、エア
 ゴール、煙霧剤、毒餌、防ダニシート等はそのまま使用することができる。

本願明細書において、「作物」とは栽培植物全般を指し、具体的には食用作物、飼料作
 物、緑肥作物、園芸作物(観賞植物を含む)、及び工芸作物を指す。

本発明は作物の活力を高める方法も含み、当該方法は本発明の化合物に作物若しくは作
 物の種子を接触させる工程を含む。また、本発明は作物の種子の製造方法も含み、当該方
 法は本発明の化合物に作物の種子を処理する工程を含む。

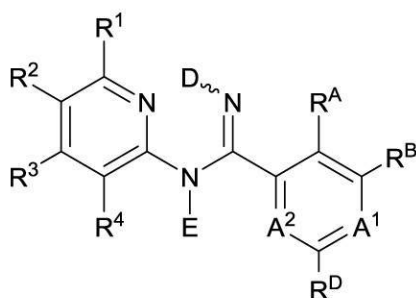
処理又は接触の対象が種子である場合、本発明の化合物またはその農園芸上許容可能な
 酸付加塩の量は限定されないが、処理後の種子重量に対し、有効成分量として約0.00
 01~約50重量%の量で本発明の化合物またはその農園芸上許容可能な酸付加塩が含ま
 れることが好ましい。

本発明によりさらに、本発明の化合物またはその酸付加塩の、動物・鳥類を動物寄生性
 害虫から保護する組成物の有効成分としての使用が提供される。該組成物は、本発明の化
 合物またはその酸付加塩を、殺寄生虫的に有効でありかつ対象である動物・鳥類に害を
 与えない量で、含む。本発明の化合物またはその酸付加塩は、有害生物またはその生育環境
 - 例えば動物・鳥類、作物、作物の種子、土壌など - に生物学的に有効な量で接触され、
 有害無脊椎生物を防除する。

【0090】

次に、本発明化合物の具体例を以下に示す。

【化14】



(1-3)

10

20

30

40

50

【 0 0 9 1 】

式(1)の G^1 が G^1-1 である式(1-3)において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 A^1 、 A^2 が表1に記載の置換基であり、 D が表2に記載の置換基であり、 E が表3に記載の置換基であり、 R^A が表4に記載の置換基であり、 R^B 、 R^D 、 R^E が表5に記載の置換基である組み合わせの本発明化合物。

【表1】

R^1	R^2	R^3	R^4	A^1	A^2
CF_3	H	H	H	N	$C-R^E$
CF_3CF_2	H	H	H	N	$C-R^E$
CF_3S	H	H	H	N	$C-R^E$
CF_3SO	H	H	H	N	$C-R^E$
CF_3SO_2	H	H	H	N	$C-R^E$
H	CF_3	H	H	N	$C-R^E$
H	CF_3CF_2	H	H	N	$C-R^E$
H	CF_3S	H	H	N	$C-R^E$
H	CF_3SO	H	H	N	$C-R^E$
H	CF_3SO_2	H	H	N	$C-R^E$
H	H	CF_3	H	N	$C-R^E$
H	H	CF_3CF_2	H	N	$C-R^E$
H	H	CF_3S	H	N	$C-R^E$
H	H	CF_3SO	H	N	$C-R^E$
H	H	CF_3SO_2	H	N	$C-R^E$
H	H	H	CF_3	N	$C-R^E$
H	H	H	CF_3CF_2	N	$C-R^E$
H	H	H	CF_3S	N	$C-R^E$
H	H	H	CF_3SO	N	$C-R^E$
H	H	H	CF_3SO_2	N	$C-R^E$

10

20

30

40

50

【表 2】

D
H
CH ₃
CH ₂ CN
CH ₂ CH ₂ CN
CH ₂ OCH ₃
CH ₂ OCH ₂ CH ₃
(C=O)CH ₃
(C=O)CF ₃
SO ₂ CH ₃
SO ₂ CF ₃
(C=O)OCH ₃
(C=O)Ph
(C=O)cPr

10

20

【表 3】

E
H
CH ₃
CH ₂ CN
CH ₂ CH ₂ CN
CH ₂ OCH ₃
CH ₂ OCH ₂ CH ₃
(C=O)CH ₃
(C=O)CF ₃
SO ₂ CH ₃
SO ₂ CF ₃
(C=O)OCH ₃
(C=O)Ph
(C=O)cPr
CH ₂ CH ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₃
CH ₂ SCH ₃
CH ₂ SO ₂ CH ₃
CH ₂ CH ₂ CN

30

40

50

【表 4】

R ^A
H
OMe
OEt
SEt
SOEt
SO ₂ Et
1H-pyrazol-1-yl
1H-imidazol-1-yl
1H-1,2,3-triazol-1-yl
1H-1,2,4-triazol-1-yl
2H-1,2,3-triazol-2-yl

10

20

30

40

50

【表 5】

R ^B	R ^D	R ^E
H	H	H
SEt	H	H
SOEt	H	H
SO ₂ Et	H	H
1H-pyrazol-1-yl	H	H
1H-imidazol-1-yl	H	H
1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H
1H-1,2,4-triazol-1-yl	H	H
2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H
H	SEt	H
H	SOEt	H
H	SO ₂ Et	H
H	1H-pyrazol-1-yl	H
H	1H-imidazol-1-yl	H
H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H
H	1H-1,2,4-triazol-1-yl	H
H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
H	H	SEt
H	H	SOEt
H	H	SO ₂ Et
H	H	1H-pyrazol-1-yl
H	H	1H-imidazol-1-yl
H	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl
H	H	1H-1,2,4-triazol-1-yl
H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl

10

20

30

【0092】

式(1)のG¹がG¹-1である式(1-3)において、R¹、R²、R³、R⁴、A¹、A²が表6に記載の置換基であり、Dが表2に記載の置換基であり、Eが表3に記載の置換基であり、R^Aが表4に記載の置換基であり、R^B、R^C、R^Dが表7に記載の置換基である組み合わせの本発明化合物。

40

【表 6】

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A ¹	A ²
CF ₃	H	H	H	C-R ^C	N
CF ₃ CF ₂	H	H	H	C-R ^C	N
CF ₃ S	H	H	H	C-R ^C	N
CF ₃ SO	H	H	H	C-R ^C	N
CF ₃ SO ₂	H	H	H	C-R ^C	N
H	CF ₃	H	H	C-R ^C	N
H	CF ₃ CF ₂	H	H	C-R ^C	N
H	CF ₃ S	H	H	C-R ^C	N
H	CF ₃ SO	H	H	C-R ^C	N
H	CF ₃ SO ₂	H	H	C-R ^C	N
H	H	CF ₃	H	C-R ^C	N
H	H	CF ₃ CF ₂	H	C-R ^C	N
H	H	CF ₃ S	H	C-R ^C	N
H	H	CF ₃ SO	H	C-R ^C	N
H	H	CF ₃ SO ₂	H	C-R ^C	N
H	H	H	CF ₃	C-R ^C	N
H	H	H	CF ₃ CF ₂	C-R ^C	N
H	H	H	CF ₃ S	C-R ^C	N
H	H	H	CF ₃ SO	C-R ^C	N
H	H	H	CF ₃ SO ₂	C-R ^C	N

10

20

30

40

50

【表 7 - 1】

R ^B	R ^C	R ^D
H	H	H
SEt	H	H
SOEt	H	H
SO ₂ Et	H	H
1H-pyrazol-1-yl	H	H
1H-imidazol-1-yl	H	H
1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H
1H-1,2,4-triazol-1-yl	H	H
2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H
H	SEt	H
H	SOEt	H
H	SO ₂ Et	H
H	1H-pyrazol-1-yl	H
H	1H-imidazol-1-yl	H
H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H
H	1H-1,2,4-triazol-1-yl	H
H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
H	Phenyl	H
H	2-Cl phenyl	H
H	3-Cl phenyl	H
H	4-Cl phenyl	H
H	2,4-dichlorophenyl	H
H	3,5-dichlorophenyl	H
H	2-methylphenyl	H
H	3-methylphenyl	H
H	4-methylphenyl	H
H	2-methoxyphenyl	H
H	3-methoxyphenyl	H
H	4-methoxyphenyl	H
H	2-(trifluoromethyl)phenyl	H
H	3-(trifluoromethyl)phenyl	H
H	4-(trifluoromethyl)phenyl	H
H	2-(trifluoromethoxy)phenyl	H

10

20

30

40

50

【表 7 - 2】

H	3-(trifluoromethoxy)phenyl	H
H	4-(trifluoromethoxy)phenyl	H
H	2-chloro-4-(trifluoromethyl)phenyl	H
H	2,4-bis(trifluoromethyl)phenyl	H
H	4-(heptafluoropropan-2-yl)phenyl	H
H	4-SO ₂ Me phenyl	H
H	4-SO ₂ CF ₃ phenyl	H
H	4-NMe ₂ phenyl	H
H	pyridin-2-yl	H
H	pyridin-3-yl	H
H	pyridin-4-yl	H
H	pyrimidin-2-yl	H
H	pyrimidin-5-yl	H
H	furan-2-yl	H
H	furan-3-yl	H
H	thiophen-2-yl	H
H	thiophen-3-yl	H
H	H	SEt
H	H	SOEt
H	H	SO ₂ Et
H	H	1H-pyrazol-1-yl
H	H	1H-imidazol-1-yl
H	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl
H	H	1H-1,2,4-triazol-1-yl
H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl

10

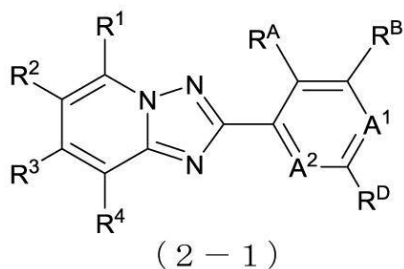
20

30

【0093】

式(2)のG²がG²-1である式(2-1)において、R¹、R²、R³、R⁴、A¹、A²が表1に記載の置換基であり、R^Aが表4に記載の置換基であり、R^B、R^D、R^Eが表5に記載の置換基である組み合わせの本発明化合物。

【化15】



40

【0094】

式(2)のG²がG²-1である式(2-1)において、R¹、R²、R³、R⁴、A¹、A²が表6に記載の置換基であり、R^Aが表4に記載の置換基であり、R^B、R^C、R^Dが表7に記載の置換基である組み合わせの本発明化合物。

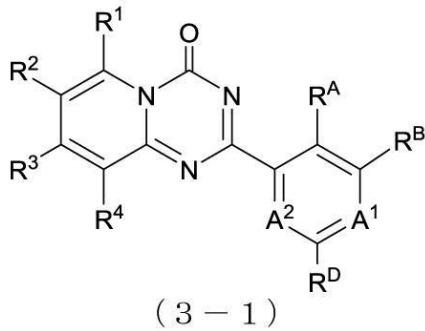
【0095】

式(3)のG²がG²-1である式(3-1)において、R¹、R²、R³、R⁴、A¹、A²が表1に記載の置換基であり、R^Aが表4に記載の置換基であり、R^B、R^D、R^E

50

が表 5 に記載の置換基である組み合わせの本発明化合物。

【化 1 6】



10

【0096】

式(3)のG²がG²-1である式(3-1)において、R¹、R²、R³、R⁴、A¹、A²が表6に記載の置換基であり、R^Aが表4に記載の置換基であり、R^B、R^C、R^Dが表7に記載の置換基である組み合わせの本発明化合物。

【0097】

<合成実施例>

以下、実施例を挙げて本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。NMRデータの「s」はシングレット(一重線)、「d」はダブルット(二重線)、「t」はトリプレット(三重線)、「q」はカルテット(四重線)、「m」はマルチプレット(多重線)、「broad」はブロード(幅広線)を示し、Jは結合定数を示す。

20

【0098】

合成実施例1-1-1: 3-(1H-ピラゾール-1-イル)イソニコチノニトリルの調製

3-クロロイソニコチノニトリル(1.00g、7.22mmol)、1H-ピラゾール(0.52g、7.94mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(10mL)に溶解させ、氷浴で冷却し、水素化ナトリウム(0.35g、7.94mmol)を加えた後、室温で1.5時間撹拌した。水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.79g、64.2%、白色固体)を得た。

30

¹H NMR(CDCl₃) 9.17(1H, s), 8.71(1H, s, J=5.1Hz), 8.17(1H, d, J=2.7Hz), 7.88(1H, d, J=1.5Hz), 7.65(1H, dd, J=5.1, 0.6Hz), 6.62(1H, dd, J=2.7, 0.6Hz)

【0099】

合成実施例1-1-2: 3-(1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド(化合物番号5)の調製

5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-アミン(0.52g、3.23mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(15mL)に溶解させ、水素化ナトリウム(含量55%、0.14g、3.23mmol)を加え、室温で30分間撹拌した。そこに合成実施例1-1-1で調製した3-(1H-ピラゾール-1-イル)イソニコチノニトリル(0.50g、2.94mmol)を加え、同温度で一時間撹拌した後、水素化ナトリウム(含量55%、0.05g、1.15mmol)を追加し、同温度でさらに17時間撹拌した。水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.57g、58.6%、白色固体)を得た。

40

¹H NMR(CDCl₃) 10.36(1H, broad), 8.90-8.70(2H, m), 8.55(1H, s), 7.95-7.81(2H, m), 7.81-7.70(2H, m), 7.24(1H, d, J=9.0Hz), 6.49(1H, broad), 6.53(1H, t, J=2.1Hz)

【0100】

50

合成実施例 1 - 1 - 3 : N - ((3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 4 - イル) ((5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) アミノ) メチレン) アセタミド (化合物番号 1 4) の調製

合成実施例 1 - 1 - 2 で調製した 3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) - N - (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) イソニコチンイミダミド (0 . 3 0 g 、 0 . 9 0 m m o l) に無水酢酸 (6 m L) を加え、還流下、15 分間攪拌した。同温度で無水酢酸を減圧留去し、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0 . 2 6 g 、 7 6 . 9 % 、白色粘性物) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 12.90(1H, s), 8.77(1H, s), 8.77-8.63(2H, m), 7.99(1H, d, J=7.8Hz), 7.76(1H, d, J=1.8Hz), 7.69(1H, s), 7.53(1H, d, J=4.8Hz), 7.38(1H, d, J=8.4Hz), 6.44(1H, s), 1.96(3H, s)

10

【 0 1 0 1 】

合成実施例 1 - 1 - 4 : N - ((3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 4 - イル) (メチル (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) アミノ) メチレン) アセタミド (化合物番号 1 7) の調製

合成実施例 1 - 1 - 3 で調製した N - ((3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 4 - イル) ((5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) アミノ) メチレン) アセタミド (0 . 1 3 g 、 0 . 3 5 m m o l) を N , N - ジメチルホルムアミド (2 . 6 m L) に溶解させ、水素化ナトリウム (含量 5 5 % 、 0 . 0 2 g 、 0 . 4 1 m m o l) を加え、室温で 1 0 分間攪拌した。そこにヨウ化メチル (2 5 μ L 、 0 . 4 0 m m o l) を加え、同温度で 3 時間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (8 . 8 m g 、 6 . 5 % 、黄色粘性物) を得た。

20

¹H NMR(CDCl₃) 8.70(1H, s), 8.56(1H, s), 8.43(1H, s), 7.30-7.20(2H, m), 7.91(1H, d, J=2.7Hz), 7.74(1H, d, J=1.5Hz), 7.67(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 6.49(1H, t, J=2.4Hz), 3.44(3H, s), 1.89(3H, s)

【 0 1 0 2 】

合成実施例 1 - 1 - 5 : N , N ' - ジメチル - 3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) - N - (5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) イソニコチンイミダミド (化合物番号 2 0) の調製

30

合成実施例 1 - 1 - 2 で調製した N - ((3 - (1 H - ピラゾール - 1 - イル) ピリジン - 4 - イル) ((5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - イル) アミノ) メチレン) アセタミド (0 . 1 5 g 、 0 . 4 5 m m o l) を N , N - ジメチルホルムアミド (3 m L) に溶解させ、水素化ナトリウム (含量 5 5 % 、 2 2 m g 、 0 . 5 0 m m o l) を加え、室温で 1 0 分間攪拌した後、ヨウ化メチル (3 0 μ L 、 0 . 4 0 m m o l) を加え、同温度で 3 0 分攪拌した。さらに水素化ナトリウム (含量 5 5 % 、 2 2 m g 、 0 . 5 0 m m o l) を加え、室温で 1 0 分間攪拌した後、ヨウ化メチル (3 0 μ L 、 0 . 4 0 m m o l) を加え、同温度で 2 . 5 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (3 1 m g 、 1 8 . 8 % 、白色固体) を得た。

40

¹H NMR(CDCl₃) 8.90(1H, s), 8.45(1H, d, J=4.8Hz), 8.29(1H, d, J=2.4Hz), 8.16(1H, s), 7.78(1H, d, J=1.5Hz), 1H NMR(CDCl₃) 7.59(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.03(1H, d, J=4.8Hz), 6.78(1H, d, J=8.4Hz), 6.48(1H, t, J=2.1Hz), 3.12(3H, s), 2.57(3H, s)

【 0 1 0 3 】

合成実施例 1 - 1 - 6 : 3 - (2 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 2 - イル) イソニコチノニトリルの調製

3 - クロロイソニコチノニトリル (1 . 5 0 g 、 7 . 2 2 m m o l) 、 1 H - 1 , 2 , 3 - トリアゾール (1 . 5 0 g 、 1 4 . 4 4 m m o l) をジメチルスルホキシド (2 0 m

50

L) に溶解させ、水浴で冷却し、水素化ナトリウム (0.98 g、21.77 mmol) を加えた後、100 で2時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで4回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、3-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)イソニコリノニトリル (0.92 g、49.8%) と3-(1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル)イソニコチノニトリル (0.92 g、9.6%) を得た。

