

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

(11)公表番号

特表2024-516278  
(P2024-516278A)

(43)公表日 令和6年4月12日(2024.4.12)

(51)国際特許分類	F I	テーマコード(参考)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	1 0 7 Z 4 C 0 6 5
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	C 0 7 D 471/04	C S P 4 H 0 1 1
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 P 7/02	
A 0 1 N 47/02 (2006.01)	A 0 1 P 7/04	

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全172頁) 最終頁に続く

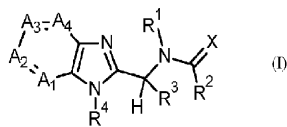
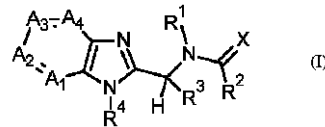
(21)出願番号	特願2023-567185(P2023-567185)	(71)出願人	313006625 バイエル・アクチエンゲゼルシャフト ドイツ連邦共和国、5 1 3 7 3 ・レーフ エルクーゼン、カイザー - ヴィルヘルム - アレー・1
(86)(22)出願日	令和4年5月2日(2022.5.2)	(74)代理人	100114188 弁理士 小野 誠
(85)翻訳文提出日	令和5年12月14日(2023.12.14)	(74)代理人	100119253 弁理士 金山 賢教
(86)国際出願番号	PCT/EP2022/061692	(74)代理人	100124855 弁理士 坪倉 道明
(87)国際公開番号	WO2022/233777	(74)代理人	100129713 弁理士 重森 一輝
(87)国際公開日	令和4年11月10日(2022.11.10)	(74)代理人	100137213 弁理士 安藤 健司
(31)優先権主張番号	21172570.0		
(32)優先日	令和3年5月6日(2021.5.6)		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		
(81)指定国・地域	AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA, .RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA( AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,A T,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR ,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC, 最終頁に続く		最終頁に続く

(54)【発明の名称】 アルキルアミド置換環付加イミダゾール類及び殺虫剤としてのそれらの使用

(57)【要約】

本発明は、一般式(I)〔式中、構造要素A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、本明細書中で与えられている意味を有する〕で表される新規アルキルアミド置換環付加イミダゾール誘導体、そのような化合物を含んでいる製剤及び組成物、並びに、植物保護における害虫(これは、節足動物及び昆虫を包含する)の防除におけるそれらの使用及び動物の外部寄生生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【化1】

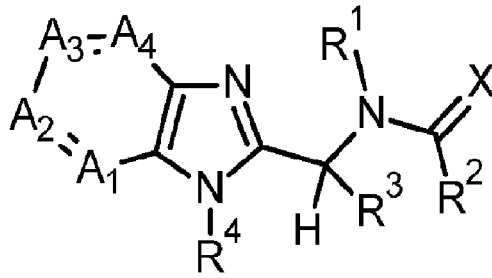


## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

一般式 (I)

## 【化 1】



(I)

10

〔式中、

X は、O 又は S であり；

A<sub>1</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；A<sub>2</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；A<sub>3</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；A<sub>4</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；

20

ここで、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub> のうちの少なくとも 1 又は 2 は、窒素 (N) を表し；R<sup>1</sup> は、水素であるか；又は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルキニルであるか；又は、フェニル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル [ここで、フェニルは、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 の置換基で置換されていてもよい] であるか；又は、

30

ヘテロシクリル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル [ここで、該ヘテロシクリルは、飽和及び部分的不飽和の 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、5 員ヘテロアリール、6 員ヘテロアリール、9 員ヘテロアリール及び 10 員ヘテロアリールからなる群から選択され、並びに、該ヘテロシクリルは、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 の置換基で置換されていてもよい] であり；

40

R<sup>2</sup> は、フェニル又は 5 員若しくは 6 員のヘテロアリールであり、ここで、これらは、

50

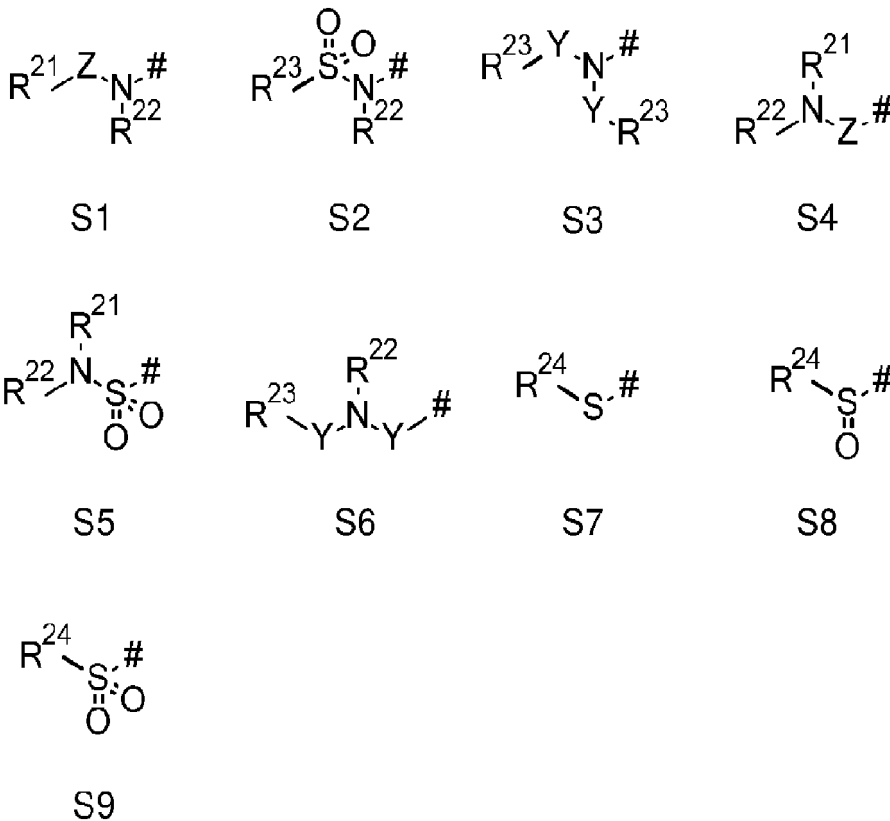
それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-SO_2NH_2$ 、 $-SF_5$ ；及び、

・ いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、ヒドロキシ- $C_1 - C_6$ アルキル、 $-CO_2C_1 - C_6$ アルキル、 $-NH(C_1 - C_6$ アルキル)、 $-N(C_1 - C_6$ アルキル) $_2$ 、 $S - C_1 - C_6$ アルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルケニルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルキニルスルフィンイミドイル、 $S -$ フェニルスルフィンイミドイル、 $S -$ ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、 $S -$ ヘテロアリールスルフィンイミドイル、 $S - C_1 - C_6$ アルキルスルホンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルケニルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルキニルスルホンイミドイル、 $S -$ フェニルスルホンイミドイル、 $S -$ ヘテロシクリルスルホンイミドイル、 $S -$ ヘテロアリールスルホンイミドイル、 $-C(=NOC_1 - C_6$ アルキル) $H$ 、 $-C(=NOC_1 - C_6$ アルキル) $-C_1 - C_6$ アルキル及び $(C_1 - C_6$ アルキル) $_3 -$ シリル；及び、

・ 下位構造 $S_1 - S_9$ （ここで、該フェニル又は5員若しくは6員のヘテロアリールへの結合には#が付けられており、並びに、 $Z$ は $CO$ 又は $CS$ であり、及び、 $Y$ は $CO$ 及び $SO_2$ から独立して選択される）；

【化2】



[ここで、

$R^{21}$ は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルであり；

$R^{22}$ は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ ア

10

20

30

40

50

ルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル及び $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり；

$R^{23}$ は、いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

$R^{24}$ は、いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルであり；

又は、

$R^{21}$ と $R^{22}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、置換されていてもよい単環式又は多環式の3～12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる）を表す]；及び、

・ それぞれ、N、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる3～6員のヘテロシクリル又は5～6員のヘテロアリール[ここで、該3～6員のヘテロシクリル置換基又は該5～6員のヘテロアリール置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-CSNH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-Si(CH_3)_3$ 、 $-SF_5$ 、 $-NH_2$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル- $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ シアノアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ シアノアルキルスルホニルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基を有していてもよい]；

からなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよく；

$R^3$ は、水素であるか、又は、 $C_1 - C_6$ アルキル[ここで、該アルキルは、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル及び $C_1 - C_6$ -アルコキシから選択される1～3の置換基で置換されていてもよい]であり；

$R^4$ は、5員ヘテロアリール及び6員ヘテロアリール[ここで、これらは、それぞれ、N、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる]からなる群から選択される単環式ヘテロ環であり、及び、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-SF_5$ ；及び、

・ いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ シアノアルコキシ、ヒドロキシ- $C_1 - C_6$ アルキル、 $-NH(C_1 - C_6$ アルキル)、 $-NH(C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、 $-N(C_1 - C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-N(C_1 - C_6$ アルキル)( $C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、 $-CO_2C_1 - C_6$ アルキル、 $S - C_1 - C_6$ アルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルケニルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルキニルスルフィンイミドイル、 $S -$ フェニルスルフィンイミドイル、 $S -$ ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、 $S -$ ヘテロアリールスルフィンイミドイル、 $S - C_1 - C_6$ アルキルスルホンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルケニルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルキニルスルホンイミドイル、 $S -$ フェニルスルホンイミドイル、 $S -$ ヘテロシクリルスルホンイミドイル、 $S -$ ヘテロアリールスルホンイミドイル、 $-C(=NOC_1 - C_6$ アルキル)H及び $-C(=NOC_1 - C_6$ アルキル)- $C_1 - C_6$ アルキル；及び、