3-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)イソニコリノニトリル

¹H NMR(CDCl₃) 9.50(1H, s), 8.77(1H, d, J=4.8Hz), 8.00(2H, s), 7.71(1H, d, J=5.1Hz)

10

3-(1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル)イソニコチノニトリル

¹H NMR(CDCl₃) 9.25(1H, s), 8.92(1H, d, J=5.1Hz), 8.29(1H, d, J=1.2Hz), 7.98(1H, d, J=1.2Hz), 7.76(1H, d, 5,1Hz)

【0104】

合成実施例 1-1-7: 3-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)-N-(5-トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド(化合物番号7)の調製

5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-アミン(0.57 g、3.51 mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(12 mL)に溶解させ、水素化ナトリウム(含量55%、0.17 g、3.86 mmol)を加え、室温で1時間攪拌した。そこに合成実施例 1-1-6で調製した3-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)イソニコチノニトリル(0.60 g、3.51 mmol)を加え、室温で13時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.74 g、63.3%)を得た。

20

¹H NMR(CDCl₃) 10.34(1H, broad), 9.08(1H, s), 8.80(1H, d, J=4.8Hz), 8.57(1H, s), 7.86(2H, s), 7.81(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.54(1H, d, J=5.1Hz), 7.14(1H, d, J=8.7Hz), 6.23(1H, broad)

【0105】

合成実施例 1-1-8: N-(3-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-4-イル)((5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)アミノ)メチレン)アセタミド(化合物番号16)の調製

30

合成実施例 1-1-7で調製した3-(2H-1, 2, 3-トリアゾール-2-イル)-N-(5-トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド(0.36 g、1.08 mmol)に無水酢酸(7 mL)を加え、還流下、20分間攪拌した。同温度で無水酢酸を減圧留去し、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.26 g、63.6%、白色固体)を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 13.33(1H, s), 9.34(1H, s), 8.76(1H, s), 8.71(1H, d, J=5.1Hz), 7.97(1H, d, J=6.9Hz), 7.78(2H, s), 7.43(1H, d, J=5.1Hz), 7.32(1H, d, J=8.4Hz), 2.09(3H, s)

40

【0106】

合成実施例 1-2-1: 2-(3-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-4-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリジン(化合物番号46)の調製

合成実施例 1-1-2で調製した3-(1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド(0.20 g、0.60 mmol)をジクロロメタン(10 mL)に溶解させ、ヨードベンゼンジアセテート(0.23 g、0.72 mmol)を加え、室温で2時間攪拌した。ヨードベンゼンジアセテート(0.23 g、0.72 mmol)をさらに加え、室温で5時間攪拌した。ジクロロメタンをエバポレーターで減圧留去した後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマト

50

グラフィーで精製し、目的物 (0.12 g、61.3%、白色固体) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 8.88(1H, s), 8.86-8.77(2H, m), 8.07(1H, d, J=4.8Hz), 7.84(1H, d, J=9.3Hz), 7.75-7.64(3H, m), 6.49(1H, t, J=2.4Hz)

【0107】

合成実施例 1-2-2: 2-(3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-4-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン (化合物番号 48) の調製

合成実施例 1-1-7 で調製した 3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)-N-(5-トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド (0.14 g、0.75 mmol) をジクロロメタン (7 mL) に溶解させ、ヨードベンゼンジアセテート (0.16 g、0.49 mmol) を加え、室温で 45 分間攪拌した。水を加え、酢酸エチルで 2 度抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.10 g、74.1%) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 9.03(1H, s), 8.89(1H, d, J=5.1Hz), 8.80(1H, s), 8.10(1H, d, J=5.1Hz), 7.85(2H, s), 7.82(1H, d, J=9.3Hz), 7.69(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz)

【0108】

合成実施例 1-3-1: 2-(3-(1H-ピラゾール-1-イル)ピリジン-4-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン (化合物番号 61) の調製

合成実施例 1-1-2 で調製した 3-(1H-ピラゾール-1-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド (0.18 g、0.54 mmol) をジクロロメタン (8 mL) に溶解させ、クロロギ酸 4-クロロフェニル (200 μL、1.45 mmol)、続いてトリエチルアミン (400 μL、5.42 mmol) を加え、室温で 1 時間攪拌した。その後、エバポレーターでジクロロメタンを留去し、酢酸エチル (10 mL) を加え、加熱還流下、4 時間攪拌した。エバポレーターで酢酸エチルを減圧留去した後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.16 g、84.6%、白色固体) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 9.37(1H, s), 8.87(1H, s), 8.11(1H, d, J=4.8Hz), 8.10(1H, dd, J=9.0, 2.4Hz), 7.94(1H, d, J=5.1Hz), 7.80(1H, d, J=2.4Hz), 7.58(1H, d, J=1.8Hz), 7.52(1H, d, J=9.3Hz), 6.46(1H, t, J=2.1Hz)

【0109】

合成実施例 1-3-2: 2-(3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-4-イル)-7-(トリフルオロメチル)-4H-ピリド[1,2-a][1,3,5]トリアジン-4-オン (化合物番号 62) の調製

合成実施例 1-1-7 で調製した 3-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)-N-(5-トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)イソニコチンイミダミド (0.16 g、0.49 mmol) をジクロロメタン (10 mL) に溶解させ、クロロギ酸 4-クロロフェニル (150 μL、1.09 mmol)、続いてトリエチルアミン (300 μL、2.16 mL) を加え、室温で 12 時間攪拌した。その後、エバポレーターでジクロロメタンを留去し、酢酸エチル (15 mL) を加え、加熱還流下、2 時間攪拌した。エバポレーターで酢酸エチルを減圧留去した後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.13 g、74.0%) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 9.39(1H, s), 9.19(1H, s), 8.85(1H, d, J=4.8Hz), 8.12(1H, dd, J=9.3, 2.4Hz), 7.92(1H, d, J=5.1Hz), 7.78(2H, s), 7.53(1H, d, J=9.0Hz)

【0110】

合成実施例 2-1-1: 3-(エチルチオ)ピコリノニトリルの調製

3-クロロピコリノニトリル (1.00 g、7.22 mmol)、エチルメルカプタン (0.59 mL、7.98 mmol) を N,N-ジメチルホルムアミド (10 mL) に溶解させ、氷浴で冷却し、水素化ナトリウム (0.35 g、8.02 mmol) を加えた

後、室温で1.5時間撈拌した。水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(1.11g、93.6%、薄黄色油状)を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 8.49(1H, dd, J=4.5, 1.2Hz), 7.75(1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.43(1H, dd, J=8.1, 4.5Hz), 3.06(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(1H, t, J=7.5Hz)

【0111】

合成実施例2-1-2: 3-(エチルチオ)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(化合物番号36)の調製

5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-アミン(1.09g、6.72mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(16mL)に溶解させ、水素化ナトリウム(含量55%、0.33g、7.56mmol)を加え、室温で15分間撈拌した。そこに合成実施例2-1-1で調製した3-(エチルチオ)ピコリノニトリル(1.11g、6.76mol)を加え、同温度で5時間撈拌した後、水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.90g、41.0%、白色固体)を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 10.04(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.35(1H, dd, J=4.5, 1.2Hz), 7.91(1H, broad), 7.84(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.71(1H, dd, J=8.4, 1.2Hz), 7.43(1H, d, J=8.7Hz), 7.32(1H, dd, J=8.1, 4.5Hz), 2.92(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)

【0112】

合成実施例2-1-3: 3-(エチルチオ)-5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピコリノニトリルの調製

WO2017016922、p57に記載の方法で調製した5-ブromo-3-(エチルチオ)ピコリノニトリル(0.48g、1.97mmol)を1,4-ジオキサン(25mL)に溶解させ、系内をポンプで脱気した後、窒素で置換しジクロロビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)(0.14g、0.20mmol)を加え、窒素雰囲気下、60℃で10分間加熱撈拌した。その後、(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ボロン酸(0.45g、2.37mmol)、2M炭酸ナトリウム水溶液(5mL)を加え、再度脱気、窒素で置換し、還流下、2時間撈拌した。放冷後、酢酸エチル、水を加え、ろ過助剤を用いたろ過により、不要物を取り除いた。ろ液にさらに水をを加え、酢酸エチルで2度抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(0.60g、98.6%)を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 8.69(1H, d, J=1.8Hz), 7.87(1H, d, J=2.1Hz), 7.80(2H, d, J=8.4Hz), 7.70(2H, d, J=8.4Hz), 3.13(1H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)

【0113】

合成実施例2-1-4: 3-(エチルチオ)-5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミドの調製(化合物番号138)

5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-アミン(106mg、0.65mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド(4mL)に溶解させ、水素化ナトリウム(含量55%、31mg、0.71mmol)を加え、室温で15分間撈拌した。そこに合成実施例2-1-3で調製した3-(エチルチオ)-5-(4-(トリフルオロメチル)ピコリノニトリル(200mg、6.49mmol)を加え、室温で16時間撈拌した後、水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製した後、酢酸エチルとヘキサンの混合液に生成物を懸濁させ、ろ過、目的物を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 10.07(1H, broad), 8.65(1H, s), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 7.86(1

H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.84(1H, d, J=2.1Hz), 7.78(2H, d, J=8.1Hz), 7.72(2H, d, J=8.1Hz), 7.46(1H, d, J=8.4Hz), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)

【0114】

合成実施例 2 - 1 - 5 : 3 - (エチルスルホニル) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミドの調製 (化合物番号 139)

合成実施例 2 - 1 - 4 で調製した 3 - (エチルチオ) - 5 - (4 - (トリフルオロメチル)フェニル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド (0.27g, 0.57mmol) をジクロロメタン (5.5mL) に溶解させ、3 - クロロ過安息香酸 (65%, 0.31g, 1.15mmol) を加え、室温で 18 時間攪拌した。炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.26g, 91.5%) を得た。1H NMR(CDCl₃) 10.17(1H, broad), 9.05(1H, d, J=2.1Hz), 8.71(1H, d, J=1.5Hz), 8.69(1H, s), 7.95-7.75(6H, m), 7.20(1H, d, J=2.4Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)

10

【0115】

合成実施例 2 - 1 - 6 : 3 - (エチルチオ) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル)ピコリノニトリルの調製

WO 2017016922、p 57 に記載の方法で調製した 5 - ブロモ - 3 - (エチルチオ)ピコリノニトリル (1.00g, 4.11mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (10mL) に溶解させ、1H - 1, 2, 3 - トリアゾール (0.31g, 4.49mmol)、炭酸カリウム (0.85g, 6.15mmol) を加え、80 で 5 時間攪拌した。放冷後、水を加え、酢酸エチルで 2 度抽出し、飽和食塩水で洗浄後、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.49g, 51.5%) を得た。

20

1H NMR(CDCl₃) 9.21(1H, d, J=2.4Hz), 8.36(1H, d, J=2.1Hz), 7.93(2H, s), 3.17(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)

【0116】

合成実施例 2 - 1 - 7 : 3 - (エチルチオ) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミドの調製 (化合物番号 102)

5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - アミン (130mg, 0.80mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (4mL) に溶解させ、水素化ナトリウム (含量 55%、35mg, 0.89mmol) を加え、室温で 15 分間攪拌した。そこに合成実施例 2 - 1 - 6 で調製した 3 - (エチルチオ) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル)ピコリノニトリル (186mg, 0.80mmol) を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応物に水を加え、酢酸エチルで抽出、飽和食塩水で洗浄し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製した後、酢酸エチルとヘキサンの混合液に生成物を懸濁させ、ろ過、目的物 (92mg, 29.1%) を得た。

30

40

1H NMR(CDCl₃) 10.06(1H, broad), 9.08(1H, d, J=2.1Hz), 8.65(1H, s), 8.40(1H, d, J=2.1Hz), 7.90(2H, s), 7.86(1H, dd, J=8.7, 2.7Hz), 7.45(1H, d, J=8.4Hz), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.48(3H, t, J=7.5Hz)

【0117】

合成実施例 2 - 1 - 8 : 3 - (エチルスルホニル) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 2 - イル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミドの調製 (化合物番号 103)

合成実施例 2 - 1 - 7 で調製した 3 - (エチルチオ) - 5 - (2H - 1, 2, 3 - トリ

50

アゾール - 2 - イル) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド (62 mg, 0.16 mmol) をジクロロメタン (2.5 mL) に溶解させ、3 - クロロ過安息香酸 (65%、86 g, 0.32 mmol) を加え、室温で2時間撹拌した。炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (45 mg, 67.1%) を得た。
¹H NMR(CDCl₃) 9.55(1H, d, J=2.4Hz), 9.18(1H, d, J=1.8Hz), 8.68(1H, s), 8.05-7.92(3H, m), 7.88(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 7.20(1H, d, J=8.7Hz), 4.07(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)

【 0 1 1 8 】

合成実施例 2 - 1 - 9 : 3 - クロロ - 5 - (ジメチルアミノ)ピコリノニトリルの調製
 3, 5 - ジクロロピコリノニトリル (1.00 g, 5.78 mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (10 mL) に溶解させ、50%ジメチルアミン水溶液 (1.21 mL、11.56 mmol) 加え、室温で20時間撹拌した。反応物に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.70 g, 66.7%) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 8.01(1H, d, J=2.7Hz), 6.88(1H, d, J=2.7Hz), 3.10(3H, s)

【 0 1 1 9 】

合成実施例 2 - 1 - 10 : 5 - (ジメチルアミノ) - 3 - (エチルチオ)ピコリノニトリルの調製

合成実施例 2 - 1 - 9 で調製した3 - クロロ - 5 - (ジメチルアミノ)ピコリノニトリル (0.70 g, 3.85 mmol) を N, N - ジメチルホルムアミド (14 mL) に溶解させ、エチルメルカプタン (0.92 mL、3.92 mmol) 加え、氷冷下、水素化ナトリウム (55%、0.19 g, 4.29 mmol) を加え、撹拌した。室温に戻し、同温度で3時間撹拌した後、反応物に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去し、粗目的物 (0.81 g) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 7.94(1H, d, J=2.7Hz), 6.81(1H, d, J=3.0Hz), 3.09(6H, s), 3.03(2H, q, J=7.5Hz), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)

【 0 1 2 0 】

合成実施例 2 - 1 - 11 : 5 - (ジメチルアミノ) - 3 - (エチルチオ) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミドの調製 (化合物番号 124)

合成実施例 2 - 1 - 10 で調製した5 - (ジメチルアミノ) - 3 - (エチルチオ)ピコリノニトリル (0.20 g, 0.96 mmol) をトルエン (10 mL) に溶解させ、氷冷下、トリメチルアルミニウム (1.8 Mトルエン溶液、1.0 mL、3.92 mmol) 加え、室温で2時間撹拌した。その後、5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - アミン (0.16 g, 0.96 mmol) を加え、70 °C で6時間撹拌した。反応物に水を加え、酢酸エチルで2回抽出し、得られた有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥、濾過後、エバポレーターで減圧留去し、目的物 (73 mg, 21%) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 9.98(1H, broad), 8.58(1H, s), 7.89(1H, d, J=1.8Hz), 7.80(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.42(1H, broad), 6.82(1H, d, J=2.4Hz), 3.09(6H, s), 2.89(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)

【 0 1 2 1 】

合成実施例 2 - 2 - 1 : 2 - (3 - (エチルチオ)ピリジン - 2 - イル) - 6 - (トリフルオロメチル) - [1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5 - a] ピリジン (化合物番号 53) の調製

合成実施例 2 - 1 - 2 で調製した3 - (エチルチオ) - N - (5 - (トリフルオロメチル)ピリジン - 2 - イル)ピコリンイミダミド (0.38 g, 1.16 mmol) をジクロロメタン (12 mL) に溶解させ、ヨードベンゼンジアセテート (0.39 g, 1.2

10

20

30

40

50

2 mmol) を加え、室温で 10 時間攪拌した。エバポレーターで減圧留去後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物 (0.19 g、49.1%) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 9.06(1H, s), 8.60(1H, dd, J=4.5, 1.2Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.76(1H, d, J=8.1, 1.5Hz), 7.72(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 7.37(1H, dd, J=8.1, 4.5Hz), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)

【0122】

合成実施例 2-2-2: 2-(3-(エチルスルフィニル)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン(化合物番号 54) 及び 2-(3-(エチルスルホニル)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン(化合物番号 55) の調製

合成実施例 2-2-1 で調製した 2-(3-(エチルチオ)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン(0.13 g、0.40 mmol) をジクロロメタン(10 mL) に溶解させ、3-クロロ過安息香酸(65%、0.16 g、0.60 mmol) を加え、室温で 20 分間攪拌した。エバポレーターでジクロロメタンを減圧留去後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、2-(3-(エチルスルフィニル)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン(6.4 mg、4.7%) 及び 2-(3-(エチルスルホニル)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン(95 mg、66.5%) を得た。

化合物 54

¹H NMR(CDCl₃) 9.04(1H, s), 8.93(1H, s), 8.63(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.79(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 7.70(1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 3.46(1H, m), 3.00(1H, m), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)

化合物 55

¹H NMR(CDCl₃) 9.07-8.98(2H, m), 8.55(1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.94(1H, d, J=9.6Hz), 7.76(1H, dd, J=9.6, 1.8Hz), 7.68(1H, dd, J=7.8, 4.5Hz), 3.96(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)

【0123】

合成実施例 2-2-3: 2-(3-(エチルスルホニル)-5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジンの調製(化合物番号 176)