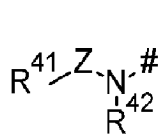
・ N、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる3

~ 6 員のヘテロシクリル [ここで、該 3 ~ 6 員のヘテロシクリル置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキルスルホニルからなる群から独立して選択される 1、2、3 又は 4 の置換基を有していてもよい] ; 及び、

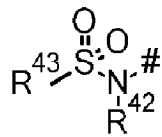
10

・ 以下の下位構造 S10 - S18 (ここで、該 5 員ヘテロアリアル及び 6 員ヘテロアリアルへの結合には # が付けられており、並びに、Z は CO 又は CS であり、及び、Y は CO 及び SO<sub>2</sub> から独立して選択される) :

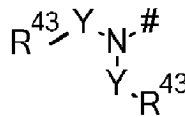
【化 3】



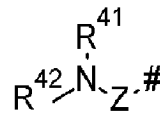
S10



S11

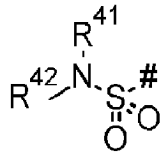


S12

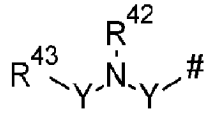


S13

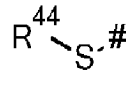
20



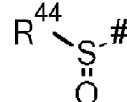
S14



S15

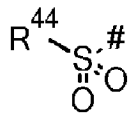


S16



S17

30



S18

[ここで、

R<sup>41</sup> は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルであり；

40

R<sup>42</sup> は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又は C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>43</sup> は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

R<sup>44</sup> は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルであり；

又は、

R<sup>41</sup> と R<sup>42</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒に、置換されていてもよい単

50

環式又は多環式の 3 ~ 12 員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる）を表す]；

からなる群から独立して選択される 1、2、3 又は 4 の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>5</sup> は、水素、ハロゲン、-CN、-NH<sub>2</sub> であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)、-CH-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ)<sub>2</sub>、-CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHCO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)CO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)H、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルチオ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィニル若しくは C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホニルである]

で表される化合物並びにその塩及び N-オキシド。

【請求項 2】

X は、O 又は S であり；

A<sub>1</sub> は、N 又は CR<sup>5</sup> であり；

A<sub>2</sub> は、N 又は CR<sup>5</sup> であり；

A<sub>3</sub> は、N 又は CR<sup>5</sup> であり；

A<sub>4</sub> は、N 又は CR<sup>5</sup> であり；

ここで、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub> のうちの 1 又は 2 は、窒素 (N) を表し；

R<sup>1</sup> は、水素であるか；又は、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル [ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニルから選択される基で置換されていてもよい] であるか；又は、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキニルであるか；又は、

フェニル-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル [ここで、フェニルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 の置換基で置換されていてもよい] であるか；又は、

ヘテロシクリル-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル [ここで、該ヘテロシクリルは、飽和又は部分的な不飽和の 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、5 員ヘテロアリアル、6 員ヘテロアリアル、9 員ヘテロアリアル及び 10 員ヘテロアリアルからなる群から選択され、並びに、該ヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 の置換基で置換されていてもよい] であり；

R<sup>2</sup> は、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、チオフエン及びピラゾールからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>；

10

20

30

40

50

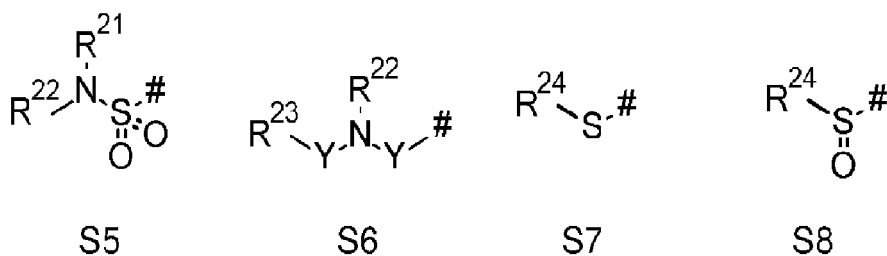
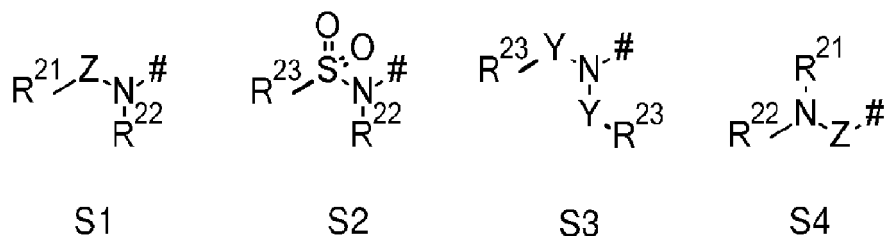
・ -CN、-OH又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル；ハロゲン及び-CNで置換されていてもよいC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル；ハロゲン及び-CNで置換されていてもよいC<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル；ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルで置換されていてもよいC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル；-CN又はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル；-CNで置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ；ハロゲン又は-CNで置換されていてもよいC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルコキシ；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、S-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィンイミドイル、S-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルスルフィンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルスルフィンイミドイル、S-フェニルスルフィンイミドイル、S-ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、S-ヘテロアリールスルフィンイミドイル、S-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホンイミドイル、S-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルスルホンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルスルホンイミドイル、S-フェニルスルホンイミドイル、S-ヘテロシクリルスルホンイミドイル、S-ヘテロアリールスルホンイミドイル、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)H、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル及び(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>3</sub>-シリル；及び、

・ 下位構造S1-S9（ここで、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、チオフェン及びピラゾールへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される）：

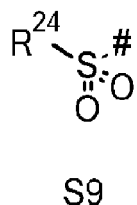
10

20

【化4】



30



40

[ここで、

R<sup>21</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C

50

4 アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

$R^{22}$ は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル又は $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり；

$R^{23}$ は、いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

$R^{24}$ は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ シアノアルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

又は、

$R^{21}$ と $R^{22}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル(ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる)を表し、及び、該単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~4の置換基で置換されていてもよい]；及び、

・ それぞれ、N、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる3~6員のヘテロシクリル又は5~6員のヘテロアリール[ここで、該3~6員のヘテロシクリル置換基又は該5~6員のヘテロアリール置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、 $-CN$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル- $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ シアノアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ シアノアルキルスルホニルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基を有していてもよい]；

からなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよく；

$R^3$ は、水素であるか、又は、 $C_1 - C_6$ アルキル[ここで、該アルキルは、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル及び $C_1 - C_6$ アルコキシからなる群から選択される1~3の置換基で置換されていてもよい]であり；

$R^4$ は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールからなる群から選択される単環式ヘテロ環であり、ここで、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-SF_5$ ；  
 ・  $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ シアノアルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ アルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ ハロアル

10

20

30

40

50

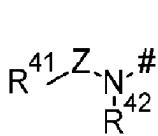


コキシ、 $C_1 - C_6$ シアノアルコキシ、ヒドロキシ- $C_1 - C_6$ アルキル、 $-NH(C_1 - C_6$ アルキル)、 $-NH(C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、 $-N(C_1 - C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-N(C_1 - C_6$ アルキル)( $C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、 $-CO_2C_1 - C_6$ アルキル、 $S - C_1 - C_6$ アルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルケニルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルキニルスルフィンイミドイル、 $S -$ フェニルスルフィンイミドイル、 $S -$ ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、 $S -$ ヘテロアリールスルフィンイミドイル、 $S - C_1 - C_6$ アルキルスルホンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルケニルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$ アルキニルスルホンイミドイル、 $S -$ フェニルスルホンイミドイル、 $S -$ ヘテロシクリルスルホンイミドイル、 $S -$ ヘテロアリールスルホンイミドイル及び $-C(=NO C_1 - C_6$ アルキル)H、 $-C(=NO C_1 - C_6$ アルキル)- $C_1 - C_6$ アルキル；及び、

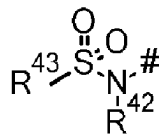
10

・ 以下の下位構造S10 - S18（ここで、該5員ヘテロアリール及び6員ヘテロアリールへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される）：

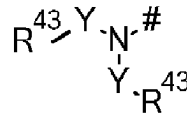
【化5】



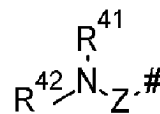
S10



S11

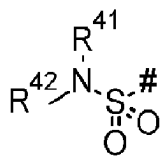


S12

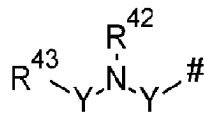


S13

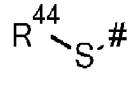
20



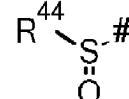
S14



S15

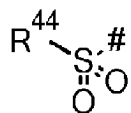


S16



S17

30



S18

[ここで、

$R^{41}$ は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ シアノアルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $-C_1 - C_6$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

40

$R^{42}$ は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ シアノアル

50

キル、 $-C_1 - C_6$ アルキル、 $-C_3 - C_6$ シクロアルキル又は $C_3 - C_6$ シクロアルキルであり；

$R^{43}$ は、いずれの場合にも置換されていてもよい $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

$R^{44}$ は、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ シアノアルキル、 $C_2 - C_6$ アルケニル、 $C_2 - C_6$ アルキニル、 $C_1 - C_6$ ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

又は、

$R^{41}$ と $R^{42}$ は、それらが結合している窒素原子と一緒に、単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる）を表し、及び、該単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル及び $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~4の置換基で置換されていてもよい]；

からなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよく；

$R^5$ は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NH_2$ 、 $C_1 - C_3$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキル、 $C_3 - C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ、 $-NH(C_1 - C_3$ アルキル)、 $-N(C_1 - C_3$ アルキル) $_2$ 、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィニル又は $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホニルである；

請求項1に記載の化合物並びにその塩及びN-オキシド。

【請求項3】

Xは、O又はSであり；

$A_1$ は、Nであり；

$A_2$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_3$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_4$ は、N又は $CR^5$ であり；又は、

$A_1$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_2$ は、Nであり；

$A_3$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_4$ は、N又は $CR^5$ であり；又は、

$A_1$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_2$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_3$ は、Nであり；

$A_4$ は、N又は $CR^5$ であり；又は、

$A_1$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_2$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_3$ は、N又は $CR^5$ であり；

$A_4$ は、Nであり；又は、

10

20

30

40

50

A<sub>1</sub> は、N であり；

A<sub>2</sub> は、N 又は CR<sup>5</sup> であり；

A<sub>3</sub> は、N 又は CR<sup>5</sup> であり；

A<sub>4</sub> は、N であり；

R<sup>1</sup> は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキル又は C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルであり；

R<sup>2</sup> は、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びピラゾールからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ、ヒドロキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-NH(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>2</sub>、-NHCO - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、NHCO - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、-NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)CO - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)CO - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル(cyclolkyll)、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-N(SO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、-CONH(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)、-CONH(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル)、-CONH - フェニル、-CON(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>2</sub>、-CON(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)(C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル)、-CON(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - フェニル、-C(=NOC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)H、-C(=NOC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル) - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)<sub>3</sub> - シリル、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル)、フェニルスルホニル並びにN、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる3~6員のヘテロシクリル(ここで、上記置換基のフェニル基及び該3~6員のヘテロシクリル置換基は、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ及びC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基を有することができる)からなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>3</sup> は、水素、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル[ここで、該アルキルは、ハロゲン、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル又はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシから選択される1~3の置換基で置換されていてもよい]であり；

R<sup>4</sup> は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ及び-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよく；

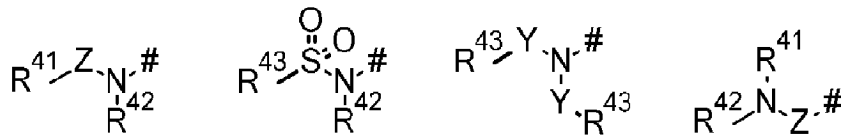
又は、

R<sup>4</sup> は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールからなる群から選択され、

ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C

6シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ及び-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルからなる群から選択される1の置換基で置換されていてもよく；及び、ここで、これらは、それぞれ、さらに、以下の下位構造S10-S18（ここで、上記ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される）：

【化6】

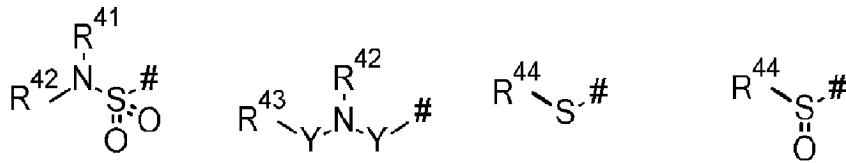


S10

S11

S12

S13

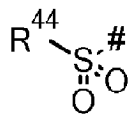


S14

S15

S16

S17



S18

[ここで、

R<sup>41</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又は-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>42</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又は-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>43</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>44</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

又は、

R<sup>41</sup>とR<sup>42</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、単環式又は多環式の5~6員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる）を表し、及び、該単環式又は多環式の~6員の飽和又は不飽和のヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC

10

20

30

40

50

1 - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 4 の置換基で置換されていてもよい] ;

からなる群から選択される 1 の置換基で置換されており ;

R<sup>5</sup> は、水素、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> - ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>4</sub> - シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルコキシ又は C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシである ;

請求項 1 又は 2 に記載の化合物並びにその塩及び N - オキシド。

【請求項 4】

X は、O 又は S であり ;

A<sub>1</sub> は、N であり ;

A<sub>2</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>3</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>4</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ; 又は、

A<sub>1</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>2</sub> は、N であり ;

A<sub>3</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>4</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ; 又は、

A<sub>1</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>2</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>3</sub> は、N であり ;

A<sub>4</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ; 又は、

A<sub>1</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>2</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>3</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>4</sub> は、N であり ; 又は、

A<sub>1</sub> は、N であり ;

A<sub>2</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

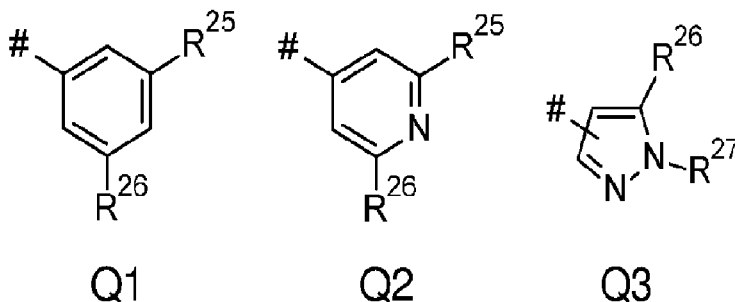
A<sub>3</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり ;

A<sub>4</sub> は、N であり ;

R<sup>1</sup> は、水素、メチル、エチル、シクロプロピルメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、メチルチオエチル、メチルスルフィニルエチル又はメチルスルホニルエチルであり ;

R<sup>2</sup> は、下位構造 Q 1、Q 2 及び Q 3 (ここで、該 C = X - 基への結合には # が付けられている) ;

【化 7】



[ここで、

R<sup>25</sup> は、ヒドロキシ、-CN、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>

10

20

30

40

50

シアノシクロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ、ヒドロキシ- $C_1 - C_4$ アルキル、 $-NH(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-N(C_1 - C_4$ アルキル) $_2$ 、 $-NHCO - C_1 - C_4$ アルキル、 $NHCO - C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $-NHSO_2(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-N(C_1 - C_4$ アルキル) $CO - C_1 - C_4$ アルキル、 $-N(C_1 - C_4$ アルキル) $CO - C_3 - C_6$ シクロアルキル(cyclolky1)、 $-N(C_1 - C_4$ アルキル) $SO_2C_1 - C_4$ アルキル、 $-N(SO_2C_1 - C_4$ アルキル) $_2$ 、 $-CO_2C_1 - C_4$ アルキル、 $-CONH(C_1 - C_4$ アルキル)、 $-CONH(C_3 - C_6$ シクロアルキル)、 $-CONH$ -フェニル、 $-CON(C_1 - C_4$ アルキル) $_2$ 、 $-CON(C_1 - C_4$ アルキル)( $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、 $-CON(C_1 - C_4$ アルキル)-フェニル、 $-C(=NOC_1 - C_4$ アルキル)H、 $-C(=NOC_1 - C_4$ アルキル)- $C_1 - C_4$ アルキル、( $C_1 - C_4$ アルキル) $_3$ -シリル、 $-SO_2NH(C_1 - C_4$ アルキル)、フェニルスルホニル又はN、O及びSからなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含んでいる3~6員のヘテロシクリルル(ここで、上記置換基のフェニル基及び該3~6員のヘテロシクリルル置換基は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ及び $C_1 - C_3$ ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基を有することができる)であり；及び、

10

20

$R^{26}$ は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-COOH$ 、 $-CONH_2$ 、 $-NO_2$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ アルキルチオ、 $C_1 - C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキル又は $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキルであり；

$R^{27}$ は、水素又は $C_1 - C_4$ アルキルである]

から選択され；

$R^3$ は、メチルであり；

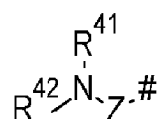
30

$R^4$ は、ピリジン-2-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピラジン-3-イル及び1,3-チアゾール-2-イルからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、 $-CN$ 、メチル、エチル、 $n$ -プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロエトキシ、メトキシカルボニル及びエトキシカルボニルからなる群から独立して選択される1の置換基で置換されていてもよく；又は、

以下の位構造S13(ここで、上記ピリジン-2-イル、ピリミジン-2-イル、ピリミジン-4-イル、ピラジン-3-イル及び1,3-チアゾール-2-イルへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCOである)：

40

【化8】



S13

50

[ ここで、

R<sup>4 1</sup> は、水素、メチル、エチル、シクロプロピルメチル、シアノメチル、シクロプロピル、ジフルオロエチル又はトリフルオロエチルであり；

R<sup>4 2</sup> は、水素、メチル、エチル、シクロプロピルメチル、シアノメチル、シクロプロピル、ジフルオロエチル又はトリフルオロエチルであり；

又は、

R<sup>4 1</sup> と R<sup>4 2</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1 ~ 4 のメチルで置換されていてもよいモルホリンを表す ]