合成実施例 2-1-5 で調製した 3-(エチルスルホニル)-5-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(51 mg、0.10 mmol) をジクロロメタン(2.5 mL) に溶解させ、ヨードベンゼンジアセテート(98 mg、0.30 mmol) を加え、室温で 18 時間攪拌した。エバポレーターで減圧留去後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(37 mg、72.8%) を得た。

¹H NMR(CDCl₃) 9.23(1H, d, J=2.1Hz), 9.02(1H, s), 8.74(1H, d, J=2.1Hz), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.89-7.79(4H, m), 7.78(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)

【0124】

合成実施例 2-2-4: 2-(3-(エチルスルホニル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)ピリジン-2-イル)-6-(トリフルオロメチル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジンの調製(化合物番号 181)

合成実施例 2-1-8 で調製した 3-(エチルスルホニル)-5-(2H-1,2,3-トリアゾール-2-イル)-N-(5-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル)ピコリンイミダミド(0.10 g、0.24 mmol) をジクロロメタン(3 mL) に溶解させ、ヨードベンゼンジアセテート(0.23 g、0.71 mmol) を加え、室温で

16時間撈拌した。エバポレーターで減圧留去後、得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィーで精製し、目的物(72mg、72.4%)を得た。

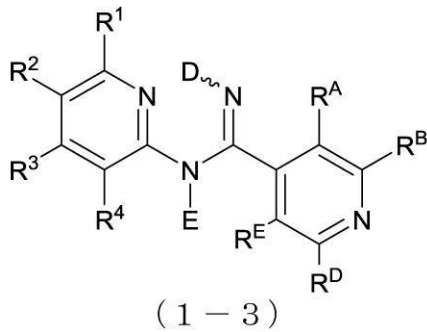
$^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$ 9.74(1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.20(1H, d, $J=2.1\text{Hz}$), 9.02(1H, s), 8.01-7.92(3H, m), 7.78(1H, dd, $J=9.3\text{Hz}$, 1.5Hz), 4.06(2H, q, $J=7.5\text{Hz}$), 1.47(3H, t, $J=7.5\text{Hz}$)

【0125】

前記と同様の方法より合成した表8に示す式(1-3)の本発明化合物、表9に示す式(1-4)の本発化合物、表10に示す式(2-2)の本発化合物、表11に示す式(2-3)の本発化合物、表12に示す式(3-2)の本発化合物、表13に示す式(3-3)の本発化合物の $^1\text{H-NMR}$ データ及び融点を表14に示す。なお、 NMR データにはアミジンのプロトンが検出されてないものもある。

10

【化17】



20

30

40

50

【表 8 - 1】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	D	E	R ^A	R ^B	R ^D	R ^E
1	H	CF ₃	H	H	H	H	OMe	H	H	H
2	H	CF ₃	H	H	H	H	SMe	H	H	H
3	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	H	H
4	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	H	H
5	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
6	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H	H
7	H	CF ₃	H	H	H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
8	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	SEt	H
9	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	H	H
10	H	H	CF ₃	H	H	H	SEt	H	H	H
11	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	H	H	H
12	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SOEt	H	H	H
13	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	H	H
14	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
15	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H	H
16	H	CF ₃	H	H	Ac	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
17	H	CF ₃	H	H	Ac	Me	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
18	CF ₃	H	H	H	Ac	H	SEt	H	H	H
19	H	H	CF ₃	H	Ac	H	SEt	H	H	H
20	H	CF ₃	H	H	Me	Me	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
21	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	SEt	H	H	H
22	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	SOEt	H	H	H
23	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	H	SO ₂ Et	H	H	H
24	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Me	SEt	H	H	H
25	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Me	SO ₂ Et	H	H	H
26	H	CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H	SEt	H	H	H
27	H	CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H	SOEt	H	H	H

10

20

30

40

50

【表 8 - 2】

28	H	CF ₃	H	H	CO ₂ Me	H	SO ₂ Et	H	H	H	H	H
29	H	CF ₃	H	H	C=OCF ₃	H	SEt	H	H	H	H	H
30	H	CF ₃	H	H	C=OCF ₃	H	SO ₂ Et	H	H	H	H	H
31	H	CF ₃	H	H	SO ₂ CF ₃	H	SEt	H	H	H	H	H
32	H	CF ₃	H	H	SO ₂ CF ₃	H	SOEt	H	H	H	H	H
33	H	CF ₃	H	H	SO ₂ CF ₃	H	SO ₂ Et	H	H	H	H	H
65	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	SEt	H	H	H	H
66	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	SEt	H	H	H	H
67	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	H	H	SEt	H
68	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	SO ₂ Et	H	H	H
69	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	H	H	H	SEt	H
70	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	H	H	SOEt	H
71	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	H	H	SO ₂ Et	H
72	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H	H
73	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H
74	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	H	H	SEt	H	H
75	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	SEt	H	H
76	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H
77	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	SEt	H	H
78	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H
79	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H	H
80	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	SEt	H	H	H	H
81	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	SEt	H	H	H	H
82	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H	SO ₂ Et	H
83	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H	SEt	H
84	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H	SO ₂ Et	H
85	H	CF ₃	H	H	C=OCF ₃	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H	H	H
86	H	H	CF ₃	H	H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H	H	H
87	H	H	CF ₃	H	Ac	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H	H	H

10

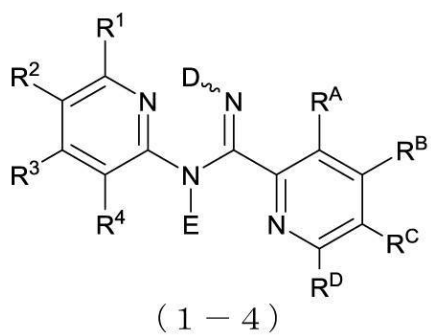
20

30

40

50

【化 1 8】



10

20

30

40

50

【表 9 - 1】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	D	E	R ^A	R ^B	R ^C	R ^D
34	H	CF ₃	H	H	H	H	OMe	H	H	H
35	H	CF ₃	H	H	H	H	SMe	H	H	H
36	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	H	H
37	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	SEt	H
38	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
39	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H	H
40	H	CF ₃	H	H	H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
41	H	CF ₃	H	H	Ac	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
88	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	SO ₂ Et	H
89	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	1H-pyrazol-1-yl	H
90	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	H	1H-pyrazol-1-yl	H
91	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
93	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SEt	H
94	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SEt	H
95	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SO ₂ Et	H
96	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SO ₂ Et	H
97	H	CF ₃	H	H	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	1H-pyrazol-1-yl	H
98	H	CF ₃	H	H	Ac	H	1H-pyrazol-1-yl	H	1H-pyrazol-1-yl	H
99	H	H	CF ₃	H	H	H	SEt	H	1H-pyrazol-1-yl	H
100	H	H	CF ₃	H	H	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
101	H	H	CF ₃	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
102	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
103	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
104	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	1H-1,2,4-triazol-1-yl	H
105	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	1H-1,2,4-triazol-1-yl	H
106	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
107	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	H	1H-pyrazol-1-yl	H

10

20

30

40

50

【表 9 - 2】

108	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
109	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
110	CF ₃	H	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
111	H	CF ₃	H	H	(C=O)CF ₃	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
112	H	CF ₃	H	H	(C=O)Ph	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
113	H	CF ₃	H	H	(C=O)cPr	(C=O)cPr	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
114	H	CF ₃	H	H	(C=O)cPr	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
115	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	3-((2,2,2-trifluoroethyl)carbamoyl)-1H-pyrazol-1-yl	H
116	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	3-((2,2,2-trifluoroethyl)carbamoyl)-1H-pyrazol-1-yl	H
117	H	(C=O)NHCH ₂ CF ₃	H	H	Ac	H	SEt	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
118	H	(C=O)NHCH ₂ CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
119	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H
120	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H
121	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	CF ₃	H
122	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	CF ₃	H
123	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	CF ₃	H
124	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	NMe ₂	H
125	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	NMe ₂	H
126	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	Ph	H
127	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	Ph	H
128	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	4-OMePh	H
129	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	4-OMePh	H
130	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	4-ClPh	H
131	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	4-ClPh	H
132	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	3,5-diClPh	H
133	H	CF ₃	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	3,5-diClPh	H
134	H	CF ₃	H	H	H	H	SEt	H	2-CF ₃ Ph	H

10

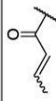
20

30

40

50

【表 9 - 3】

135	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	2-CF ₃ Ph	H
136	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	3-CF ₃ Ph	H
137	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	3-CF ₃ Ph	H
138	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	4-CF ₃ Ph	H
139	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
140	H	CF ₃	H	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
141	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	4-OCF ₃ Ph	H
142	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	4-OCF ₃ Ph	H
143	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	2,4-bis(CF ₃)Ph	H
144	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	2,4-bis(CF ₃)Ph	H
145	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	3,5-bis(CF ₃)Ph	H
146	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	3,5-bis(CF ₃)Ph	H
147	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	thiophen-2-yl	H
148	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	thiophen-2-yl	H
149	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	thiophen-3-yl	H
150	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	thiophen-3-yl	H
151	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	pyridin-3-yl	H
152	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	pyridin-3-yl	H
153	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	pyridin-4-yl	H
154	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	pyridin-4-yl	H
155	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	pyrimidin-5-yl	H
156	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	pyrimidin-5-yl	H
157	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SEt	H	O(4-OCF ₃)Ph	H
158	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	O(4-OCF ₃)Ph	H
199	H	CF ₃	H	H	H	Ac	Me	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
200	H	CF ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ Et	H	3-OCF ₃ Ph	H
201	H	CF ₃	H	H	H		H	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
202	H	CF ₃	H	H	H	Ac	H	SEt	H	4-OCF ₃ Ph	H

10

20

30

40

50

【表 9 - 4】

203	H	CF ₃	H	H	Ac	Me	SEt	H	4-OCF ₃ Ph	H
204	H	CF ₃	H	H	Ac	Me	SO ₂ Et	H	4-OCF ₃ Ph	H
205	H	CF ₃	H	H	Ac	Me	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
206	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ OMe	SEt	H	4-CF ₃ Ph	H
207	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
208	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ OMe	SEt	H	4-OCF ₃ Ph	H
209	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	H	4-OCF ₃ Ph	H
210	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ OEt	SEt	H	4-CF ₃ Ph	H
211	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ OEt	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
212	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ CN	SEt	H	4-CF ₃ Ph	H
213	H	CF ₃	H	H	Ac	CH ₂ CN	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
220	H	CF ₃	H	H	Ac	H	SO ₂ Et	H	4-OCF ₃ Ph	H

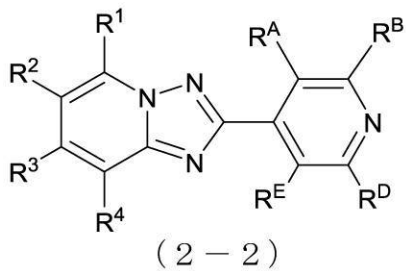
10

20

30

40

【化 1 9】

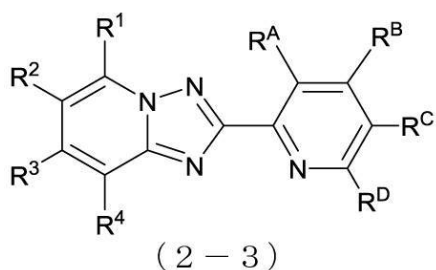


50

【表 1 0】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^A	R ^B	R ^D	R ^E
42	H	CF ₃	H	H	SMe	H	H	H
43	H	CF ₃	H	H	SEt	H	H	H
44	H	CF ₃	H	H	SOEt	H	H	H
45	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	H	H
46	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
47	H	CF ₃	H	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H	H
48	H	CF ₃	H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
49	H	H	CF ₃	H	SEt	H	H	H
50	H	H	CF ₃	H	SOEt	H	H	H
51	H	H	CF ₃	H	SO ₂ Et	H	H	H
159	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	SO ₂ Et	H
160	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	H	SO ₂ Et
161	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	H	SO ₂ Et
162	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	SEt	H	H
163	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	SO ₂ Et	H	H
164	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	SOEt	H	H
165	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SEt	H
166	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SO ₂ Et	H
167	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SOEt	H
168	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	1H-pyrazol-1-yl	H
169	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	SO ₂ Et
170	H	H	CF ₃	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H

【化 2 0】



10

20

30

40

50

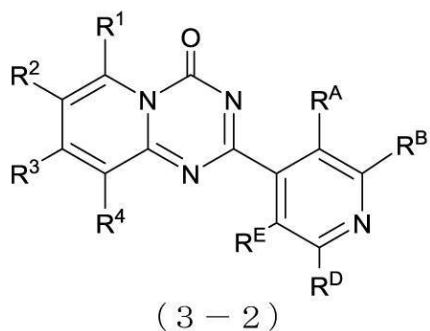
【表 1 1】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^A	R ^B	R ^C	R ^D
52	H	CF ₃	H	H	SMe	H	H	H
53	H	CF ₃	H	H	SEt	H	H	H
54	H	CF ₃	H	H	SOEt	H	H	H
55	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	H	H
56	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
57	H	CF ₃	H	H	1H-1,2,3-triazol-1-yl	H	H	H
58	H	CF ₃	H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
171	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	SOEt	H
172	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	SO ₂ Et	H
173	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	NMe ₂	H
174	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	2-CF ₃ Ph	H
175	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	3-CF ₃ Ph	H
176	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
177	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	4-OCF ₃ Ph	H
178	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	3,5-bis(CF ₃)Ph	H
179	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	pyrimidin-5-yl	H
180	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
181	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
182	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SO ₂ Et	H
183	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	1H-pyrazol-1-yl	H
214	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	3-OCF ₃ Ph	H

10

20

【化 2 1】



30

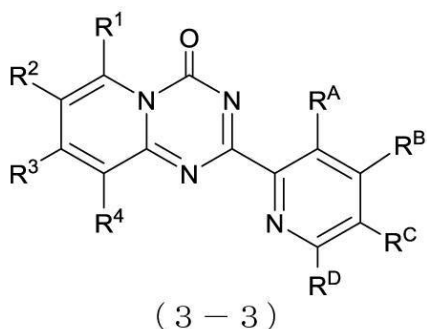
40

50

【表 1 2】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^A	R ^B	R ^D	R ^E
59	H	CF ₃	H	H	SEt	H	H	H
60	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	H	H
61	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
62	H	CF ₃	H	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H	H	H
184	H	CF ₃	H	H	SEt	H	SEt	H
185	H	CF ₃	H	H	SEt	H	H	SEt
186	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	SO ₂ Et	H
187	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SEt	H
188	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SOEt	H
189	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SO ₂ Et	H
190	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	SEt
191	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	SO ₂ Et
192	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	1H-pyrazol-1-yl	H

【化 2 2】



【表 1 3】

化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ^A	R ^B	R ^C	R ^D
63	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	H	H
64	H	CF ₃	H	H	SEt	H	SEt	H
193	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	1H-pyrazol-1-yl	H
194	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	SO ₂ Et	H
195	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SEt	H
196	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SOEt	H
197	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	SO ₂ Et	H
198	H	CF ₃	H	H	1H-pyrazol-1-yl	H	1H-pyrazol-1-yl	H
215	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	2H-1,2,3-triazol-2-yl	H
216	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	3-CF ₃ Ph	H
217	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	4-CF ₃ Ph	H
218	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	3-OCF ₃ Ph	H
219	H	CF ₃	H	H	SO ₂ Et	H	4-OCF ₃ Ph	H

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1】

化合物 番号	重溶媒	¹ H NMR 300MHz, δ ppm	融点(°C)
1	CDCl ₃	10.81(1H, broad), 8.58(1H, s), 8.48(1H, s), 8.42(1H, d, J=5.1Hz), 8.24(1H, d, J=4.8Hz), 7.83(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.64(1H, broad), 7.31(1H, d, J=8.7Hz), 4.09(3H, s)	97-103
2	CDCl ₃	10.63(1H, broad), 8.62(2H, s), 8.52(1H, d, J=5.1Hz), 7.88(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.52(1H, d, J=4.8Hz), 7.34(1H, d, J=8.4Hz), 6.35(1H, broad), 2.55(3H, s)	147-150
3	CDCl ₃	10.66(1H, broad), 8.68(1H, s), 8.63(1H, s), 8.55(1H, d, J=5.1Hz), 7.87(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.61(1H, d, J=4.8Hz), 7.33(1H, d, J=8.7Hz), 6.51(1H, broad), 3.01(2H, q, J=7.5Hz), 1.32(3H, t, J=7.5Hz)	154-155
4	CDCl ₃	10.59(1H, broad), 9.24(1H, s), 8.98(1H, d, J=5.1Hz), 8.65(1H, s), 7.88(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.61(1H, d, J=4.8Hz), 7.16(1H, d, J=8.4Hz), 6.33(1H, broad), 3.62(2H, q, J=7.5Hz), 1.34(3H, t, J=7.5Hz)	179-183
5	CDCl ₃	10.36(1H, broad), 8.90-8.70(2H, m), 8.55(1H, s), 7.95-7.81(2H, m), 7.81-7.70(2H, m), 7.24(1H, d, J=9.0Hz), 6.53(1H, broad), 6.49(1H, t, J=2.1Hz)	159-160
6	CDCl ₃	10.39(1H, broad), 8.89(1H, d, J=4.8Hz), 8.86(1H, s), 8.56(1H, s), 7.99(1H, s), 7.90-7.81(2H, m), 7.80(1H, d, J=5.1Hz), 7.15(1H, d, J=8.4Hz), 6.15(1H, broad)	—
7	CDCl ₃	10.34(1H, broad), 9.08(1H, s), 8.80(1H, d, J=4.8Hz), 8.57(1H, s), 7.86(2H, s), 7.81(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.54(1H, d, J=5.1Hz), 7.14(1H, d, J=8.7Hz), 6.23(1H, broad)	145-146
8	CDCl ₃	10.69(1H, broad), 8.62(1H, s), 8.52(1H, s), 7.86(1H, dd, J=8.4, 2.7Hz), 7.55(1H, s), 7.32(1H, d, J=8.4Hz), 6.76(1H, broad), 3.19(2H, q, J=7.5Hz), 2.91(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz), 1.27(3H, t, J=7.5Hz)	108-110
9	CDCl ₃	10.43(1H, broad), 8.67(1H, s), 8.52(1H, d, J=5.1Hz), 7.82(1H, t, J=7.8Hz), 7.58(1H, d, J=5.1Hz), 7.48-7.32(2H, m), 6.54(1H, broad), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.33(3H, t, J=7.5Hz)	78-85