で置換されていてもよく；

R<sup>5</sup> は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、-CN、メチル、エチル、イソプロピル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシである；

請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物並びにその塩及び N - オキシド。

【請求項 5】

X は、O であり；

A<sub>1</sub> は、N であり；

A<sub>2</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>3</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>4</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；又は、

A<sub>1</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>2</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>3</sub> は、N であり；

A<sub>4</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；又は、

A<sub>1</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>2</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>3</sub> は、C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>4</sub> は、N であり；

R<sup>1</sup> は、水素であり；

R<sup>2</sup> は、3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - ブロモ - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シアノ - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3, 5 - ビス(ジフルオロメチル)フェニル、3, 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェニル、3, 5 - ビス(ジフルオロメトキシ)フェニル、3, 5 - ビス(トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シアノ - 5 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エチル)フェニル、3 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エチル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シアノ - 5 - (1 - シアノシクロプロピル)フェニル、3 - (1 - シアノシクロプロピル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、(3 - クロロ - 5 - メチルスルホニルフェニル)、3 - メチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (ジフルオロメチルスルホニル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3, 5 - ビス(ジフルオロメチルスルホニル)フェニル及び 5 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - ピラゾール - 3 - イルからなる群から選択され；

R<sup>3</sup> は、メチルであり；

R<sup>4</sup> は、ピリジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリジン - 2 - イル、5 - メトキシカルボニル - 2 - ピリジル、5 - (アミノカルボニル)ピリジン - 2 - イル、5 - (メチルカルバモイル)ピリジン - 2 - イル及び 5 - (ジメチルアミノカルボニル)ピリジン - 2 - イルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup> は、水素、フッ素及びメチルから選択される；

請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物並びにその塩及び N - オキシド。

【請求項 6】

10

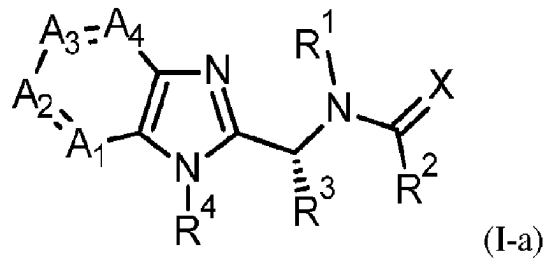
20

30

40

50

式 ( I - a )  
【化 9】



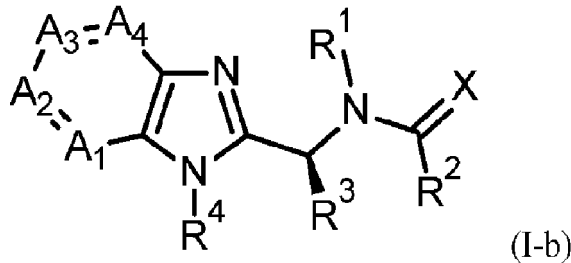
10

〔式中、構造要素 A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 及び X は、請求項 1 において与えられている意味又は請求項 2 において与えられている意味又は請求項 3 において与えられている意味又は請求項 4 において与えられている意味又は請求項 5 において与えられている意味を有する〕

で表される構造を有することを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

式 ( I - b )  
【化 10】



20

30

〔式中、構造要素 A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub>、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 及び X は、請求項 1 において与えられている意味又は請求項 2 において与えられている意味又は請求項 3 において与えられている意味又は請求項 4 において与えられている意味又は請求項 5 において与えられている意味を有する〕

で表される構造を有することを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

化合物：

6 - [ 2 - [ ( 1 S ) - 1 - アミノエチル ] イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩； 40

1 - [ 3 - ( 5 - クロロ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン； 2, 2, 2 - トリフルオロ酢酸；

6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) - 7 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩；

メチル 6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボキシレート 塩酸塩；

6 - [ 2 - [ 1 - アミノエチル ] - 6 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩；

6 - [ 2 - [ 1 - アミノエチル ] - 5 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 50



-イル]ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩 ;  
 1 - [ 1 - ( 5 - クロロ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン 塩酸塩 ;  
 1 - [ 1 - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン トリフルオロ酢酸塩。

【請求項 9】

製剤、特に、農薬製剤であって、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 ( I ) で表される少なくとも 1 種類の化合物を含んでいる、前記製剤。

【請求項 10】

さらに、少なくとも 1 種類の増量剤及び / 又は少なくとも 1 種類の界面活性物質を含んでいる、請求項 9 に記載の製剤。

10

【請求項 11】

式 ( I ) で表される化合物が少なくとも 1 種類のさらなる活性化合物と混合されていることを特徴とする、請求項 9 又は 10 に記載の製剤。

【請求項 12】

有害生物 ( 特に、害虫 ) を防除する方法であって、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 ( I ) で表される化合物又は請求項 9 ~ 11 のいずれかに記載の製剤を該有害生物及び / 又はそれらの生息環境に作用させることを特徴とし、ここで、外科又は治療により動物の身体を処置する方法及び動物の身体に対して実施される診断方法は除外される、前記方法

20

【請求項 13】

前記有害生物が、害虫であり、そして、昆虫、クモ形類動物若しくは線虫を包含すること、又は、前記有害生物が昆虫、クモ形類動物若しくは線虫であることを特徴とする、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

害虫を防除するための、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 ( I ) で表される化合物又は請求項 9 ~ 11 のいずれかに記載の製剤の使用であって、ここで、外科又は治療により動物の身体を処置する方法及び動物の身体に対して実施される診断方法は除外される使用

【請求項 15】

前記害虫が昆虫、クモ形類動物若しくは線虫を包含すること、又は、前記害虫が昆虫、クモ形類動物若しくは線虫であることを特徴とする、請求項 14 に記載の使用。

30

【請求項 16】

作物保護における、請求項 14 又は 15 に記載の使用。

【請求項 17】

動物衛生の分野における、請求項 14 又は 15 に記載の使用。

【請求項 18】

媒介動物の防除における、請求項 14 又は 15 に記載の化合物又は塩の使用。

【請求項 19】

種子又は発芽中の植物を有害生物 ( 特に、害虫 ) から保護する方法であって、該種子を請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 ( I ) で表される化合物又は請求項 9 ~ 11 のいずれかに記載の製剤と接触させる方法段階を含んでいる、前記保護する方法。

40

【請求項 20】

請求項 19 に記載の方法で得られた種子。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規アルキルアミド置換環付加イミダゾール誘導体、そのような化合物を含んでいる製剤及び組成物、並びに、植物保護における害虫 ( animal pest ) ( これは、節足動物及び昆虫を包含する ) の防除におけるそれらの使用及び動物の外部寄生

50

生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

WO2002/083143及びWO2006/004924には、特定の炎症性及び免疫調節性の障害及び疾患を治療及び予防するのに有用な、CXCR3受容体のモジュレーターである多くのベンゾイミダゾール化合物が開示されている。さらに、WO2002/028839には、CRF受容体モジュレーターとしてのベンゾイミダゾール類が開示されている。WO2011/123751及びWO2012/107465には、特定のアルキルアミン置換ベンゾイミダゾール類及びイミダゾピリジン類が記載されている。

【0003】

特定のヘテロアリアル-トリアゾール化合物は、動物の外部寄生虫の防除における使用に関してWO2017/192385に開示されており、並びに、植物保護の分野における害虫（これは、節足動物及び昆虫類を包含する）の防除における使用に関してWO2019/170626及びWO2019/215198に開示されている。さらに、特許出願WO2019/197468、WO2019/201835、WO2019/202077、WO2019/206799、WO2021/013719、WO2021/013720、WO2021/069575、WO2021/069567、WO2021/069569、WO2021/099303、WO2021/105091、WO2021/165195、WO2021/224323及びWO2021/259997には、動物の外部寄生虫の防除において使用するための、並びに、植物保護の分野における害虫（これは、節足動物及び昆虫類を包含する）を防除するための、特定のヘテロアリアル-トリアゾール化合物又はヘテロアリアル-ピラジン化合物が開示されている。WO2020/002563、WO2020/053364、WO2020/053365、WO2020/070049、WO2020/079198、WO2020/094363、WO2020/169445、WO2020/182649、WO2020/188014、WO2020/188027、WO2020/193341、WO2020/201079、WO2020/201398、WO2020/208036、WO2021/037614、WO2021/122645及びWO2021/170881には、アゾール-アミド化合物又はピラジン-アミド化合物が記載されており、それら化合物は、全て、殺虫剤として使用することが可能である。

【0004】

現代の植物保護製品及び獣医学的殺外部寄生生物薬は、例えば、効力、持続性、スペクトル及び抵抗性打破（resistance breaking）特性などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性に関する問題、別の活性化合物又は製剤助剤との組合せ可能性は、活性化合物を合成するのに必要な費用の問題に加えて、ある種の役割を果たす。さらに、抵抗性も生じ得る。抵抗性の寄生虫は、家畜及び伴侶動物の両方にとって、さらには、作物の害虫においても、ますます問題となっている。これら全ての理由により、新規作物保護組成物又は獣医学的殺外部寄生生物薬の探求は、完結したものとは考えられ得ず、既知化合物と比較して、少なくとも個々の態様に関して改善された特性を有する新規化合物が絶えず求められている。抵抗性を克服する新しい殺害虫剤（pesticide）剤及び殺寄生虫剤を発見することが特に望ましい。