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 2】

10	CDCl ₃	10.60(1H, broad), 8.67(1H, s), 8.60-8.45(2H, m), 7.60(1H, d, J=5.1Hz), 7.48(1H, s), 7.18(1H, d, J=5.1Hz), 6.59(1H, broad), 3.01(2H, q, J=7.5Hz), 1.32(3H, t, J=7.5Hz)	
11	CDCl ₃	13.22(1H, s), 8.76(1H, s), 8.66(1H, s), 8.53(1H, d, J=5.1Hz), 8.01(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 7.47(1H, d, J=8.4Hz), 7.28(1H, d, J=5.1Hz), 2.98(2H, q, J=7.2Hz), 2.21(3H, s), 1.29(3H, t, J=7.5Hz)	—
12	CDCl ₃	12.93(1H, s), 9.25(1H, s), 8.86-8.72(2H, m), 8.07(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 7.47-7.36(2H, m), 3.36-3.17(1H, m), 3.09-2.91(1H, m), 2.23(3H, s), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	—
13	CDCl ₃	13.46(1H, s), 9.18(1H, s), 8.91(1H, d, J=4.8Hz), 8.78(1H, s), 8.01(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 7.38(1H, d, J=5.1Hz), 7.34(1H, d, J=8.4Hz), 2.21(3H, s), 3.34(2H, q, J=7.5Hz), 1.33(3H, t, J=7.5Hz)	104-108
14	CDCl ₃	12.90(1H, s), 8.77(1H, s), 8.77-8.63(2H, m), 7.99(1H, d, J=7.8Hz), 7.76(1H, d, J=1.8Hz), 7.69(1H, s), 7.53(1H, d, J=4.8Hz), 7.38(1H, d, J=8.4Hz), 6.44(1H, s), 1.96(3H, s)	—
15	CDCl ₃	13.00(1H, s), 8.83(1H, d, J=4.8Hz), 8.80(1H, s), 8.69(1H, s), 7.97(1H, d, J=8.1Hz), 7.92(1H, s), 7.82(1H, d, J=1.2Hz), 7.60(1H, d, J=3.3Hz), 7.32(1H, d, J=8.1Hz), 2.01(3H, s)	136-139
16	CDCl ₃	13.33(1H, s), 9.34(1H, s), 8.76(1H, s), 8.71(1H, d, J=5.1Hz), 7.97(1H, d, J=6.9Hz), 7.78(2H, s), 7.43(1H, d, J=5.1Hz), 7.32(1H, d, J=8.4Hz), 2.09(3H, s)	108-110
17	CDCl ₃	8.70(1H, s), 8.56(1H, s), 8.43(1H, s), 7.91(1H, d, J=2.7Hz), 7.74(1H, d, J=1.5Hz), 7.67(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.30-7.20(2H, m), 6.49(1H, t, J=2.4Hz), 3.44(3H, s), 1.89(3H, s)	97-100
18	CDCl ₃	13.33(1H, s), 8.67(1H, s), 8.53(1H, d, J=4.8Hz), 7.98(1H, t, J=8.1Hz), 7.62-7.52(2H, m), 7.27(1H, d, J=4.5Hz), 2.99(2H, q, J=7.5Hz), 2.20(3H, s), 1.29(3H, t, J=7.5Hz)	—
19	CDCl ₃	13.25(1H, s), 8.72-8.60(2H, m), 8.53(1H, d, J=4.8Hz), 7.61(1H, s), 7.39(1H, d, J=5.1Hz), 7.28(1H, d, J=5.1Hz), 2.98(2H, q, J=7.5Hz), 2.21(3H, s), 1.29(3H, t, J=7.5Hz)	—

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 3】

20	CDCl ₃	8.90(1H, s), 8.45(1H, d, J=4.8Hz), 8.29(1H, d, J=2.4Hz), 8.16(1H, s), 7.78(1H, d, J=1.5Hz), 7.59(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.03(1H, d, J=4.8Hz), 6.78(1H, d, J=8.4Hz), 6.48(1H, t, J=2.1Hz), 3.12(3H, s), 2.57(3H, s)	88-95
21	CDCl ₃	8.69(1H, s), 8.56(1H, d, J=4.5Hz), 8.70-8.35(2H, broad), 8.00(2H, broad), 7.39(1H, s), 3.16(3H, s), 3.03(2H, q, J=7.2Hz), 1.31(3H, t, J=7.2Hz)	76-79
22	CDCl ₃	11.15(1H, broad), 9.08(1H, s), 8.80(1H, s), 8.56(1H, s), 8.42(1H, broad), 8.00(1H, d, J=8.1Hz), 7.51(1H, s), 3.35-2.97(5H, m), 1.31(3H, t, 7.2Hz)	195-197
23	CDCl ₃	10.92(1H, broad), 9.70-6.70(6H, each peaks are broad), 3.43(2H, d, J=6.9Hz), 3.16(3H, s), 1.39(3H, t, J=7.2Hz)	204-206
24	CDCl ₃	8.60(1H, d, J=2.4Hz), 8.44(1H, s), 8.32(1H, d, J=4.8Hz), 7.87(1H, dd, J=8.1, 2.1Hz), 7.69(1H, d, J=8.4Hz), 7.23(1H, d, J=4.8Hz), 3.61(3H, s), 3.17(3H, s), 3.15-3.00(2H, m), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	48-50
25	CDCl ₃	8.95(1H, s), 8.69(1H, s), 8.60(1H, s), 7.96(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.79(1H, broad), 7.49(1H, d, J=4.5Hz), 3.56(3H, s), 3.17(3H, s), 3.00(2H, broad), 1.40(3H, t, J=6.9Hz)	82-86
26	CDCl ₃	12.99(1H, s), 8.76(1H, s), 8.69(1H, s), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 8.00(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.44(1H, d, J=8.4Hz), 7.31(1H, d, J=4.8Hz), 3.72(3H, s), 2.99(2H, q, J=7.2Hz), 1.29(3H, t, J=7.2Hz)	—
27	CDCl ₃	12.74(1H, s), 9.28(1H, broad), 8.83(1H, broad), 8.78(1H, s), 8.04(1H, dd, J=8.7, 2.1Hz), 7.45(1H, s), 7.38(1H, d, J=8.4Hz), 3.73(3H, s), 3.37-3.21(1H, m), 3.10-2.93(1H, m), 1.36(3H, t, J=7.5Hz)	—
28	CDCl ₃	13.14(1H, s), 9.21(1H, s), 8.93(1H, d, J=4.8Hz), 8.78(1H, s), 7.99(1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.43(1H, d, J=4.8Hz), 7.32(1H, d, J=8.4Hz), 3.71(3H, s), 3.38(2H, q, J=7.2Hz), 1.34(3H, t, J=7.5Hz)	105-111

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 4】

29	CDCl ₃	14.72(1H, s), 8.88-8.42(3H), 8.10(1H, d, J=8.4Hz), 7.58(1H, broad), 7.30(1H, d, J=1.5Hz), 3.00(2H, q, J=7.5Hz), 1.29(3H, t, J=7.5Hz)	131-136
30	CDCl ₃	14.97(1H, s), 9.23(1H, s), 8.98(1H, s), 8.81(1H, s), 8.10(1H, d, J=8.1Hz), 7.52-7.37(2H, m), 3.32(2H, q, J=7.2Hz), 1.35(3H, t, J=7.2Hz)	—
31	CDCl ₃	9.07(1H, broad), 8.73(1H, s), 8.61(1H, d, J=5.1Hz), 8.52(1H, s), 8.37(1H, broad), 8.12(1H, dd, J=8.7, 1.8Hz), 7.43(1H, d, J=5.1Hz), 3.06(2H, q, J=7.5Hz), 1.33(3H, t, J=7.5Hz)	162-169
32	CDCl ₃	9.05(1H, s), 8.90(1H, d, J=4.5Hz), 8.66(1H, s), 8.19(1H, broad), 8.07(1H, d, J=7.8Hz), 7.55(1H, d, J=4.5Hz), 3.09(2H, m), 1.29(3H, t, J=7.5Hz)	170-179
33	CDCl ₃	9.99(1H, broad), 9.19(1H, s), 9.01(1H, d, J=5.1Hz), 8.42(1H, s), 8.24(1H, broad), 8.09(1H, d, J=8.1Hz), 7.58(1H, d, J=4.2Hz), 3.38(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	163-167
34	CDCl ₃	10.49(1H, broad), 8.59(1H, s), 8.33(1H, t, J=3.0Hz), 7.84(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 7.63(1H, broad), 7.41(1H, s), 7.40(1H, s), 3.99(3H, s)	90-95
35	CDCl ₃	10.01(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.36(1H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 7.91(1H, broad), 7.84(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.69(1H, dd, J=8.4, 1.2Hz), 7.43(1H, d, J=8.7Hz), 7.37(1H, dd, J=8.1, 4.5Hz), 2.42(3H, s)	87-89
36	CDCl ₃	10.04(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.35(1H, dd, J=4.5, 1.2Hz), 7.91(1H, broad), 7.84(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.71(1H, dd, J=8.4, 1.2Hz), 7.43(1H, d, J=8.7Hz), 7.32(1H, dd, J=8.1, 4.5Hz), 2.92(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	99-105
37	CDCl ₃	10.00(1H, broad), 8.62(1H, s), 8.23(1H, d, J=2.1Hz), 7.83(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.77(1H, broad), 7.56(1H, d, J=2.4Hz), 7.41(1H, d, J=8.4Hz), 3.04(2H, q, J=7.5Hz), 2.89(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	112-115

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 5】

38	CDCl ₃	10.30(1H, broad), 8.69(1H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 8.57(1H, s), 7.99(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.81(1H, d, J=2.7Hz), 7.77-7.68(2H, m), 7.55(1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 7.21(1H, broad), 6.86(1H, d, J=8.7Hz), 6.42(1H, t, J=2.4Hz)	—
39	CDCl ₃	10.28(1H, broad), 8.81(1H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 8.55(1H, s), 8.01-7.90(2H, m), 7.84(1H, d, J=1.2Hz), 7.71(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.64(1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 7.67(1H, broad), 6.67(1H, d, J=7.8Hz)	141-144
40	CDCl ₃	10.29(1H, broad), 8.76(1H, dd, J=4.8, 1.5Hz), 8.55(1H, s), 8.06(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.84(2H, s), 7.67(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.60(1H, d, J=8.7Hz), 7.35(1H, broad), 6.65(1H, d, J=8.7Hz)	113-115
41	CDCl ₃	13.34(1H, s), 8.76(1H, s), 8.64(1H, d, J=4.2Hz), 8.42(1H, d, J=8.1Hz), 7.91(1H, d, J=6.6Hz), 7.75(2H, s), 7.52(1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 7.28-7.18(1H, m), 2.19(3H, s)	63-69
42	CDCl ₃	9.06(1H, s), 8.65(1H, s), 8.54(1H, d, J=5.1Hz), 8.06(1H, d, J=5.1Hz), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.75(1H, dd, J=9.3, 1.5Hz), 2.64(3H, s)	135-138
43	CDCl ₃	9.07(1H, s), 8.69(1H, s), 8.53(1H, d, J=4.8Hz), 8.03(1H, d, J=4.8Hz), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.74(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 3.14(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	145-148
44	CDCl ₃	9.41(1H, s), 9.01(1H, s), 8.92(1H, d, J=5.1Hz), 8.25(1H, d, J=5.1Hz), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.80(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 3.45(1H, m), 3.08(1H, m), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	—
45	CDCl ₃	9.38(1H, s), 9.07-8.95(2H, m), 7.94(1H, d, J=9.3Hz), 7.87(1H, d, J=5.1Hz), 7.78(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 3.95(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	146-148
46	CDCl ₃	8.88(1H, s), 8.86-8.77(2H, m), 8.07(1H, d, J=4.8Hz), 7.84(1H, d, J=9.3Hz), 7.75-7.64(3H, m), 6.47(1H, t, J=2.4Hz)	85-86
47	CDCl ₃	8.96(1H, d, J=4.8Hz), 8.86(1H, s), 8.77(1H, s), 8.28(1H, d, J=4.8Hz), 7.98-7.87(2H, m), 7.82(1H, d, J=9.3Hz), 7.70(1H, d, J=9.3Hz)	143-145

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 6】

48	CDCl ₃	9.03(1H, s), 8.89(1H, d, J=5.1Hz), 8.80(1H, s), 8.10(1H, d, J=5.1Hz), 7.85(2H, s), 7.82(1H, d, J=9.3Hz), 7.69(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz)	119-123
49	CDCl ₃	8.82(1H, d, J=7.2Hz), 8.69(1H, s), 8.53(1H, d, J=5.1Hz), 8.17(1H, t, J=0.9Hz), 8.02(1H, d, J=5.1Hz), 7.28(1H, dd, J=7.2, 1.8Hz), 3.14(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	97-102
50	CDCl ₃	9.40(1H, s), 8.92(1H, d, J=5.1Hz), 8.79(1H, d, 7.2Hz), 8.25(1H, d, J=5.1Hz), 8.16(1H, s), 7.35(1H, dd, J=7.2, 1.8Hz), 3.54-3.38(1H, m), 3.30-3.17(1H, m), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	151-157
51	CDCl ₃	9.39(1H, s), 9.01(1H, s), 8.77(1H, d, J=7.2Hz), 8.14(1H, s), 7.87(1H, d, J=4.8Hz), 7.33(1H, dd, J=7.2, 1.8Hz), 3.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	137-145
52	CDCl ₃	9.06(1H, s), 8.60(1H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.77-7.68(2H, m), 7.45-7.36(1H, d, J=8.1, 4.5Hz), 2.53(3H, s)	118-120
53	CDCl ₃	9.06(1H, s), 8.60(1H, dd, J=4.5, 1.2Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.76(1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.72(1H, dd, J=9.3, 1.5Hz), 7.37(1H, dd, J=8.1, 4.5Hz), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	102-103
54	CDCl ₃	9.04(1H, s), 8.93(1H, s), 8.63(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.79(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 7.70(1H, dd, J=8.1, 4.8Hz), 3.54-3.38(1H, m), 3.08-2.93(1H, m), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	149-156
55	CDCl ₃	9.07-8.98(2H, m), 8.55(1H, dd, J=8.1, 1.8Hz), 7.94(1H, d, J=9.6Hz), 7.76(1H, dd, J=9.6, 1.8Hz), 7.68(1H, dd, J=7.8, 4.5Hz), 3.96(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	164-167
56	CDCl ₃	8.93-8.80(2H, m), 8.03(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.85(1H, d, J=9.6Hz), 7.71(1H, d, J=1.8Hz), 7.68(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 7.63-7.54(2H, m), 6.40(1H, t, J=2.1Hz)	140-142
57	CDCl ₃	9.02(1H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 8.82(1H, s), 8.00(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.90-7.85(2H, m), 7.83(1H, d, J=9.3Hz), 7.73-7.62(2H, m)	180-183
58	CDCl ₃	8.93(1H, dd, J=4.8, 1.5Hz), 8.85(1H, s), 8.16(1H, dd, J=8.1, 1.5Hz), 7.85-7.78(3H, m), 7.72-7.58(2H, m)	145-148

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 7】

59	CDCl ₃	9.44(1H, s), 8.70(1H, s), 8.52(1H, d, J=4.8Hz), 8.19(1H, dd, J=9.3, 2.1Hz), 8.04(1H, d, J=5.1Hz), 7.86(1H, d, J=9.3Hz), 3.09(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	170-171
60	CDCl ₃	9.43(1H, s), 9.29(1H, s), 9.03(1H, d, J=3.9Hz), 8.24(1H, dd, J=9.3, 1.8Hz), 7.81(1H, d, J=9.0Hz), 7.72(1H, d, J=4.8Hz), 3.82(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	149-153
61	CDCl ₃	9.37(1H, s), 8.87(1H, s), 8.11(1H, d, J=4.8Hz), 8.10(1H, dd, J=9.0, 2.4Hz), 7.94(1H, d, J=5.1Hz), 7.80(1H, d, J=2.4Hz), 7.58(1H, d, J=1.8Hz), 7.52(1H, d, J=9.3Hz), 6.46(1H, t, J=2.1Hz)	—
62	CDCl ₃	9.39(1H, s), 9.19(1H, s), 8.85(1H, d, J=4.8Hz), 8.12(1H, dd, J=9.3, 2.4Hz), 7.92(1H, d, J=5.1Hz), 7.78(2H, s), 7.53(1H, d, J=9.0Hz)	—
63	CDCl ₃	9.35(1H, s), 8.80(1H, d, J=4.5, 0.9Hz), 8.13(1H, dd, J=9.0, 2.1Hz), 7.95(1H, dd, J=8.1, 1.6Hz), 7.86-7.76(2H, m), 7.66-7.52(2H, m), 6.44(1H, t, J=2.1Hz)	76-80
64	CDCl ₃	9.40(1H, s), 8.45(1H, d, J=2.1Hz), 8.12(1H, dd, J=9.3, 2.4Hz), 7.94(1H, dd, J=9.3Hz), 7.61(1H, d, J=2.1Hz), 3.07(2H, q, J=7.5Hz), 2.96(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	142-147
65	CDCl ₃	10.67(1H, broad), 8.62(1H, s), 8.46(1H, d, J=5.1Hz), 7.86(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.34-7.24(2H, m), 6.54(1H, broad), 3.16(2H, q, J=7.5Hz), 2.93(2H, q, J=7.5Hz), 1.37(3H, t, J=7.5Hz), 1.22(3H, t, J=7.5Hz)	135-137
66	CDCl ₃	13.34(1H, s), 8.76(1H, s), 8.45(1H, d, J=4.8Hz), 7.99(1H, d, J=7.8Hz), 7.42(1H, d, J=8.4Hz), 6.97(1H, d, J=4.8Hz), 3.17(2H, q, J=7.5Hz), 2.88(2H, q, J=7.5Hz), 2.20(3H, s), 1.38(3H, t, J=7.5Hz), 1.18(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
67	CDCl ₃	10.53(1H, broad), 8.65(1H, s), 8.45(2H, s), 7.87(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.30(1H, d, J=6.9Hz), 5.90(1H, broad), 3.02(4H, q, J=7.5Hz), 1.32(6H, t, J=7.5Hz)	159-164
68	CDCl ₃	9.32(1H, s), 8.68(1H, s), 8.37(1H, s), 7.91(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 7.16(1H, m), 3.67(2H, q, J=7.5Hz), 3.54(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz), 1.37(3H, t, J=7.5Hz)	—

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 8】

69	CDCl ₃	13.39(1H, s), 8.78(1H, s), 8.49(2H, s), 8.01(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.44(1H, d, J=8.7Hz), 2.95(4H, q, J=7.5Hz), 2.21(3H, s), 1.27(6H, t, J=7.5Hz)	—
70	CDCl ₃	9.34(1H, s), 9.29(1H, s), 8.67(1H, s), 7.89(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.10(1H, d, J=8.4Hz), 3.45(2H, m), 3.22(1H, m), 2.97(1H, m), 1.30(3H, t, J=7.5Hz), 1.27(3H, t, J=7.5Hz)	183-188
71	CDCl ₃	9.50(2H, s), 8.69(1H, s), 8.64(1H, broad), 7.89(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.09(1H, d, J=8.7Hz), 3.45(4H, m), 1.29(6H, t, J=7.5Hz),	186-195
72	CDCl ₃	10.70(1H, broad), 8.64(1H, s), 8.49(1H, d, J=4.8Hz), 8.18(1H, d, J=2.7Hz), 7.89(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.82(1H, d, J=4.8Hz), 7.68(1H, d, J=4.8Hz), 7.34(1H, d, J=8.1Hz), 6.77(1H, broad), 6.52(1H, t, J=2.1Hz), 2.61(2H, q, J=7.5Hz), 1.03(3H, t, J=7.5Hz)	169-175
73	CDCl ₃	8.68(1H,s), 8.63(1H, s), 8.59(1H, s), 7.94-7.81(2H, m), 7.69(1H, d, J=1.5Hz), 7.25(1H, m), 6.39(1H, t, J=2.1Hz), 3.09(2H, q, J=7.5Hz), 1.37(3H, t, J=2.1Hz)	170-175
74	CDCl ₃	13.22(1H,s), 8.76(1H,s), 8.50(1H,s), 8.01(1H,dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.45(1H, d, J=8.4Hz), 7.15(1H,s), 3.18(2H, q, J=7.5Hz), 2.86(2H, q, J=7.5Hz), 2.20(3H,s), 1.38(3H, t, J=7.5Hz), 1.24(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
75	CDCl ₃	10.35(1H, broad), 8.53(2H, s), 7.83(1H, dd, J=8.7Hz), 2.4Hz), 7.74(1H, d, J=1.8Hz), 7.71-7.65(2H,m), 7.22(1H, d, J=8.4Hz), 6.54(1H, broad), 6.46(1H, t, J=2.1Hz), 3.24(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	135-139
76	CDCl ₃	10.39(1H, broad), 8.59(2H, d, J=2.4Hz), 8.55(1H, broad), 8.49(1H, s), 7.84(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.82-7.73(3H, m), 7.25(1H, m), 6.55-6.50(1H, m), 6.50-6.45(1H, m)	150-155
77	CDCl ₃	12.80(1H, broad), 8.68(1H,s), 8.53(1H, s), 7.96(1H, d, J=8.7Hz), 7.68(1H, d, J=2.4Hz), 7.67(1H, d, J=1.5Hz), 7.43-7.30(2H, m), 6.41(1H, t, J=2.1Hz), 3.23(2H, q, J=7.5Hz), 1.94(3H, s), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	129-133

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 9】

78	CDCl ₃	12.90(1H, broad), 8.70(1H,s), 8.60(1H, d, J=2.4Hz), 8.54(1H,s), 8.21(1H, s), 7.97(1H, d, J=1.5Hz), 7.78-7.72(2H, m), 7.70(1H, d, J=1.5Hz), 7.39(1H, d, J=8.4Hz), 6.50(1H, 1H, dd, J=2.4Hz, 1.88Hz), 6.44(1H, t, J=2.1Hz), 1.98(3H, s)	80-90
79	CDCl ₃	10.39(1H, broad), 8.74(1H, d, J=7.2Hz), 8.53(1H, s), 7.88(1H, d, J=5.1Hz), 7.83(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.75(2H, d, J=1.5Hz), 7.57(1H, d, J=1.5Hz), 7.54(1H, d, J=2.4Hz), 7.31-7.20(1H, m), 6.69(1H, broad), 6.41(1H, t, J=2.1Hz), 6.32(1H, t, J=1.8Hz)	167-171
80	CDCl ₃	10.27(1H, broad), 8.64(1H, d, J=5.1Hz), 8.50(1H, s), 7.87- 7.78(2H, m), 7.61(1H, d, J=2.4Hz), 7.56(1H, d, J=5.1Hz), 7.23(1H, s), 6.51(1H, t, J=2.1Hz), 6.35(1H, broad), 3.17(2H, q, J=7.5Hz), 1.32(3H, t, J=7.5Hz)	147-150
81	CDCl ₃	12.50(1H, broad), 8.64(1H, s), 8.58(1H, d, J=5.1Hz), 7.93(1H, d, J=7.2Hz), 7.71(1H,s), 7.68(1H, d, J=1.8Hz), 7.35(1H, d, J=5.1Hz), 7.19(1H, d, J=1.8Hz), 6.42(1H,s), 3.18(2H, q, J=7.5Hz), 1.98(3H, s), 1.33(3H, t, J=7.5Hz)	145-147
82	CDCl ₃	9.23(1H, s), 9.20(1H, s), 8.62(1H, s), 8.23(1H, broad), 7.95- 7.83(2H, m), 7.73(1H, d, J=1.5Hz), 7.16(1H, d, J=8.7Hz), 6.43(1H, t, J=2.1Hz), 3.67(2H, q, J=7.5Hz), 1.36(3H, t, J=7.5Hz)	206-211
83	CDCl ₃	13.13(1H, broad), 8.73(1H,s), 8.64(2H, s), 7.94(1H, d, J=7.8Hz), 7.75(1H, s), 7.62(1H, s), 7.30(1H,s), 6.38(1H, s), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 2.13(3H, s), 1.31(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
84	CDCl ₃	13.24(1H, broad), 9.21(1H, s), 8.98(1H, s), 8.74(1H, s), 8.00(1H, dd, J=8.4Hz, 2.1Hz), 7.73(1H, d, J=2.4Hz), 7.66(1H, d, J=1.5Hz), 7.34(1H, d, J=8.4Hz), 6.43(1H, t, J=2.1Hz), 3.53(1H, dq, J=14.1Hz, 7.2Hz), 3.39(1H, dq, J=14.1Hz, 7.2Hz), 2.03(3H,s), 1.36(3H, t, 7.2Hz)	154-158
85	CDCl ₃	14.90(1H, broad), 9.43(1H,s), 8.80(1H, s), 8.74(1H, d, J=4.8Hz), 8.07(1H, d, J=8.4Hz), 7.79(2H, s), 7.49(1H, s), 7.47(1H, s)	148-153
86	CDCl ₃	9.08(1H, s), 8.80(1H, d, J=5.1Hz), 8.46(1H, d, J=5.1Hz), 7.87(2H, s), 7.75(1H, d, J=5.1Hz), 7.33(1H, s), 7.15(1H, d, J=5.1Hz)	127-130

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 0】

87	CDCl ₃	13.35(1H, broad), 9.34(1H, s), 8.70(1H, d, J=4.2Hz), 8.64(1H, d, J=4.8Hz), 7.79(2H, s), 7.49(1H, s), 7.43(1H, d, J=4.8Hz), 7.37(1H, d, J=4.2Hz), 2.09(3H, s)	185-191
88	CDCl ₃	10.36(1H, broad), 9.27(1H, d, J=2.1Hz), 8.94(1H, d, J=2.1Hz), 8.69(1H,s), 7.90(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.18(1H, d, J=2.4Hz), 7.00(1H, broad), 4.00(2H, q, J=7.5Hz), 3.26(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	181-186
89	CDCl ₃	9.95(1H, broad), 8.99(1H, d, J=2.1Hz), 8.74(1H, d, J=2.1Hz), 8.58(1H, d, J=2.4Hz), 8.29(1H, d, J=2.1Hz), 8.23(1H, broad), 8.05(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.85(1H, d, J=1.5Hz), 7.43(1H, d, J=8.7Hz), 6.64(1H, t, J=2.1Hz), 3.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	185-188
90	CDCl ₃	10.69(1H, broad), 8.64(1H, d, J=2.1Hz), 8.63-8.57(2H, m), 8.18(1H, d, J=2.1Hz), 8.08(1H, d, J=2.7Hz), 7.96(1H, dd, J=8.4Hz, 2.1Hz), 7.83(1H, d, J=1.5Hz), 6.59(1H, t, J=2.1Hz), 3.07(2H, q, J=7.5Hz), 2.17(3H, s), 1.49(3H, t, J=7.5Hz)	151-157
91	CDCl ₃	9.29(1H, d, J=2.4Hz), 8.78(1H, d, J=2.4Hz), 8.68(1H, s), 8.10(1H, d, J=2.4Hz), 7.92-7.83(2H, m), 7.30-7.14(1H, m), 6.62(1H, t, J=2.1Hz), 4.08(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	188-192
93	CDCl ₃	10.28(1H, broad), 8.55(1H, s), 8.52(1H, d, J=2.1Hz), 7.83(1H, d, J=2.1Hz), 7.79(1H, d, J=2.4Hz), 7.76-7.66(2H, m), 6.82(1H, d, J=8.4Hz), 6.42(1H, t, J=2.1Hz), 3.07(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	86-91
94	CDCl ₃	12.88(1H, s), 8.69(1H,s), 8.50(1H, s), 8.00-7.70(3H, m), 7.68(1H, d, J=1.5Hz), 7.30-7.15(1H, m), 6.39(1H, t, J=2.1Hz), 3.05(2H, q, J=7.5Hz), 2.13(3H, s), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	オイル
95	CDCl ₃	10.42(1H, broad), 9.09(1H, d, J=1.8Hz), 8.61(1H, s), 8.54(1H, d, J=2.1Hz), 7.87(1H, d, J=2.1Hz), 7.80-7.70(2H, m), 7.00-6.80(1H, m), 6.46(1H, t, J=2.1Hz), 3.26(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	127-131

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 1】

96	CDCl ₃	13.12(1H, broad), 9.04(1H, s), 8.75(1H,s), 8.42(1H, s), 7.95(1H, d, J=7.8Hz), 7.83(1H, d, J=1.8Hz), 7.69(1H, s), 7.30-7.25(1H, m), 6.45(1H, t, J=2.1Hz), 3.25(2H, q, J=7.5Hz), 2.17(3H, s), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
97	CDCl ₃	10.39(1H, broad), 9.12(1H, d, J=2.1Hz), 8.58(1H, s), 8.32(1H, d, J=2.4Hz), 8.07(1H, d, J=2.7Hz), 7.89(1H, d, J=2.4Hz), 7.82(1H, d, J=1.5Hz), 7.78-7.65(2H, m), 6.89(1H, d, J=7.8Hz), 6.58(1H, t, J=2.1Hz), 6.45(1H, t, J=2.1Hz)	161-165
98	CDCl ₃	12.98(1H, broad), 9.00(1H,s), 8.73(1H, s), 8.40-8.28(1H, m), 8.06(1H, d, J=2.1Hz), 7.99-7.89(1H, m), 7.85(1H,s), 7.80(1H, d, J=1.2Hz), 7.70(1H, s), 7.28(1H,s), 6.56(1H, t, J=2.1Hz), 6.43(1H, s), 2.14(3H, s)	アモルファス
99	CDCl ₃	10.09(1H, broad), 8.65(1H, d, J=2.1Hz), 8.52(1H, d, J=5.4Hz), 8.15(1H, d, J=2.4Hz), 8.04(1H, d, J=2.4Hz), 7.81(1H, d, J=1.5Hz), 7.64(1H, s), 7.15(1H, d, 5.4Hz), 6.57(1H, d, J=1.8Hz), 3.01(2H, q, J=7.5Hz), 1.48(3H, t, J=7.5Hz)	—
100	CDCl ₃	10.37(1H, broad), 9.29(1H, d, J=2.4Hz), 8.77(1H, d, J=5.1Hz), 8.56(1H, d, J=5.1Hz), 8.10(1H, d, J=2.4Hz), 7.85(1H, d, J=1.5Hz), 7.31(1H,s), 7.20(1H, d, J=4.2Hz), 6.61(1H, t, J=2.1Hz), 4.09(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	187-194
101	CDCl ₃	13.40(1H, broad), 9.23(1H, d, J=2.4Hz), 8.68(1H, d, J=5.4Hz), 8.62(1H, d, J=2.4Hz), 8.07(1H, d, J=2.4Hz), 7.83(1H, d, J=1.5Hz), 7.48(1H,s), 7.40(1H, d, J=5.1Hz), 6.59(1H, t, J=1.8Hz), 3.51(2H, q, J=7.5Hz), 2.22(3H, s), 1.37(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
102	CDCl ₃	10.06(1H, broad), 9.08(1H, d, J=2.1Hz), 8.65(1H, s), 8.40(1H, d, J=2.1Hz), 7.90(2H, s), 7.86(1H, dd, J=8.7, 2.7Hz), 7.45(1H, d, J=8.4Hz), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.48(3H, t, J=7.5Hz)	—
103	CDCl ₃	9.55(1H, d, J=2.4Hz), 9.18(1H, d, J=1.8Hz), 8.68(1H, s), 8.05-7.92(3H, m), 7.88(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 7.20(1H, d, J=8.7Hz), 4.07(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	183-191

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 2】

104	CDCl ₃	10.10(1H, broad), 8.69(1H, s), 8.68-8.62(2H, m), 8.19(1H, s), 8.08(1H, d, J=2.4Hz), 7.88(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.80(1H, broad), 7.47(1H, d, J=8.7Hz), 2.98(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	—
105	CDCl ₃	10.55(1H, broad), 9.27(1H, d, J=2.4Hz), 8.91-8.76(2H, m), 8.69(1H, s), 8.23(1H, s), 7.89(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.21(1H, d, J=7.5Hz), 4.08(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	128-133
106	CDCl ₃	13.40(1H, broad), 9.56(1H, d, J=2.1Hz), 9.00(1H, d, J=2.1Hz), 8.80(1H, s), 8.01(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 7.93(2H, s), 7.38(1H, d, J=8.7Hz), 3.51(2H, q, J=7.5Hz), 2.22(3H, s), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	187-191
107	アセトン-d ₆	10.10(1H, broad), 8.70-8.60(2H, m), 8.15(1H, d, J=2.1Hz), 8.03(1H, d, J=2.7Hz), 7.86(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.81(1H, d, J=1.8Hz), 7.46(1H, d, J=8.1Hz), 6.57(1H, t, J=2.1Hz), 3.00(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	—
108	CDCl ₃	13.37(1H, broad), 9.22(1H, d, J=2.4Hz), 8.80(1H, s), 8.62(1H, d, J=2.4Hz), 8.07(1H, d, J=2.4Hz), 8.00(1H, dd, J=8.4Hz, 2.1Hz), 7.83(1H, d, J=1.5Hz), 7.37(1H, d, J=2.4Hz), 6.59(1H, t, J=1.8Hz), 3.51(2H, q, J=7.5Hz), 2.21(3H, s), 1.36(3H, t, J=7.5Hz)	201-207
109	CDCl ₃	10.15(1H, broad), 9.28(1H, d, J=2.4Hz), 8.79(1H, d, J=2.4Hz), 8.10(1H, d, J=2.4Hz), 7.85(1H, d, J=1.5Hz), 7.82(1H, d, J=7.8Hz), 7.38(1H, d, J=7.5Hz), 7.31(1H, d, J=7.8Hz), 6.61(1H, t, J=1.8Hz), 4.11(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	200-205
110	CDCl ₃	13.44(1H, broad), 9.22(1H, d, J=2.4Hz), 8.63(1H, d, J=2.4Hz), 8.07(1H, d, J=2.4Hz), 7.97(1H, d, J=7.8Hz), 7.83(1H, d, J=1.5Hz), 7.57(1H, d, J=7.5Hz), 7.46(1H, d, J=8.1Hz), 6.59(1H, t, J=2.4Hz), 3.54(2H, q, J=7.5Hz), 2.20(3H, s), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
111	CDCl ₃	14.77(1H, broad), 9.26(1H, s), 8.83(1H, s), 8.66(1H, d, J=2.4Hz), 8.13-8.06(2H, m), 7.85(1H, d, J=1.5Hz), 7.47(1H, d, J=8.1Hz), 6.61(1H, t, J=1.8Hz), 3.51(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 3】