【先行技術文献】

【特許文献】

【0005】

【特許文献1】WO2002/083143

【特許文献2】WO2006/004924

【特許文献3】WO2002/028839

【特許文献4】WO2011/123751

【特許文献5】WO2012/107465

【特許文献6】WO2017/192385

10

20

30

40

50

【特許文献 7】	WO 2019 / 170626	
【特許文献 8】	WO 2019 / 215198	
【特許文献 9】	WO 2019 / 197468	
【特許文献 10】	WO 2019 / 201835	
【特許文献 11】	WO 2019 / 202077	
【特許文献 12】	WO 2019 / 206799	
【特許文献 13】	WO 2021 / 013719	
【特許文献 14】	WO 2021 / 013720	
【特許文献 15】	WO 2021 / 069575	
【特許文献 16】	WO 2021 / 069567	10
【特許文献 17】	WO 2021 / 069569	
【特許文献 18】	WO 2021 / 099303	
【特許文献 19】	WO 2021 / 105091	
【特許文献 20】	WO 2021 / 165195	
【特許文献 21】	WO 2021 / 224323	
【特許文献 22】	WO 2021 / 259997	
【特許文献 23】	WO 2020 / 002563	
【特許文献 24】	WO 2020 / 053364	
【特許文献 25】	WO 2020 / 053365	
【特許文献 26】	WO 2020 / 070049	20
【特許文献 27】	WO 2020 / 079198	
【特許文献 28】	WO 2020 / 094363	
【特許文献 29】	WO 2020 / 169445	
【特許文献 30】	WO 2020 / 182649	
【特許文献 31】	WO 2020 / 188014	
【特許文献 32】	WO 2020 / 188027	
【特許文献 33】	WO 2020 / 193341	
【特許文献 34】	WO 2020 / 201079	
【特許文献 35】	WO 2020 / 201398	
【特許文献 36】	WO 2020 / 208036	30
【特許文献 37】	WO 2021 / 037614	
【特許文献 38】	WO 2021 / 122645	
【特許文献 39】	WO 2021 / 170881	

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0006】

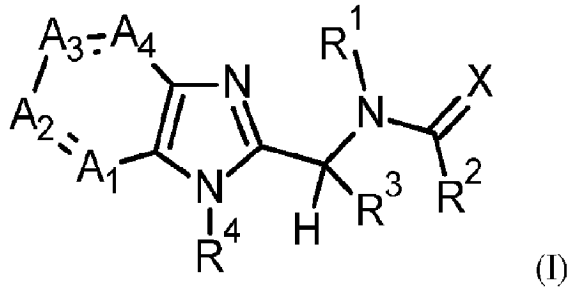
本発明の目的は、さまざまな局面において殺害虫剤のスペクトルを拡大する化合物を提供することであった。

【課題を解決するための手段】

【0007】

従って、本発明は、一般式 ( I )

## 【化 1】



10

〔式中（構成 1 - 1）：

X は、O 又は S であり；

A<sub>1</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>2</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>3</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；

A<sub>4</sub> は、N 又は C R<sup>5</sup> であり；

ここで、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub> のうちの少なくとも 1 又は 2 は、窒素（N）を表し；

R<sup>1</sup> は、水素であるか；又は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルキニルであるか；又は、

20

フェニル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル [ここで、フェニルは、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 の置換基で置換されていてもよい] であるか；又は、

30

ヘテロシクリル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル [ここで、該ヘテロシクリルは、飽和及び部分的不飽和の 3 ~ 10 員のヘテロシクリル、5 員ヘテロアリール、6 員ヘテロアリール、9 員ヘテロアリール及び 10 員ヘテロアリールからなる群から選択され、並びに、該ヘテロシクリルは、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される 1 ~ 5 の置換基で置換されていてもよい] であり；

40

R<sup>2</sup> は、フェニル又は 5 員若しくは 6 員のヘテロアリールであり、ここで、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>；及び、

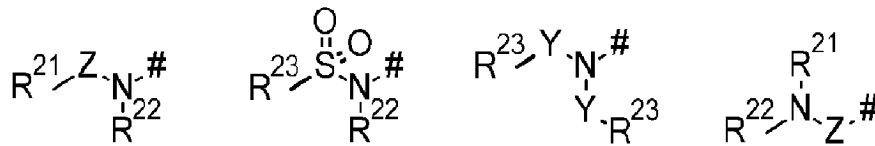
50

・ いずれの場合にも置換されていてもよい  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_2 - C_6$  アルケニル、 $C_2 - C_6$  アルキニル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  アルコキシ、 $C_3 - C_6$  シクロアルコキシ、 $C_1 - C_6$  ハロアルコキシ、ヒドロキシ、 $-C_1 - C_6$  アルキル、 $-CO_2C_1 - C_6$  アルキル、 $-NH(C_1 - C_6$  アルキル)、 $-N(C_1 - C_6$  アルキル) $_2$ 、 $S - C_1 - C_6$  アルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$  シクロアルキルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$  アルケニルスルフィンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$  アルキニルスルフィンイミドイル、 $S -$  フェニルスルフィンイミドイル、 $S -$  ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、 $S -$  ヘテロアリールスルフィンイミドイル、 $S - C_1 - C_6$  アルキルスルホンイミドイル、 $S - C_3 - C_6$  シクロアルキルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$  アルケニルスルホンイミドイル、 $S - C_2 - C_6$  アルキニルスルホンイミドイル、 $S -$  フェニルスルホンイミドイル、 $S -$  ヘテロシクリルスルホンイミドイル、 $S -$  ヘテロアリールスルホンイミドイル、 $-C(=NOC_1 - C_6$  アルキル) $H$ 、 $-C(=NOC_1 - C_6$  アルキル) $-C_1 - C_6$  アルキル及び $(C_1 - C_6$  アルキル) $_3 -$  シリル；及び、

10

・ 下位構造  $S_1 - S_9$  (ここで、該フェニル又は5員若しくは6員のヘテロアリールへの結合には#が付けられており、並びに、 $Z$ は $CO$ 又は $CS$ であり、及び、 $Y$ は $CO$ 及び $SO_2$ から独立して選択される)：

【化2】



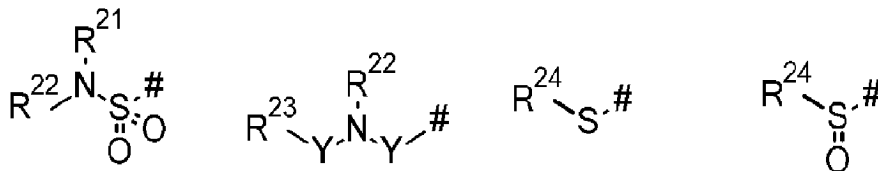
S1

S2

S3

S4

20



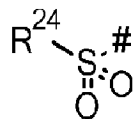
S5

S6

S7

S8

30



S9

40

[ここで、

$R^{21}$ は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  ハロアルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $-C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルであり；

$R^{22}$ は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよい  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  ハロアルキル、 $-C_1 - C_6$  アルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル及び  $C_3 - C_6$  シクロアルキルであり；

$R^{23}$ は、いずれの場合にも置換されていてもよい  $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  ハロアルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

50

R<sup>2 4</sup> は、いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルであり；

又は、

R<sup>2 1</sup> と R<sup>2 2</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒に、置換されていてもよい単環式又は多環式の 3 ~ 12 員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる）を表す]；及び、

・ それぞれ、N、O 及び S からなる群から選択される 1 個又は 2 個のヘテロ原子を含んでいる 3 ~ 6 員のヘテロシクリル又は 5 ~ 6 員のヘテロアリール [ここで、該 3 ~ 6 員のヘテロシクリル置換基又は該 5 ~ 6 員のヘテロアリール置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルフィニル及び C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub> シアノアルキルスルホニルからなる群から独立して選択される 1、2、3 又は 4 の置換基を有していてもよい]；

からなる群から独立して選択される 1、2 又は 3 の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>3</sup> は、水素であるか、又は、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル [ここで、該アルキルは、ハロゲン、-CN、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> - シクロアルキル及び C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシから選択される 1 ~ 3 の置換基で置換されていてもよい] であり；

R<sup>4</sup> は、5 員ヘテロアリール及び 6 員ヘテロアリール [ここで、これらは、それぞれ、N、O 及び S からなる群から選択される 1 個又は 2 個のヘテロ原子を含んでいる] からなる群から選択される単環式ヘテロ環であり、及び、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>；及び、

・ いずれの場合にも置換されていてもよい C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、-C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> シアノアルコキシ、ヒドロキシ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、-NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)、-NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル)、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル)、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、S - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルスルフィンイミドイル、S - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキルスルフィンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニルスルフィンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルスルフィンイミドイル、S - フェニルスルフィンイミドイル、S - ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、S - ヘテロアリールスルフィンイミドイル、S - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキルスルホンイミドイル、S - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキルスルホンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルケニルスルホンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> アルキニルスルホンイミドイル、S - フェニルスルホンイミドイル、S - ヘテロシクリルスルホンイミドイル、S - ヘテロアリールスルホンイミドイル、-C(=NOC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル)H 及び -C(=NOC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル) - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル；及び、

・ N、O 及び S からなる群から選択される 1 個又は 2 個のヘテロ原子を含んでいる 3 ~ 6 員のヘテロシクリル [ここで、該 3 ~ 6 員のヘテロシクリル置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-CSNH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>、-SF<sub>5</sub>、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub> シクロアルキル -

10

20

30

40

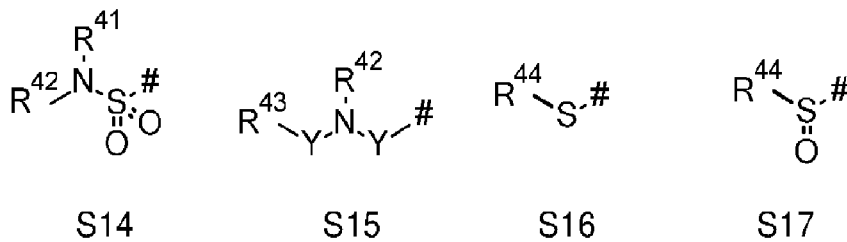
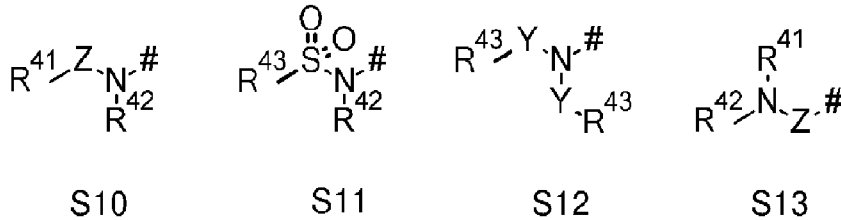
50

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>シアノアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>シアノアルキルスルホニルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基を有していてもよい]；及び、

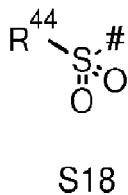
・ 以下の下位構造S10 - S18（ここで、該5員ヘテロアリアル及び6員ヘテロアリアルへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される）；

10

【化3】



20



30

[ここで、

R<sup>41</sup>は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル、-C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルであり；

R<sup>42</sup>は、水素であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>シアノアルキル、-C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

40

R<sup>43</sup>は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

R<sup>44</sup>は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリアル及びヘテロシクリルであり；

又は、

R<sup>41</sup>とR<sup>42</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、置換されていてもよい単環式又は多環式の3 - 12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル（ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる）を表す]；

からなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基で置換されていてもよく；

50

R<sup>5</sup> は、水素、ハロゲン、-CN、-NH<sub>2</sub>であるか、又は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)、-CH-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ)<sub>2</sub>、-CONH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHCO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)CO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)H、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルチオ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィニル若しくはC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホニルである]

10

で表される化合物並びにその塩及びN-オキシドに関する。

【0008】

本明細書中のどこかに記載されている式(I)で表される化合物は、同様に、存在する全てのジアステレオマー又はエナンチオマー及びE/Z異性体を包含し、並びに、式(I)で表される化合物の塩及びN-オキシドも包含し、並びに、害虫を防除するためのそれらの使用も包含する。

【0009】

本明細書中のどこかに記載されている式(I)で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、立体異性体の形態でも、即ち、幾何異性体の形態及び/若しくは光学異性体の形態又は種々の組成における異性体混合物の形態でも、存在し得る。たとえ、概して、式(I)で表される化合物についてのみ本明細書中で論じられているとしても、本発明は、純粋な立体異性体及びこれらの異性体の任意の所望の混合物の両方を提供する。

20

【0010】

しかしながら、本発明によれば、好ましくは、式(I)で表される化合物の光学活性な立体異性体形態及びその塩を使用する。

【0011】

従って、本発明は、純粋なエナンチオマー及びジアステレオマーとそれらの混合物の両方に関する。

30

【0012】

適切な場合には、式(I)で表される化合物は、種々の多形体形態で存在し得るか、又は、種々の多形体形態の混合物として存在し得る。純粋な多形体と多形体混合物の両方が本発明によって提供され、そして、本発明に従って使用され得る。

【発明を実施するための形態】

【0013】

好ましいのは(構成2-1)、式(I)〔式中、

Xは、O又はSであり；

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

40

ここで、A<sub>1</sub>、A<sub>2</sub>、A<sub>3</sub>、A<sub>4</sub>のうちの1又は2は、窒素(N)を表し；

R<sup>1</sup>は、水素であるか；又は、

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル〔ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニルから選択される基で置換されていてもよい〕であるか；又は、

C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>ハ

50



ロアルキニルであるか；又は、

フェニル - C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキル [ここで、フェニルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1～5の置換基で置換されていてもよい]であるか；又は、

ヘテロシクリル - C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキル [ここで、該ヘテロシクリルは、飽和又は部分的不飽和の3～10員のヘテロシクリル、5員ヘテロアリアル、6員ヘテロアリアル、9員ヘテロアリアル及び10員ヘテロアリアルからなる群から選択され、並びに、該ヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1～5の置換基で置換されていてもよい]であり；

R<sup>2</sup>は、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、チオフエン及びピラゾールからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>；

・ -CN、-OH又はC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルで置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル；ハロゲン及び-CNで置換されていてもよいC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルケニル；ハロゲン及び-CNで置換されていてもよいC<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルキニル；ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキル又はC<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルで置換されていてもよいC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル；-CN又はC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>ハロアルキル；-CNで置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルコキシ；ハロゲン又は-CNで置換されていてもよいC<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルコキシ；C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル、-NH(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、S - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルスルフィンイミドイル、S - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルケニルスルフィンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルキニルスルフィンイミドイル、S - フェニルスルフィンイミドイル、S - ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、S - ヘテロアリアルスルフィンイミドイル、S - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルスルホンイミドイル、S - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルケニルスルホンイミドイル、S - C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルキニルスルホンイミドイル、S - フェニルスルホンイミドイル、S - ヘテロシクリルスルホンイミドイル、S - ヘテロアリアルスルホンイミドイル、-C(=NOC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル)H、-C(=NOC<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル) - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル及び(C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキル)<sub>3</sub> - シリル；及び、

・ 下位構造S<sub>1</sub> - S<sub>9</sub> (ここで、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン、チオフエン及びピラゾールへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される)；

10

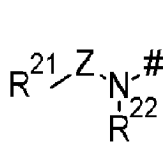
20

30

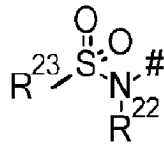
40

50

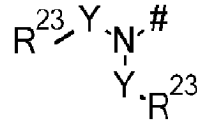
## 【化 4】



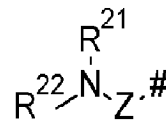
S1



S2



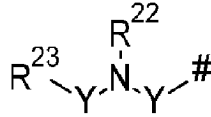
S3



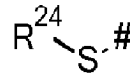
S4



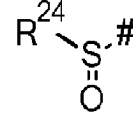
S5



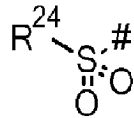
S6



S7



S8



S9

10

20

30

40

50

[ ここで、

R<sup>21</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>22</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>23</sup>は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

R<sup>24</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

又は、

R<sup>21</sup>とR<sup>22</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、単環式又は多環式の3~

12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル(ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる)を表し、及び、該単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~4の置換基で置換されていてもよい];及び、

・ それぞれ、N、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる3~6員のヘテロシクリル又は5~6員のヘテロアリール[ここで、該3~6員のヘテロシクリル置換基又は該5~6員のヘテロアリール置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキルスルホニルからなる群から独立して選択される1、2、3又は4の置換基を有していてもよい];

からなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよく;

R<sup>3</sup>は、水素であるか、又は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル[ここで、該アルキルは、ハロゲン、-CN、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル及びC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルコキシからなる群から選択される1~3の置換基で置換されていてもよい]であり;

R<sup>4</sup>は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールからなる群から選択される単環式ヘテロ環であり、ここで、これらは、それぞれ、

・ ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>;

・ C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルコキシ、ヒドロキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル)、-CO<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、S-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルフィンイミドイル、S-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルスルフィンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルスルフィンイミドイル、S-フェニルスルフィンイミドイル、S-ヘテロシクリルスルフィンイミドイル、S-ヘテロアリールスルフィンイミドイル、S-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキルスルホンイミドイル、S-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルスルホンイミドイル、S-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルスルホンイミドイル、S-フェニルスルホンイミドイル、S-ヘテロシクリルスルホンイミドイル、S-ヘテロアリールスルホンイミドイル及び-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)H、-C(=NOC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル)-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル;及び、

・ 以下の下位構造S10-S18(ここで、該5員ヘテロアリール及び6員ヘテロアリールへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される):

10

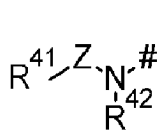
20

30

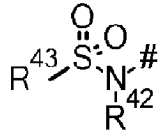
40

50

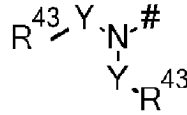
## 【化5】



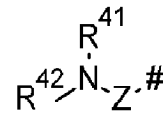
S10



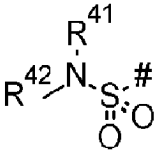
S11



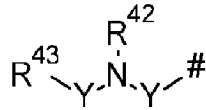
S12



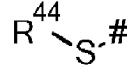
S13



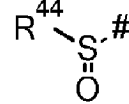
S14



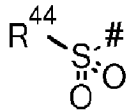
S15



S16



S17



S18

10

20

30

40

50

[ここで、

R<sup>41</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>42</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>43</sup>は、いずれの場合にも置換されていてもよいC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル及びフェニルから独立して選択され；