112	CDCl ₃	14.50(1H, broad), 9.25(1H, d, J=2.4Hz), 8.86(1H, d, J=0.4Hz), 8.68(1H, d, J=2.4Hz), 8.10(1H, d, J=2.7Hz), 8.04(1H, dd, J=5.7Hz, 2.4Hz), 8.00-7.92(2H, m), 7.81(1H, d, J=1.5Hz), 7.66-7.42(4H, m), 6.56(1H, t, J=2.1Hz), 3.55(2H, q, J=7.5Hz), 1.36(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
113	CDCl ₃	9.20(1H, d, J=2.4Hz), 8.98-8.91(1H, m), 8.54(1H, d, J=2.4Hz), 8.14(1H, dd, J=8.1Hz, 2.4Hz), 8.05(1H, d, J=2.4Hz), 7.96(1H, d, J=8.1Hz), 7.82(1H, d, J=1.8Hz), 6.58(1H, t, J=2.4Hz), 3.59(2H, q, J=7.5Hz), 1.83-1.68(1H, m), 1.42(3H, t, J=7.5Hz), 1.21-1.10(1H, m), 0.92-0.71(8H, m)	アモルファス
114	CDCl ₃	13.67(1H, broad), 9.22(1H, d, J=2.4Hz), 8.83-8.79(1H, m), 8.61(1H, d, J=2.4Hz), 8.06(1H, d, J=2.7Hz), 8.00(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.82(1H, d, J=1.5Hz), 7.38(1H, d, J=8.4Hz), 6.58(1H, t, J=2.4Hz), 3.49(2H, q, J=7.5Hz), 1.73-1.61(1H, m), 1.35(3H, t, J=7.5Hz), 1.09-1.01(2H, m), 1.00-0.91(2H, m)	204-207
115	CDCl ₃	10.09(1H, broad), 8.69(1H, d, J=2.1Hz), 8.65(1H, s), 8.04(1H, d, J=2.7Hz), 8.02(1H, d, J=2.1Hz), 7.88(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.47(1H, d, J=8.4Hz), 7.21(1H, t, J=6.6Hz), 7.13(1H, d, J=2.7Hz), 4.17(1H, dq, J=9.0Hz, 6.6Hz), 4.14(1H, dq, J=9.0Hz, 6.6Hz), 3.00(2H, q, J=7.5Hz), 1.48(3H, t, J=7.5Hz)	206-212
116	CDCl ₃	10.42(1H, broad), 9.21(1H, d, J=2.4Hz), 8.85(1H, d, J=2.4Hz), 8.69(1H, s), 8.14(1H, d, J=2.4Hz), 7.89(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.37-7.25(1H, m), 7.21(1H, d, J=8.7Hz), 7.12(1H, d, J=2.7Hz), 4.25-4.03(4H, m), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	123-129
117	DMSO-d ₆	9.98(1H, broad), 9.55(1H, d, J=2.4Hz), 9.15(1H, t, J=6.3Hz), 8.90(1H, s), 8.85(1H, d, J=2.4Hz), 8.68(1H, broad), 8.35(2H, s), 8.18(1H, dd, J=8.7, 2.7Hz), 7.10(1H, d, J=8.4Hz), 4.11(2H, m), 4.00(2H, q, J=7.5Hz), 2.50(3H, t, J=7.2Hz)	—
118	DMSO-d ₆	9.99(1H, broad), 9.55(1H, d, J=2.4Hz), 9.15(1H, t, J=6.3Hz), 8.89(1H, s), 8.85(1H, d, J=2.4Hz), 8.66(1H, broad), 8.35(2H, s), 8.18(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.10(1H, d, J=8.4Hz), 4.20-3.92(4H, m), 1.26(3H, t, J=7.5Hz)	209-215

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 4】

119	CDCl ₃	10.12(1H, broad), 8.69-8.63(2H, m), 8.22(1H, d, J=2.1Hz), 8.13(1H, d, J=1.2Hz), 7.94(1H, d, J=2.1Hz), 7.88(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.48(1H, d, J=8.4Hz), 2.99(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	—
120	CDCl ₃	10.40(1H, broad), 9.38(1H, d, J=2.4Hz), 8.84(1H, d, J=2.4Hz), 8.69(1H, s), 8.22(1H, 1H, d, J=1.2Hz), 7.97(1H, d, J=1.2Hz), 7.90(1H, dd, J=8.7Hz, 2.7Hz), 7.21(1H, d, J=8.7Hz), 7.10(1H, broad), 4.18-4.02(2H, m), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	175-179
121	CDCl ₃	10.19(1H, broad), 8.91(1H, s), 8.67(1H, d, J=9.0Hz), 8.56(1H, s), 8.51(1H, d, J=0.9Hz), 7.97(1H, d, J=2.1Hz), 7.92(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 2.90(2H, q, J=7.5Hz), 1.32(3H, t, J=7.5Hz)	64-67
122	CDCl ₃	9.92(1H, s), 8.77(1H, d, J=1.5Hz), 8.61(1H, s), 8.56(1H, d, J=9.0Hz), 8.37(1H, d, J=2.1Hz), 7.95(1H, dd, J=9.0Hz, 2.1Hz), 3.27(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	145-146
123	CDCl ₃	9.05(1H, d, J=1.8Hz), 8.72(1H, d, J=2.4Hz), 8.48(1H, s), 8.06(1H, s), 8.99(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 3.10(2H, q, J=7.5Hz), 2.16(3H, s), 1.25(3H, t, J=7.5Hz)	101-102
124	CDCl ₃	9.98(1H, broad), 8.58(1H, s), 7.89(1H, d, J=1.8Hz), 7.80(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.42(1H, broad), 6.82(1H, d, J=2.4Hz), 3.09(6H, s), 2.89(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	172-173
125	CDCl ₃	10.21(1H, broad), 8.62(1H, s), 8.17(1H, d, J=2.7Hz), 7.82(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.73(1H, d, J=3.0Hz), 7.29(1H, d, J=2.4Hz), 4.07(2H, q, J=7.5Hz), 3.14(6H, s), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	165-168
126	CDCl ₃	10.09(1H, broad), 8.64(1H, s), 8.57(1H, d, J=1.5Hz), 7.94-7.76(2H, m), 7.66-7.59(2H, m), 7.58-7.39(4H, m), 2.99(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	135-136
127	CDCl ₃	9.04(1H, 1H, d, J=1.8Hz), 8.76-8.65(2H, m), 7.88(1H, d, J=7.8Hz), 7.72-7.64(2H, m), 7.60-7.46(4H, m), 7.25-7.15(1H, m), 4.03(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	192-194

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 5】

128	CDCl ₃	10.06(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.52(1H, d, J=1.8Hz), 7.85(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.80(1H, d, J=1.8Hz), 7.56(2H, d, J=8.7Hz), 7.45(1H, d, J=8.1Hz), 7.04(2H, d, J=8.7Hz), 3.88(3H, s), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	150-155
129	CDCl ₃	10.30(1H, broad), 8.99(1H, d, J=2.1Hz), 8.71-8.61(2H, m), 7.87(1H, dd, J=8.4Hz, 2.1Hz), 7.63(2H, d, J=8.7Hz), 7.20(1H, d, J=7.5Hz), 7.07(2H, d, J=8.7Hz), 4.03(2H, q, J=7.5Hz), 3.89(3H, s), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	191-199
130	CDCl ₃	10.06(1H, broad), 8.64(1H, s), 8.51(1H, d, J=1.8Hz), 7.85(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.79(1H, d, J=1.8Hz), 7.59-7.43(5H, m), 2.96(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	173-175
131	CDCl ₃	10.34(1H, broad), 9.00(1H, d, J=2.1Hz), 8.68(1H, s), 8.66(1H, s), 7.88(1H, d, J=0.9Hz), 7.62(2H, d, J=8.7Hz), 7.53(2H, d, J=8.7Hz), 7.20(1H, d, J=7.2Hz), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	-
132	CDCl ₃	10.07(1H, bs), 8.65(1H, s), 8.48(1H, d, J=1.5Hz), 7.86(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.86(1H, broad), 7.76(1H, d, J=1.5Hz), 7.51-7.40(4H, m), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	181-184
133	CDCl ₃	8.99(1H, d, J=2.1Hz), 8.69(1H, s), 8.65(1H, s), 7.89(1H, dd, J=8.1Hz, 1.5Hz), 7.55(2H, d, J=1.2Hz), 7.51(1H, t, J=1.8Hz), 7.20(1H, d, J=8.1Hz), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	188-190
134	CDCl ₃	10.08(1H, broad), 8.65(1H, s), 8.30(1H, d, J=1.5Hz), 7.86(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.82(1H, d, J=8.4Hz), 7.70-7.53(3H, m), 7.45(1H, d, J=8.7Hz), 7.36(1H, d, J=7.5Hz), 2.87(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	117-121
135	CDCl ₃	10.30(1H, broad), 8.79(1H, s), 8.69(1H, s), 8.50(1H, s), 7.96-7.78(2H, m), 7.77-7.56(2H, m), 7.44-7.34(1H, m), 7.26-7.16(1H, m), 4.03(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	188-194
136	CDCl ₃	10.07(1H, broad), 8.65(1H, s), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 7.91-7.60(7H, m), 7.46(1H, d, J=2.1Hz), 2.98(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	144-147

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 6】

137	CDCl ₃	10.40(1H, broad), 9.05(1H, d, J=2.1Hz), 8.71(1H, d, J=1.8Hz), 8.69(1H, s), 7.95-7.65(6H, m), 7.21(1H, d, J=8.7Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	145-150
138	CDCl ₃	10.07(1H, broad), 8.65(1H, s), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 7.86(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.84(1H, d, J=2.1Hz), 7.78(2H, d, J=8.1Hz), 7.72(2H, d, J=8.1Hz), 7.46(1H, d, J=8.4Hz), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	185-192
139	CDCl ₃	10.17(1H, broad), 9.05(1H, d, J=2.1Hz), 8.71(1H, d, J=1.5Hz), 8.69(1H, s), 7.95-7.75(6H, m), 7.20(1H, d, J=2.4Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	134-146
140	CDCl ₃	13.41(1H, s), 9.04(1H, d, J=2.1Hz), 8.81(1H, s), 8.51(1H, d, J=2.1Hz), 8.01(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.85-7.75(4H, m), 7.38(1H, d, J=8.7Hz), 3.49(2H, q, J=7.5Hz), 2.23(3H, s), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
141	CDCl ₃	10.06(1H, broad), 8.64(1H, s), 8.52(1H, d, J=1.8Hz), 7.86(1H, dd, J=8.4Hz, 2.4Hz), 7.80(1H, d, J=1.8Hz), 7.64(2H, d, J=8.4Hz), 7.45(1H, d, J=8.4Hz), 7.37(2H, q, J=8.4Hz), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	136-141
142	CDCl ₃	10.14(1H, broad), 9.01(1H, d, J=2.1Hz), 8.68(2H, s), 7.88(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 7.71(2H, d, J=8.7Hz), 7.40(1H, d, J=8.7Hz), 7.20(1H, d, J=8.1Hz), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	128-134
143	CDCl ₃	10.09(1H, broad), 8.65(1H, s), 8.29(1H, d, J=1.2Hz), 8.08(1H, s), 7.92(1H, d, J=8.1Hz), 7.88(1H, broad), 7.87(1H, dd, J=8.1Hz, 2.4Hz), 7.65(1H, s), 7.53(1H, d, J=8.4Hz), 7.46(1H, d, J=8.4Hz), 2.86(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	129-143
144	CDCl ₃	8.80(1H, d, J=1.5Hz), 8.70(1H, s), 8.51(1H, s), 8.11(1H, s), 7.97(1H, d, J=7.8Hz), 7.90(1H, d, J=8.7Hz), 7.57(1H, d, J=8.1Hz), 7.28-7.20(1H, m), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.5Hz)	—
145	CDCl ₃	10.11(1H, broad), 8.66(1H, s), 8.56(1H, s), 8.02(2H, s), 7.98(1H, s), 7.87(1H, d, J=7.5Hz), 7.82(1H, s), 7.49(1H, m), 2.99(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	—
146	CDCl ₃	9.07(1H, d, J=1.8Hz), 8.74(1H, s), 8.70(1H, s), 8.09(2H, s), 8.03(1H, s), 7.90(1H, d, J=9.3Hz), 7.25-7.15(1H, m), 4.07(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	—

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 7】

147	CDCl ₃	10.06(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.59(1H, d, J=1.8Hz), 7.90–7.80(2H, m), 7.51–7.37(3H, m), 7.17(1H, dd, J=5.1Hz, 3.6Hz), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	138–140	
148	CDCl ₃	9.02(1H, d, J=2.1Hz), 8.67(2H, s), 7.87(1H, dd, J=8.7Hz, 2.1Hz), 7.56(1H, dd, J=3.6Hz, 0.9Hz), 7.51(1H, d, J=5.1Hz), 7.21(1H, d, J=3.6Hz), 7.19(1H, d, J=3.6Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	146–147	
149	CDCl ₃	10.08(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.58(1H, d, J=1.8Hz), 7.89(1H, broad), 7.88–7.80(2H, m), 7.61(1H, dd, J=3.0Hz, 1.2Hz), 7.52–7.40(3H, m), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	143–146	10
150	CDCl ₃	9.04(1H, d, J=2.1Hz), 8.67(2H, s), 7.87(1H, dd, J=8.4Hz, 2.1Hz), 7.74(1H, dd, J=2.7Hz, 1.5Hz), 7.53(1H, dd, J=4.8Hz, 2.7Hz), 7.50(1H, dd, J=4.8Hz, 0.9Hz), 7.20(1H, d, J=7.8Hz), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	—	
151	CDCl ₃	10.08(1H, broad), 8.89(1H, d, J=2.1Hz), 8.71(1H, dd, J=4.8, 1.5Hz), 8.65(1H, s), 8.55(1H, d, J=2.1Hz), 7.98–7.80(4H, m), 7.53–7.41(2H, m), 2.97(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	148–151	20
152	CDCl ₃	10.39(1H, broad), 9.05(1H, d, J=1.8Hz), 8.94(1H, d, J=1.8Hz), 8.75(1H, dd, J=4.8Hz, 1.2Hz), 8.71(1H, d, J=1.5Hz), 8.67(1H, s), 7.99(1H, dt, J=8.1Hz, 1.8Hz), 7.88(1H, dd, J=8.1Hz, 2.1Hz), 7.50(1H, dd, J=8.1Hz, 4.8Hz), 7.21(1H, d, J=2.4Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	169–171	
153	CDCl ₃	10.10(1H, broad), 8.76(2H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 8.65(1H, s), 8.58(1H, d, J=2.1Hz), 8.03–7.76(3H, m), 7.54(2H, dd, J=4.5, 1.5Hz), 7.47(1H, d, J=8.7Hz), 2.98(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	150–153	30
154	CDCl ₃	9.08(1H, d, J=2.1Hz), 8.81(2H, d, J=5.1Hz), 8.74(1H, s), 8.69(1H, s), 7.89(1H, dd, J=9.0Hz, 2.1Hz), 7.60(2H, dd, J=4.5Hz, 1.5Hz), 7.30–7.20(1H, m), 4.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	203–205	
155	CDCl ₃	10.06(1H, broad), 9.32(1H, s), 9.01(2H, s), 8.66(1H, s), 8.55(1H, d, J=1.8Hz), 7.87(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.82(1H, d, J=1.8Hz), 7.45(1H, d, J=8.7Hz), 2.97(2H, q, 7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	195–197	40

【表 1 4 - 1 8】

156	CDCl ₃	10.45(1H, broad), 9.37(1H, s), 9.07(2H, s), 9.06(1H, d, J=2.1Hz), 8.74(1H, d, J=1.5Hz), 8.70(1H, s), 7.89(1H, dd, J=8.4, 2.1Hz), 7.21(1H, d, J=8.1Hz), 4.06(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	—
157	CDCl ₃	10.02(1H, broad), 8.63(1H, s), 8.09(1H, d, J=2.4Hz), 7.84(1H, dd, J=8.7, 2.4Hz), 7.72(1H, broad), 7.66(1H, d, J=8.7Hz), 7.41(2H, d, J=8.4Hz), 7.34(1H, d, J=2.Hz), 7.14(2H, d, J=8.7Hz), 2.78(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, d=7.5Hz)	—
158	CDCl ₃	8.67(1H, s), 8.59(1H, d, J=2.7Hz), 8.14(1H,s), 7.93-7.83(1H, m), 7.73(1H, s), 7.70(1H, s), 7.25-7.11(3H, m), 4.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.37(3H, t, J=7.5Hz)	179-189
159	CDCl ₃	9.46(1H, s), 9.01(1H, s), 8.69(1H, s), 7.97(1H, d, J=8.7Hz), 7.82(1H, dd, J=8.7Hz, 1.8Hz), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 3.56(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	209-211
160	CDCl ₃	9.54(1H, s), 9.45(1H, s), 8.99(1H, s), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.84(1H, dd, J=9.3Hz, 1.8Hz), 3.94(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.66(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.47(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.18(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
161	CDCl ₃	9.58(2H, s), 8.98(1H,s), 7.94(1H, d, J=9.6Hz), 7.82(1H, dd, J=9.6Hz, 1.8Hz), 3.67(4H, q, J=7.5Hz), 1.36(6H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
162	CDCl ₃	8.73(1H,s), 8.68(1H, d, J=5.1Hz), 7.89(1H, d, J=5.1Hz), 7.84-7.75(2H, m), 7.69-7.60(2H, m), 6.52(1H, t, J=2.1Hz), 3.20(2H, q, J=7.5Hz), 1.36(3H, t, J=7.5Hz)	117-120
163	CDCl ₃	8.94(1H, d, J=4.8Hz), 8.74(1H,s), 8.47(1H, d, J=4.8Hz), 7.89(1H, d, J=2.7Hz), 7.82(1H, d, J=9.6Hz), 7.72(1H, d, 1.8Hz), 7.69(1H, dd, J=9.6Hz, 1.8Hz), 6.55(1H, dd, J=2.4Hz, 1.2Hz), 3.46(2H, q, J=7.5Hz), 1.37(3H, t, J=7.5Hz)	178-181
164	CDCl ₃	9.06(1H,d, J=4.8Hz), 8.78(1H, s), 8.31(1H, d, J=4.8Hz), 7.84(1H, d, J=9.6Hz), 7.77(1H, d, J=1.8Hz), 7.71(1H, dd, J=9.6Hz, 1.8Hz), 7.64(1H, d, J=2.4Hz), 6.51(1H, t, J=2.1Hz), 3.21(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.09(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 1.34(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 1 9】