R<sup>44</sup>は、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>シアノアルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、フェニル、ヘテロアリール又はヘテロシクリルであり、ここで、フェニル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、ハロゲン、-CN、-NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~3の置換基で置換されていてもよく；

又は、

R<sup>41</sup>とR<sup>42</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル(ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテ

口原子を含むことができる)を表し、及び、該単環式又は多環式の3~12員の飽和又は不飽和のヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~4の置換基で置換されていてもよい]；

からなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよく；

R<sup>5</sup>は、水素、ハロゲン、-CN、-NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルチオ、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィニル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホニルである]

で表される化合物並びにその塩及びN-オキシドである。

【0014】

さらに好ましいのは(構成3-1)、式(I)〔式中、

Xは、O又はSであり；

A<sub>1</sub>は、Nであり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、Nであり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、Nであり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、Nであり；又は、

A<sub>1</sub>は、Nであり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、Nであり；

R<sup>1</sup>は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル又はC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sup>2</sup>は、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びピラゾールからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、ヒドロキシ、-CN、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスル

フィニル、 $C_1 - C_3$ アルキルスルホニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルファニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルフィニル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ、ヒドロキシ- $C_1 - C_4$ アルキル、-NH( $C_1 - C_4$ アルキル)、-N( $C_1 - C_4$ アルキル)<sub>2</sub>、-NHCO- $C_1 - C_4$ アルキル、NHCO- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、-NH $SO_2$ ( $C_1 - C_4$ アルキル)、-N( $C_1 - C_4$ アルキル)CO- $C_1 - C_4$ アルキル、-N( $C_1 - C_4$ アルキル)CO- $C_3 - C_6$ シクロアルキル(cyclolkyll)、-N( $C_1 - C_4$ アルキル) $SO_2C_1 - C_4$ アルキル、-N( $SO_2C_1 - C_4$ アルキル)<sub>2</sub>、-CO<sub>2</sub> $C_1 - C_4$ アルキル、-CONH( $C_1 - C_4$ アルキル)、-CONH( $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、-CONH-フェニル、-CON( $C_1 - C_4$ アルキル)<sub>2</sub>、-CON( $C_1 - C_4$ アルキル)( $C_3 - C_6$ シクロアルキル)、-CON( $C_1 - C_4$ アルキル)-フェニル、-C(=NOC<sub>1 - C\_4</sub>アルキル)H、-C(=NOC<sub>1 - C\_4</sub>アルキル)- $C_1 - C_4$ アルキル、( $C_1 - C_4$ アルキル)<sub>3</sub>-シリル、- $SO_2NH$ ( $C_1 - C_4$ アルキル)、フェニルスルホニル並びにN、O及びSからなる群から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含んでいる3~6員のヘテロシクリル(ここで、上記置換基のフェニル基及び該3~6員のヘテロシクリル置換基は、ハロゲン、-CN、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ アルコキシ及び $C_1 - C_3$ ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基を有することができる)からなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基で置換されていてもよく；

10

20

$R^3$ は、水素、 $C_1 - C_6$ アルキル[ここで、該アルキルは、ハロゲン、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル又は $C_1 - C_6$ -アルコキシから選択される1~3の置換基で置換されていてもよい]であり；

$R^4$ は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ及び-CO<sub>2</sub> $C_1 - C_6$ アルキルからなる群から独立して選択される1又は2の置換基で置換されていてもよく；

30

又は、

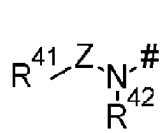
$R^4$ は、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールからなる群から選択され、

ここで、これらは、それぞれ、ハロゲン、-CN、-COOH、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、-SF<sub>5</sub>、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル- $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_3$ ハロアルキル、 $C_1 - C_3$ シアノアルキル、 $C_3 - C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ シアノシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 - C_3$ シアノアルコキシ及び-CO<sub>2</sub> $C_1 - C_6$ アルキルからなる群から選択される1の置換基で置換されていてもよく；及び、

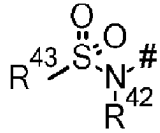
ここで、これらは、それぞれ、さらに、以下の下位構造S10-S18(ここで、上記ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン及びチアゾールへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCO又はCSであり、及び、YはCO及びSO<sub>2</sub>から独立して選択される)：

40

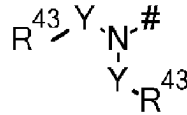
## 【化 6】



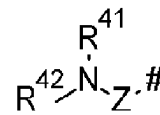
S10



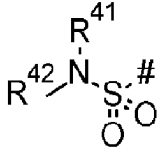
S11



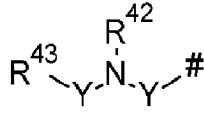
S12



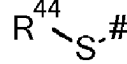
S13



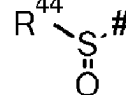
S14



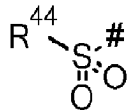
S15



S16



S17



S18

10

20

30

40

50

[ ここで、

R<sup>41</sup> は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又は-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>42</sup> は、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル又は-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキル-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>43</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>44</sup> は、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル又はC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

又は、

R<sup>41</sup>とR<sup>42</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、単環式又は多環式の5~6員の飽和又は不飽和のヘテロシクリル(ここで、該ヘテロシクリルは、さらなるヘテロ原子を含むことができる)を表し、及び、該単環式又は多環式の~6員の飽和又は不飽和のヘテロシクリルは、それぞれ、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル及びC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択される1~4の置換基で置換されていてもよい]；

からなる群から選択される1の置換基で置換されており；

R<sup>5</sup> は、水素、ハロゲン、-CN、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-シクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルコキシ又はC<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシである]

で表される化合物並びにその塩及びN-オキシドである。

【0015】

特に好ましいのは(構成4-1)、式(I)〔式中、

Xは、O又はSであり；

A<sub>1</sub>は、Nであり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、Nであり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、Nであり；

A<sub>4</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、Nであり；又は、

A<sub>1</sub>は、Nであり；

A<sub>2</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

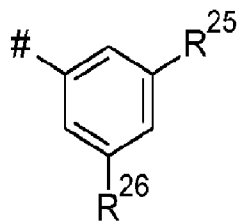
A<sub>3</sub>は、N又はCR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、Nであり；

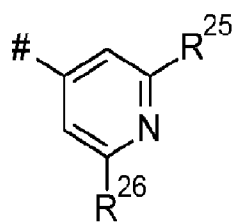
R<sup>1</sup>は、水素、メチル、エチル、シクロプロピルメチル、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、メチルチオエチル、メチルスルフィニルエチル又はメチルスルホニルエチルであり；

R<sup>2</sup>は、下位構造Q1、Q2及びQ3(ここで、該C=X-基への結合には#が付けられている)：

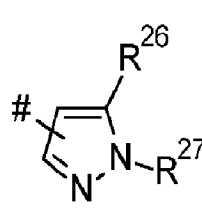
【化7】



Q1



Q2



Q3

[ここで、

R<sup>25</sup>は、ヒドロキシ、-CN、-NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>ハロシクロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シアノシクロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルファニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィニル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>シアノアルコキシ、ヒドロキシ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、-NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-NHCO-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、NHCO-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>シクロアルキル、-NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ア

10

20

30

40

50



ルキル) CO - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、 - N ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル ) CO - C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル ( c y c l o l k y l )、 - N ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル ) SO<sub>2</sub> C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、 - N ( SO<sub>2</sub> C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル )<sub>2</sub>、 - CO<sub>2</sub> C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、 - CONH ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル )、 - CONH ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル )、 - CONH - フェニル、 - CON ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル )<sub>2</sub>、 - CON ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル ) ( C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル )、 - CON ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル ) - フェニル、 - C ( = NOC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル ) H、 - C ( = NOC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル ) - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、 ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル )<sub>3</sub> - シリル、 - SO<sub>2</sub>NH ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル )、フェニルスルホニル又は N、O及びSからなる群から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子を含んでいる3～6員のヘテロシクリルル (ここで、上記置換基のフェニル基及び該3～6員のヘテロシクリルル置換基は、ハロゲン、 - CN、 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルコキシ及び C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルコキシからなる群から独立して選択される1、2又は3の置換基を有することができる) であり；及び、

R<sup>2 6</sup>は、水素、ハロゲン、 - CN、 - COOH、 - CONH<sub>2</sub>、 - NO<sub>2</sub>、 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキル、 C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルコキシ、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルチオ、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルチオ、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルフィニル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>ハロアルキルスルホニル、 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルスルファニル、 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルスルフィニル、 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキルスルホニル、 C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シクロアルキル、 C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>シアノアルキル又は C<sub>3</sub> - C<sub>6</sub>シアノシクロアルキルであり；

R<sup>2 7</sup>は、水素又は C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキルである]