165	CDCl ₃	8.79(1H, s), 8.63(1H, s), 7.95(1H, s), 7.82(1H, d, J=9.3Hz), 7.68(1H, d, J=2.1Hz), 7.67(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 7.62(1H, d, J=2.1Hz), 6.45(1H, dd, J=2.4Hz, 2.1Hz), 3.27(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	119-122
166	CDCl ₃	9.05(1H, s), 8.88(1H, s), 8.84(1H, s), 7.88(1H, d, J=9.3Hz), 7.77(1H, d, J=2.4Hz), 7.74(1H, dd, J=9.3Hz, 2.4Hz), 7.71(1H, d, J=2.4Hz), 6.50(1H, t, J=2.4Hz), 3.51(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	205-210
167	CDCl ₃	8.91(1H, s), 8.86(1H, s), 8.71(1H, s), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.75(1H, d, J=1.8Hz), 7.72(1H, dd, J=9.3Hz, 1.8Hz), 7.68(1H, d, J=2.4Hz), 6.48(1H, d, J=2.1Hz), 3.27(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.04(1H, dq, 13.2Hz, 7.5Hz), 1.29(3H, t, J=7.5Hz)	153-156
168	CDCl ₃	8.83(1H, s), 8.81(1H, s), 8.64(1H, s), 8.63(1H, d, J=2.7Hz), 7.84(1H, d, J=9.3Hz), 7.80(1H, d, J=1.5Hz), 7.73(1H, d, J=1.5Hz), 7.71-7.64(2H, m), 6.53(1H, dd, J=2.7Hz, 1.8Hz), 6.48(1H, d, J=2.1Hz)	211-214
169	CDCl ₃	9.35(1H, s), 9.21(1H, s), 8.89(1H, s), 7.87(1H, d, J=9.6Hz), 7.74(1H, dd, J=9.6Hz, 1.5Hz), 7.59(1H, d, J=1.5Hz), 7.51(1H, d, J=1.5Hz), 6.31(1H, dd, J=2.4Hz, 2.1Hz), 3.68(2H, q, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
170	CDCl ₃	9.03(1H, s), 8.88(1H, d, J=4.8Hz), 8.58(1H, d, J=7.2Hz), 8.10(1H, d, J=4.8Hz), 8.01(1H, s), 7.84(2H, s), 7.22(1H, dd, J=7.2Hz, 1.8Hz)	130-132
171	CDCl ₃	9.35(1H, d, J=1.5Hz), 9.09(1H, d, J=2.4Hz), 9.07(1H, s), 8.03(1H, d, J=9.3Hz), 7.85(1H, dd, J=9.3Hz, 1.8Hz), 3.51(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.29(2H, q, J=7.5Hz), 3.06(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz), 1.38(3H, t, J=7.5Hz)	177-182
172	CDCl ₃	9.43(1H, d, J=2.1Hz), 9.03(1H, s), 8.99(1H, d, J=2.1Hz), 7.98(1H, d, J=9.3Hz), 7.82(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 4.06(2H, q, J=7.5Hz), 3.31(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	195-203
173	CDCl ₃	8.96(1H, s), 8.39(1H, d, J=2.7Hz), 7.88(1H, d, J=9.3Hz), 7.70(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 7.67(1H, d, J=2.7Hz), 4.00(2H, q, J=7.5Hz), 3.16(6H, s), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 2 0】

174	CDCl ₃	9.03(1H, s), 8.97(1H, d, J=1.8Hz), 8.52(1H, d, J=1.8Hz), 7.96(1H, d, J=9.6Hz), 7.86(1H, d, J=7.8Hz), 7.78(1H, dd, J=9.6Hz, 1.8Hz), 7.75-7.59(2H, m), 7.44(1H, d, J=7.8Hz), 4.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.41(3H, t, J=7.5Hz)	189-192
175	CDCl ₃	9.22(1H, d, J=2.4Hz), 9.03(1H, s), 8.73(1H, d, J=2.4Hz), 8.00-7.88(3H, m), 7.83-7.67(3H, m), 4.06(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	183-186
176	CDCl ₃	9.23(1H, d, J=2.1Hz), 9.02(1H, s), 8.74(1H, d, J=2.1Hz), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.89-7.79(4H, m), 7.78(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
177	CDCl ₃	9.20(1H, d, J=2.1Hz), 9.02(1H,s), 8.70(1H, d, J=2.1Hz), 7.96(1H, d, J=9.3Hz), 7.82-7.72(3H, m), 7.42(2H, d, J=8.1Hz), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	153-155
178	CDCl ₃	9.23(1H, d, J=1.2Hz), 9.04(1H, s), 8.75(1H, d, J=2.1Hz), 8.14(2H, s), 8.05(1H, s), 7.98(1H, d, J=9.6Hz), 7.80(1H, dd, J=9.3, 1.5Hz), 4.07(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	187-191
179	CDCl ₃	9.38(1H, s), 9.23(1H, d, J=1.8Hz), 9.12(2H, s), 9.03(1H, s), 8.76(1H, d, J=2.1Hz), 7.97(1H, d, J=9.3Hz), 7.80(1H, dd, J=9.3, 1.5Hz), 4.08(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	265-267
180	CDCl ₃	9.44(1H, d, J=2.1Hz), 9.01(1H, s), 8.81(1H, d, J=2.4Hz), 8.14(1H, d, J=2.4Hz), 7.95(1H, d, J=9.3Hz), 7.87(1H, d, J=1.8Hz), 7.77(1H, dd, J=9.3Hz, 1.8Hz), 6.63(1H, dd, J=2.4Hz, 1.8Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	223-226
181	CDCl ₃	9.74(1H, d, J=2.1Hz), 9.20(1H, d, J=2.1Hz), 9.02(1H,s), 8.01-7.92(3H, m), 7.78(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 4.06(2H, q, J=7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
182	CDCl ₃	9.27(1H, s), 8.90(1H,s), 8.54(1H, d, J=2.1Hz), 7.90(1H, d, J=9.6Hz), 7.78-7.71(2H, m), 7.63(1H, d, J=2.7Hz), 6.46(1H, t, J=2.1Hz), 3.29(2H, q, J=7.5Hz), 1.42(3H, t, J=7.5Hz)	188-193

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 2 1】

183	CDCl ₃	9.27(1H, s), 8.88(1H,s), 8.39(1H, d, J=2.1Hz), 8.12(1H, d, J=2.1Hz), 7.87(1H, d, J=9.3Hz), 7.84(1H, d, J=1.8Hz), 7.75(1H, d, J=1.8Hz), 7.69(1H, dd, J=9.3Hz, 1.5Hz), 7.64(1H, d, J=2.4Hz), 6.44(1H, t, J=2.1Hz), 5.59(1H,dd, J=2.7Hz, 1.8Hz)	167-171
184	CDCl ₃	9.43(1H, s), 8.53(1H, s), 8.19(1H, dd, J=9.3Hz, 2.1Hz), 7.87(1H, s), 7.85(1H, d, J=2.1Hz), 3.21(2H, q, J=7.2Hz), 3.02(2H, q, J=7.5Hz), 1.39(3H, t, J=7.2Hz), 1.34(3H, t, J=7.5Hz)	172-175
185	CDCl ₃	9.47(1H, s), 8.56(2H, s), 8.21(1H, dd, J=9.3Hz, 2.1Hz), 7.82(1H, d, J=2.1Hz), 2.96(4H, q, J=7.5Hz), 1.26(6H, t, J=7.5Hz)	148-154
186	CDCl ₃	9.44(1H, s), 9.36(1H, s), 8.52(1H, s), 8.30(1H, dd, J=9.3Hz, 2.1Hz), 7.85(1H, d, J=9.3Hz), 3.91(2H, q, J=7.5Hz), 3.50(2H, d, J=7.2Hz), 1.48(3H, t, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.2Hz)	127-132
187	CDCl ₃	9.34(1H,s), 8.63(1H, s), 8.08(1H, d, J=9.3Hz), 7.82(1H, s), 7.73(1H, s), 7.56(1H, s), 7.49(1H, d, J=9.3Hz), 6.43(1H, s), 3.26(2H, q, J=7.2Hz), 1.42(3H, t, J=7.2Hz)	148-151
188	CDCl ₃	9.37(1H, s), 8.87(1H, s), 8.53(1H, s), 8.17(1H, dd, J=9.3Hz, 2.1Hz), 7.84(1H, d, 2.1Hz), 7.67(1H, d, J=9.3Hz), 7.64(1H, d, J=1.8Hz), 6.49(1H, t, J=1.8Hz), 3.25(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.02(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 1.28(3H, t, J=7.5Hz)	192-196
189	CDCl ₃	9.39(1H, s), 8.98(1H, s), 8.64(1H, s), 8.18(1H, dd, J=9.3Hz, 2.4Hz), 7.87(1H, d, J=2.4Hz), 7.66(1H, d, J=9.3Hz), 7.63(1H, d, J=2.4Hz), 6.51(1H, t, J=2.4Hz), 3.45(2H, q, J=7.5Hz), 1.37(3H, t, J=7.5Hz)	198-201
190	CDCl ₃	9.39(1H, s), 8.70(1H, s), 8.67(1H, s), 8.16(1H, dd, J=9.3Hz, 2.4Hz), 7.80(1H, d, J=2.1Hz), 7.74(1H, d, J=9.0Hz), 7.45(1H, d, J=1.5Hz), 6.36(1H, t, J=1.5Hz), 3.04(2H, q, J=7.2Hz), 1.30(3H, t, J=7.2Hz)	アモルファス
191	CDCl ₃	9.38(1H, s), 9.26(1H, s), 9.12(1H, s), 8.14(1H, dd, J=9.3Hz, 2.1Hz), 7.84(1H, d, J=2.1Hz), 7.60(1H, d, J=9.3Hz), 7.50(1H, d, J=1.5Hz), 6.40(1H, d, J=1.5Hz), 3.72(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	236-241

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 2 2】

192	CDCl ₃	9.36(1H, s), 8.64-8.59(3H, m), 8.13(1H, dd, J=8.7Hz, 2.4Hz), 7.80(1H, d, J=2.4Hz), 7.79(1H, d, J=1.8Hz), 7.64-7.57(2H, m), 6.53(1H, dd, J=2.7Hz, 1.8Hz), 6.46(1H, t, J=2.1Hz)	236-244
193	CDCl ₃	9.43(1H, s), 9.38(1H, d, J=2.1Hz), 8.73(1H, d, J=2.1Hz), 8.22(1H, dd, J=9.0Hz, 2.7Hz), 8.12(1H, d, J=2.4Hz), 7.93(1H, d, J=9.0Hz), 7.87(1H, d, J=1.5Hz), 6.63(1H, t, J=2.4Hz), 3.96(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	267-272
194	CDCl ₃	9.45(1H, s), 9.39(1H, d, J=1.8Hz), 8.89(1H, d, J=2.1Hz), 8.27(1H, dd, J=9.3Hz, 2.4Hz), 7.92(1H, d, J=9.3Hz), 3.88(2H, q, J=7.5Hz), 3.28(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	251-255
195	CDCl ₃	9.34(1H, s), 8.66(1H, d, J=2.1Hz), 8.11(1H, dd, J=9.3Hz, 2.1Hz), 7.81-7.73(3H, m), 7.60(1H, d, J=1.8Hz), 6.44(1H, dd, J=2.1Hz, 1.8Hz), 3.10(2H, q, J=7.2Hz), 1.43(3H, t, J=7.2Hz)	155-160
196	アセトン-d6	9.34(1H, s), 8.90(1H, d, J=1.8Hz), 8.52(1H, dd, J=9.0Hz, 2.1Hz), 8.43(1H, d, J=1.8Hz), 8.13(1H, d, J=2.4Hz), 7.82(1H, d, J=9.0Hz), 7.56(1H, d, J=1.8Hz), 6.42(1H, dd, J=2.4Hz, 1.8Hz), 3.30(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 3.07(1H, dq, J=13.2Hz, 7.5Hz), 1.28(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
197	CDCl ₃	9.39(1H, s), 9.18(1H, d, J=1.8Hz), 8.43(1H, d, J=1.8Hz), 8.20(1H, dd, J=9.0Hz, 2.1Hz), 7.87(1H, d, J=2.4Hz), 7.83(1H, d, J=9.0Hz), 7.59(1H, d, J=1.8Hz), 6.49(1H, t, J=2.1Hz), 3.27(2H, q, J=7.5Hz), 1.40(3H, t, J=7.5Hz)	250-254
198	CDCl ₃	9.37(1H, s), 9.14(1H, d, J=2.4Hz), 8.36(1H, d, J=2.4Hz), 8.18-8.09(2H, m), 7.89-7.76(3H, m), 7.60(1H, d, J=1.5Hz), 6.60(1H, t, J=2.1Hz), 6.48(1H, t, J=1.8Hz)	225-227
199	CDCl ₃	8.97(1H, s), 8.44(1H, s), 8.22(1H, s), 7.98(1H, d, J=2.1Hz), 7.86-7.65(2H, m), 7.13(1H, d, J=8.4Hz), 6.54(1H, s), 6.54(1H, s), 3.80-3.30(5H, m), 2.30(3H, s), 1.36(3H, t, J=7.5Hz)	油状
200	CDCl ₃	9.02(1H, s), 8.69(2H, s), 7.89(1H, d, J=6.6Hz), 7.64-7.56(2H, m), 7.51(1H, s), 7.42-7.36(1H, broad), 7.28-7.16(1H, broad), 4.04(2H, q, J=7.5Hz), 1.43(3H, t, J=7.5Hz)	189-193

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 2 3】

201	CDCl ₃	9.05(1H, d, J=2.1Hz), 8.82(1H, broad), 8.52(1H, d, J=2.1Hz), 8.01(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.88-7.70(5H, m), 7.39(1H, d, J=8.4Hz), 7.00(1H, m), 6.02(1H, dd, J=15.3, 1.8Hz), 3.49(2H, q, J=7.5Hz), 2.74(1H, d, J=3.9Hz), 1.96(3H, d, J=7.2Hz), 1.26(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
202	CDCl ₃	12.92(1H, broad), 8.75(1H, s), 8.59(1H, d, J=1.8Hz), 7.99(1H, dd, J=7.8, 2.1Hz), 7.86(1H, d, J=1.8Hz), 7.67-7.58(2H, m), 7.49(1H, d, J=8.7), 7.35(2H, d, J=7.8Hz), 3.00(2H, q, 7.5Hz), 2.23(3H, s), 1.33(3H, t, J=7.5Hz)	-
203	CDCl ₃	8.45(1H, broad), 8.37(1H, broad), 7.85-7.48(4H, m), 7.32(2H, d, J=8.4Hz), 6.94(1H, d, J=8.1Hz), 3.44(3H, s), 2.95(2H, q, J=7.5Hz), 2.32(3H, s), 1.30(3H, t, J=7.2Hz)	-
204	CDCl ₃	8.78(1H, s), 8.45-8.22(2H, broad), 7.76(1H, d, J=7.5Hz), 7.60(2H, d, J=8.7Hz), 7.34(2H, d, J=8.4Hz), 7.14(1H, d, J=8.4Hz), 3.80-3.20(5H, broad), 2.31(3H, s), 1.34(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
205	CDCl ₃	8.81(1H, s), 8.29(1H, s), 8.20(1H, s), 7.90-7.60(5H, m), 7.15(1H, d, J=8.4Hz), 3.80-3.20(5H, m), 2.32(3H, s), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
206	CDCl ₃	8.52(1H, broad), 8.36(1H, broad), 7.85-7.55(6H, m), 7.02(1H, d, J=6.6Hz), 5.37(2H, s), 3.59(3H, s), 2.92(2H, q, J=7.2Hz), 2.43(3H, s), 1.26(3H, t, J=7.2Hz)	油状
207	CDCl ₃	8.85(1H, s), 8.38-8.11(2H, m), 7.88-7.63(5H, m), 7.18(1H, d, J=8.4Hz), 5.52(2H, broad), 3.64(3H, broad), 3.38(2H, broad), 2.41(3H, s), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
208	CDCl ₃	8.49(1H, s), 8.36(1H, s), 7.85-7.50(4H, m), 7.40-7.27(2H, m), 7.01(1H, d, J=6.6Hz), 5.35(2H, s), 3.57(3H, s), 2.91(2H, q, J=7.2Hz), 2.43(3H, s), 1.26(3H, t, J=7.2Hz)	-
209	CDCl ₃	8.71(1H, broad), 8.23(2H, broad), 7.77(1H, d, J=8.4Hz), 7.61(2H, d, J=8.4Hz), 7.40(2H, d, J=8.1Hz), 7.17(1H, d, J=8.4Hz), 5.51(2H, broad), 3.63(3H, broad), 3.58-3.20(2H, broad), 2.41(3H, s), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス
210	CDCl ₃	8.59(1H, d, J=2.1Hz), 8.37(1H, s), 7.80-7.60(6H, m), 7.45(1H, d, J=2.7Hz), 5.59(2H, s), 3.81(2H, q, J=6.9Hz), 2.96(2H, q, J=7.2Hz), 2.29(3H, s), 1.30-1.15(6H, m)	-

10

20

30

40

50

【表 1 4 - 2 4】

211	CDCl ₃	9.03(1H, d, J=2.1Hz), 8.33(1H, d, J=2.1Hz), 8.32(1H, broad), 7.90-7.63(6H, m), 5.52(2H, s), 3.71(2H, q, J=7.5Hz), 3.53(2H, q, J=7.5Hz), 2.22(3H,s), 1.37(3H, t, J=7.5Hz), 1.17(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス	
212	CDCl ₃	8.54(1H, s), 8.32(1H, s), 7.90-7.55(6H, m), 7.13(1H, broad), 4.87(2H, s), 3.01(2H, q, J=7.2Hz), 2.15(3H, s), 1.32(3H, broad)	-	
213	CDCl ₃	8.82(1H, broad), 8.36(1H, broad), 8.16(1H, broad), 7.96-7.62(5H, m), 7.28(1H, d, J=6.3Hz), 4.99(2H, broad), 3.70-3.30(2H, m), 2.36(3H, s), 1.37(3H, t, J=7.5Hz)	アモルファス	10
214	CDCl ₃	9.20(1H, d, J=1.8Hz), 9.02(1H, s), 8.70(1H, d, J=2.4Hz), 7.96(1H, d, J=9.6Hz), 7.78(1H, dd, J=9.3, 1.5Hz), 7.70-7.57(2H, m), 7.55(1H, broad), 7.39(1H, d, J=7.8Hz), 4.05(2H, q, J=7.5Hz), 1.46(3H, t, J=7.5Hz)	191-194	
215	CDCl ₃	9.70(1H, d, J=2.4Hz), 9.44(1H, broad), 9.11(1H, d, J=2.4Hz), 8.23(1H, dd, J=9.0, 2.1Hz), 7.97(2H, s), 7.94(1H, d, J=9.0Hz), 3.97(2H, q, 7.5Hz), 1.47(3H, t, J=7.5Hz)	147-153	
216	CDCl ₃	9.44(1H, broad), 9.17(1H, d, J=2.1Hz), 8.62(1H, d, J=2.1Hz), 8.23(1H, dd, J=9.3, 2.1Hz), 7.97-7.84(3H, m), 7.72(1H, d, J=7.5Hz), 7.71(1H, t, J=7.8Hz), 3.93(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	247-250	20
217	CDCl ₃	9.44(1H, s), 9.18(1H, d, J=2.1Hz), 8.64(1H,d, J=2.1Hz), 8.23(1H, dd, J=9.3, 2.1Hz), 7.93(1H, d, J=9.0Hz), 7.83(4H, s), 3.93(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, =7.5Hz)	219-220	
218	CDCl ₃	9.44(1H, broad), 9.15(1H, d, J=2.1Hz), 8.60(1H, d, J=2.1Hz), 8.23(1H, dd, J=9.3, 2.1Hz), 7.93(1H, d, J=9.3Hz), 7.66-7.57(2H, m), 7.52(1H, broad), 7.39(1H, broad), 3.92(2H, q, J=7.5Hz), 1.45(3H, t, J=7.5Hz)	234-237	30
219	CDCl ₃	9.44(1H, broad), 9.15(1H, d, J=2.1Hz), 8.60(1H, d, J=2.4Hz), 8.23(1H, dd, J=9.3, 2.1Hz), 7.93(1H, d, J=9.3Hz), 7.73(1H, d, J=9.0Hz), 7.42(1H, d, J=8.1Hz), 3.92(2H, q, J=7.5Hz), 1.44(3H, t, J=7.5Hz)	190-194	

【表 1 4 - 2 5】

220	CDCl ₃	13.42(1H, s), 9.00(1H, d, J=2.1Hz), 8.81(1H, s), 8.47(1H, d, J=2.1Hz), 8.01(1H, dd, J=8.4, 2.4Hz), 7.76-7.65(2H, m), 7.45-7.34(3H, m), 3.48(2H, q, J=7.5Hz), 2.23(3H, s), 1.35(3H, t, J=7.5Hz)	-	40
-----	-------------------	------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------	---	----

【 0 1 2 6 】

< 製剤例 >

また、本発明の化合物を有効成分として含有する農薬製剤例を以下に挙げる。

製剤例 1〔水和剤〕

化合物	30重量%
クレー	30重量%

ケイソウ土 3 5 重量 %
 サンエキス P 2 5 2 4 重量 %
 (リグニンスルホン酸カルシウム：日本製紙(株)の商品名)
 ソルポール 8 0 7 0 1 重量 %
 (ラウリル硫酸ナトリウム：東邦化学工業(株)の商品名)
 前記成分を均一に混合し、粉碎して水和剤を得た。

【 0 1 2 7 】

製剤例 2〔粉剤〕

化合物 2 重量 %
 クレー 9 0 重量 %
 タルク 7 重量 %
 ステアリン酸カルシウム 1 重量 %

前記成分を均一に混合して粉剤を得た。

【 0 1 2 8 】

製剤例 3〔乳剤〕

化合物 2 0 重量 %
 N, N - ジメチルホルムアミド 2 0 重量 %
 T - S O L 1 5 0 5 0 重量 %
 (芳香族系溶剤：J X T G エネルギー株式会社の製品名)
 ニューカルゲン C L - H 1 0 重量 %
 (P O E アルキルフェニルエーテル：竹本油脂(株)の製品名)

前記成分を均一に混合し、溶解して乳剤を得た。

【 0 1 2 9 】

製剤例 4〔乳剤 2〕

化合物 5 重量 %
 キシレン 4 2 . 5 重量 %
 D M S O 4 2 . 5 重量 %
 ニューカルゲン 2 0 0 3 1 0 重量 %

(P O E アリルフェニルエーテルホルムアルデヒド縮合物とアルキルベンゼンスルホン酸
 金属塩の混合物：竹本油脂(株)の製品名)

前記成分を均一に混合し、溶解して乳剤を得た。

製剤例 5〔粒剤〕

化合物 5 重量 %
 ベントナイト 4 0 重量 %
 タルク 1 0 重量 %
 クレー 4 3 重量 %
 サンエキス P 2 5 2 2 重量 %

(リグニンスルホン酸カルシウム：日本製紙(株)の商品名)

前記成分を均一に粉碎・混合し、水を加えてよく練合した後、造粒乾燥して粒剤を得た。

【 0 1 3 0 】

製剤例 6〔フロアブル剤〕

化合物 2 5 重量 %
 ソルポール 7 5 5 6 5 重量 %
 (P O E スチリルフェニルエーテル硫酸塩：東邦化学工業(株)の製品名)
 プロピレングリコール 6 重量 %
 ベントナイト 1 重量 %
 キサンタンガム 1 % 水溶液 3 重量 %
 水 6 0 重量 %

キサンタンガム 1 % 水溶液および適当量の水を除いた前記処方の全量を予備混合した後、
 湿式粉碎機にて粉碎した。その後、得られた粉碎物にキサンタンガム 1 % 水溶液および残

10

20

30

40

50

りの水を加え、100重量%のフロアブル剤を得た。

【0131】

製剤例7〔粒剤〕

化合物	5重量%
ベントナイト	40重量%
タルク	10重量%
クレー	43重量%
サンエキスP252	2重量%

(リグニンスルホン酸カルシウム：日本製紙(株)の商品名)

前記成分を均一に粉碎・混合し、水を加えてよく練合した後、造粒乾燥して粒剤を得た。

10

【0132】

<生物試験例>

以下の試験が、本発明の化合物の特定の有害生物に対する防除効力を実証する。「防除効力」は、摂食を著しく低減させる有害無脊椎生物の発育の阻害(死亡率を含む)を表す。化合物によって達成される有害生物の防除保護は、しかしながら、これらの種に限定されない。化合物番号は表8~13の化合物を指す。

【0133】

生物試験例1：ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)防除試験(葉片散布処理)

キュウリ葉を直径3.5cmに切り、水で湿らせた脱脂綿の上に置いた。ここにワタアブラムシ成虫2頭を放虫し、24時間産仔させた後、成虫を除去した。このキュウリ葉に200ppmになるように水で希釈した供試化合物の希釈液2mLを、散布塔を用いて散布した。風乾後、脱脂綿とともにプラスチックカップに入れ、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に生死を観察し、死虫率を算出した。

20

その結果、本発明化合物1、2、3、4、5、7、8、9、10、11、12、14、17、18、19、20、26、27、28、29、30、31、42、43、45、46、48、49、50、51、53、54、55、59、61、62、66、80、85、86、87、91、103、105、106、108、110、111、112、114、120、123、125、127、135、148、150、152、156、160、170、173、174、175、177、180、181、199、201、204、207、209、215、220は80%以上の死虫率を示した。

30

【0134】

生物試験例2：ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*)防除試験(根部浸漬処理)

キュウリ苗1本(子葉期)を、3.1ppmに水で希釈した薬液10mLを入れたバイアル瓶(内径2.7cm×6cm)に根部が浸るようウレタンにて固定した。浸漬1日後にワタアブラムシ1令幼虫5頭を放虫し、25℃の定温室にて飼育した。放虫5~7日後に虫の生死、異常を調査した。

その結果、本発明化合物2、3、7、14、20、29、45、46、48、51、53、55、62、85、91、103、105、106、108、111、120、170、173、180、199は80%以上の死虫率を示した。

【0135】

生物試験例3：タバコナジラミ(*Bemisia tabaci*)防除試験(茎葉散布処理)

キュウリ葉を直径6.0cmに切り、水で湿らせた脱脂綿の上に置いた。このキュウリ葉に、200ppmになるように水で希釈した供試化合物の希釈液2mLを、散布塔を用いて散布した。風乾後、このキュウリ葉をプラスチックカップに入れ、20頭のタバコナジラミ雌成虫を放虫し、蓋をして25℃の定温室内にて飼育した。処理5日後に生死を観察し、死虫率を算出した。

その結果、13、156、196、204、209、215の化合物は80%以上の死虫率を示した。

40

【0136】

生物試験例4：コナガ(*Plutella xylostella*)防除試験(葉片浸漬処理)

50

キャベツ葉を直径7.0cmに切り、このキャベツ葉片を200ppmになるように水で希釈した供試化合物の希釈液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、キャベツ葉片をプラスチックカップ内に入れ、10頭のコナガ3令幼虫を放虫し、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に幼虫の生死を観察し、死虫率を算出した。

その結果、本発明化合物7、8、37、46、48、55、61、69、78、91、100、101、103、105、106、108、109、110、111、112、113、114、120、125、127、128、129、131、137、139、140、142、152、158、161、175、176、177、178、180、181、188、191、195、199、200、201、204、205、207、209、211、213、214、215、216、217、218、219、220は80%以上の死虫率を示した。

10

【0137】

生物試験例5：トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) 防除試験 (茎葉浸漬処理)

イネ幼苗を10本取り、200ppmになるように水で希釈した供試化合物の薬液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、ガラス円筒 (内径4.5cm×14cm) 内にウレタンを用いて保持し、水40mLを入れたプラスチックカップに立てる。これにトビイロウンカ3令幼虫を放飼し、薬包紙にて蓋をし、25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に幼虫の生死を観察し、死虫率を算出した。

その結果、本発明化合物1、2、3、4、5、7、10、11、14、16、18、19、20、26、29、31、42、43、44、45、46、48、49、50、51、53、55、59、61、85、86、90、91、98、103、106、152、170、176、181、215は80%以上の死虫率を示した。

20

【0138】

生物試験例6：セジロウンカ (*Sogatella furcifera*) 防除試験 (根部浸漬処理)

イネ幼苗を10本取り、ガラス円筒 (内径4.5cm×14cm) 内にウレタンを用いて保持し、3.1ppmの濃度に水で希釈した薬液40mLを入れたプラスチックカップに立てる。2日後、このガラス円筒内にセジロウンカ3令幼虫10頭を放飼し、薬包紙にて蓋をして25℃の定温室内にて飼育した。処理7日後に幼虫の生死を観察し、死虫率を算出した。

その結果、本発明化合物2、3、4、16、20、29、42、47、48、53、55は80%以上の死虫率を示した。

30

【0139】

生物試験例7：ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) 防除試験 (茎葉浸漬処理)

キャベツ葉を直径5.0cmに切り、このキャベツ葉片を200ppmになるように水で希釈した供試化合物の希釈液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、キャベツ葉片をプラスチックカップ内に入れ、5頭のカサネノミハムシ2令幼虫を放虫し、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理5日後に幼虫の生死を観察し、死虫率を算出した。

その結果、本発明化合物91、100、103、106、120、127、131、133、137、139、140、142、148、174、175、176、177、178、180、181、200、201、204、205、207、209、211、213、214、215、216、217、219、220は80%以上の死虫率を示した。

40

【0140】

生物試験例8：キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*) 防除試験 (茎葉浸漬処理)

キャベツ葉を直径2.8cmに切り、このキャベツ葉片を200ppmになるように水で希釈した供試化合物の希釈液20mLに浸漬し、風乾した。風乾後、キャベツ葉片をプラスチックカップ内に入れ、5頭のカサネノミハムシ成虫を放虫し、蓋をして25℃の定温室にて飼育した。処理2日後に成虫の生死を観察し、死虫率及び食害程度を算出した。

その結果、本発明化合物91、100、101、103、106、127、131、133、137、139、140、142、148、174、175、176、177、181、205は80%以上の死虫率もしくは10%以下の食害程度を示した。

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

A 0 1 N	43/90 (2006.01)	A 0 1 N	43/90	1 0 4	
A 0 1 N	47/02 (2006.01)	A 0 1 N	47/02		
A 0 1 P	7/04 (2006.01)	A 0 1 P	7/04		
A 6 1 K	31/444(2006.01)	A 6 1 K	31/444		
A 6 1 K	31/455(2006.01)	A 6 1 K	31/455		
A 6 1 K	31/53 (2006.01)	A 6 1 K	31/53		
A 6 1 K	45/00 (2006.01)	A 6 1 K	45/00		
A 6 1 P	33/00 (2006.01)	A 6 1 P	33/00		
A 6 1 P	43/00 (2006.01)	A 6 1 P	43/00	1 2 1	
C 0 7 D	213/82 (2006.01)	C 0 7 D	213/82		
C 0 7 D	401/14 (2006.01)	C 0 7 D	401/14		
C 0 7 D	409/14 (2006.01)	C 0 7 D	409/14		
C 0 7 D	471/04 (2006.01)	C 0 7 D	471/04	1 1 1	
C 0 7 D	213/75 (2006.01)	C 0 7 D	213/75		C S P

(72)発明者 角 拓人

日本国茨城県神栖市砂山 6 番地 日本化薬株式会社 アグロ研究所内

(72)発明者 浅野 周

日本国茨城県神栖市砂山 6 番地 日本化薬株式会社 アグロ研究所内

(72)発明者 藤田 忠英

日本国茨城県神栖市砂山 6 番地 日本化薬株式会社 アグロ研究所内

審査官 谷尾 忍

(56)参考文献

特表 2 0 1 6 - 5 2 8 1 8 9 (J P , A)

特表 2 0 0 5 - 5 0 8 9 4 2 (J P , A)

特表 2 0 0 4 - 5 2 1 0 9 6 (J P , A)

特表 2 0 0 3 - 5 2 8 8 1 1 (J P , A)

米国特許第 0 4 4 9 7 8 1 4 (U S , A)

特開昭 5 6 - 1 0 0 7 8 3 (J P , A)

特開平 0 7 - 3 3 0 7 6 4 (J P , A)

再公表特許第 2 0 1 5 / 0 6 8 7 1 9 (J P , A 1)

特公昭 4 9 - 0 1 6 6 1 5 (J P , B 1)

ZHENG, Zisheng , PhI(OCOCF₃)₂-mediated intramolecular oxidative N-N bond formation:

Metal-gree synthesis of 1,2,4-tri , THE JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY , 2014年 , vol. 79 , p.4687-4693

SONG, Lina , I₂/KI-mediated oxidative N-N bond formation for the synthesis of 1,5-fused 1, 2,4-triazoles from N-ar , THE JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY , 2015年 , vol.80 , p.72 19-7225

DE ZWART, Marcel A.H. , Synthesis and copper-dependent antimycoplasmal activity of 1 -amino-3-(2-pyridyl)isoquinoline deriv , THE JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY , 198 9年 , vol.32, no.2 , p.487-493

ESTEVEZ, Veronica , Synthesis of pyridopyrimidines by palladium-catalyzed isocyanide ins ertion , ACS CATALYSIS , 2014年 , vol.4 , p.40-43

(58)調査した分野 (Int.Cl. , D B 名)

C 0 7 D 2 1 3 / 7 5

A 0 1 C 1 / 0 6

A 0 1 N 4 3 / 4 0

A 0 1 N 4 3 / 5 4

A 0 1 N 4 3 / 5 6

A 0 1 N 4 3 / 6 4 7

A 0 1 N 4 3 / 9 0

A 0 1 N 4 7 / 0 2

A 6 1 K 3 1 / 4 4 4

A 6 1 K 3 1 / 4 5 5

A 6 1 K 3 1 / 5 3

A 6 1 K 4 5 / 0 0

C 0 7 D 2 1 3 / 8 2

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4

C 0 7 D 4 0 9 / 1 4

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4

C A p l u s / R E G I S T R Y (S T N)