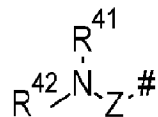
から選択され；

R<sup>3</sup>は、メチルであり；

R<sup>4</sup>は、ピリジン - 2 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピラジン - 3 - イル及び1, 3 - チアゾール - 2 - イルからなる群から選択され、ここで、これらは、それぞれ、フッ素、塩素、臭素、 - CN、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、ブチル、tert - ブチル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロエトキシ、メトキシカルボニル及びエトキシカルボニルからなる群から独立して選択される1の置換基で置換されていてもよく；又は、

以下の位構造 S 1 3 (ここで、上記ピリジン - 2 - イル、ピリミジン - 2 - イル、ピリミジン - 4 - イル、ピラジン - 3 - イル及び1, 3 - チアゾール - 2 - イルへの結合には#が付けられており、並びに、ZはCOである)：

【化8】



S13

[ここで、

R<sup>4 1</sup>は、水素、メチル、エチル、シクロプロピルメチル、シアノメチル、シクロプロピル、ジフルオロエチル又はトリフルオロエチルであり；

R<sup>4 2</sup>は、水素、メチル、エチル、シクロプロピルメチル、シアノメチル、シクロプロピル、ジフルオロエチル又はトリフルオロエチルであり；

又は、

R<sup>4 1</sup>とR<sup>4 2</sup>は、それらが結合している窒素原子と一緒に、1～4のメチルで置換されていてもよいモルホリンを表す]

で置換されていてもよく；

R<sup>5</sup>は、水素、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素、-CN、メチル、エチル、イソプロピル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、シクロプロピル、メトキシ、エトキシ、ジフルオロメトキシ又はトリフルオロメトキシである]

で表される化合物並びにその塩及びN-オキシドである。

【0016】

極めて特に好ましいのは(構成5-1)、式(I)〔式中、

Xは、Oであり；

A<sub>1</sub>は、Nであり；

A<sub>2</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

R<sup>1</sup>は、水素であり；

R<sup>2</sup>は、3-クロロ-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3,5-ビス-(トリフルオロメチル)フェニル、3,5-ビス-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シアノ-5-(1-シアノ-1-メチル-エチル)フェニル、3-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シアノ-5-(1-シアノシクロプロピル)フェニル、3-(1-シアノシクロプロピル)-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、(3-クロロ-5-メチルスルホニルフェニル)、3-メチルスルホニル-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル及び5-(ジフルオロメチル)-1-メチル-ピラゾール-3-イルからなる群から選択され；

R<sup>3</sup>は、メチルであり；

R<sup>4</sup>は、5-クロロ-ピリジン-2-イル、5-シアノ-ピリジン-2-イル及び5-メトキシカルボニル-2-ピリジルからなる群から選択され；

R<sup>5</sup>は、水素及びメチルから選択される]

で表される化合物並びにその塩及びN-オキシドである。

【0017】

同様に極めて特に好ましいのは(構成5-2)、式(I)〔式中、

Xは、Oであり；

A<sub>1</sub>は、Nであり；

A<sub>2</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、Nであり；

A<sub>4</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；又は、

A<sub>1</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>2</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>3</sub>は、CR<sup>5</sup>であり；

A<sub>4</sub>は、Nであり；

R<sup>1</sup>は、水素であり；

R<sup>2</sup>は、3-クロロ-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-プロモ-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シアノ-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3,5-ビス(ジフルオロメチル)フェニル、3,5-ビス-(トリフルオロメチル)フェニル、3,5-ビス(ジフルオロメトキシ)フェニル、3,5-ビス-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-(1,1-ジフルオロエチル)-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シクロプロピル-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル、3-シアノ-5-(1-シアノ-1-メチル-エチル)フェニル、3-(1-シアノ-1-メチル-

10

20

30

40

50

エチル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シクロプロピル - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - シアノ - 5 - (1 - シアノシクロプロピル)フェニル、3 - (1 - シアノシクロプロピル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、(3 - クロロ - 5 - メチルスルホニルフェニル)、3 - メチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3 - (ジフルオロメチルスルホニル) - 5 - (トリフルオロメトキシ)フェニル、3, 5 - ビス(ジフルオロメチルスルホニル)フェニル及び5 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - ピラゾール - 3 - イルからなる群から選択され;

R<sup>3</sup>は、メチルであり;

R<sup>4</sup>は、ピリミジン - 2 - イル、5 - クロロ - ピリジン - 2 - イル、5 - シアノ - ピリジン - 2 - イル、5 - メトキシカルボニル - 2 - ピリジル、5 - (アミノカルボニル)ピリジン - 2 - イル、5 - (メチルカルバモイル)ピリジン - 2 - イル及び5 - (ジメチルアミノカルボニル)ピリジン - 2 - イルからなる群から選択され;

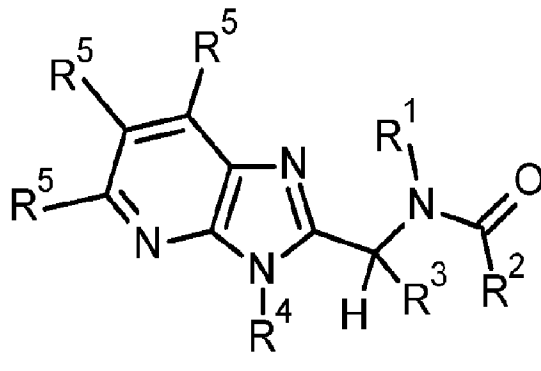
R<sup>5</sup>は、水素、フッ素及びメチルから選択される]

で表される化合物並びにその塩及びN - オキシドである。

【0018】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I - i)

【化9】

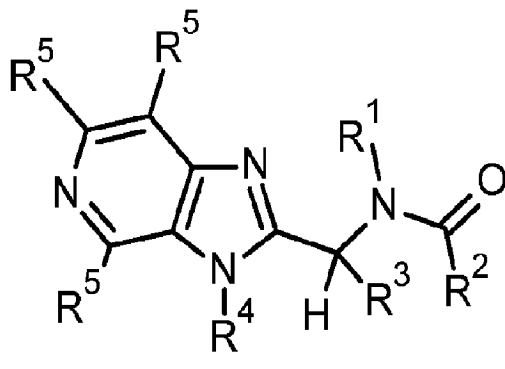


[式中、構造要素R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、構成(1 - 1)において与えられている意味又は構成(2 - 1)において与えられている意味又は構成(3 - 1)において与えられている意味又は構成(4 - 1)において与えられている意味又は構成(5 - 1)において与えられている意味又は構成(5 - 2)において与えられている意味を有する]で表される化合物に関する。

【0019】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I - ii)

【化10】



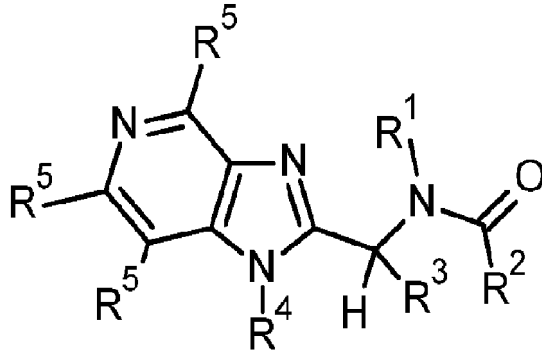
[式中、構造要素R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、構成(1 - 1)において与えられ

ている意味又は構成(2-1)において与えられている意味又は構成(3-1)において与えられている意味又は構成(4-1)において与えられている意味又は構成(5-1)において与えられている意味又は構成(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。

【0020】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-iii)

【化11】



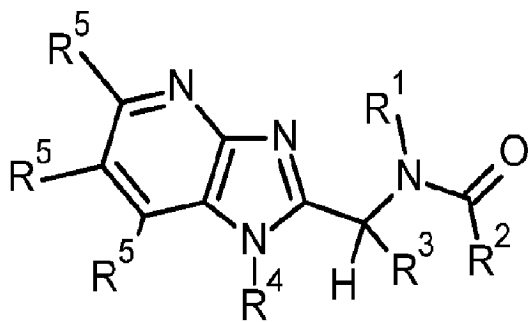
(I-iii)

〔式中、構造要素R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、構成(1-1)において与えられている意味又は構成(2-1)において与えられている意味又は構成(3-1)において与えられている意味又は構成(4-1)において与えられている意味又は構成(5-1)において与えられている意味又は構成(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。〕

【0021】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-iv)

【化12】



(I-iv)

〔式中、構造要素R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>5</sup>は、構成(1-1)において与えられている意味又は構成(2-1)において与えられている意味又は構成(3-1)において与えられている意味又は構成(4-1)において与えられている意味又は構成(5-1)において与えられている意味又は構成(5-2)において与えられている意味を有する)で表される化合物に関する。〕

【0022】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式(I-v)

10

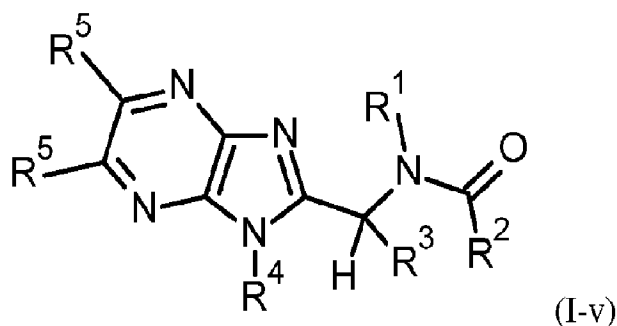
20

30

40

50

【化 1 3】



10

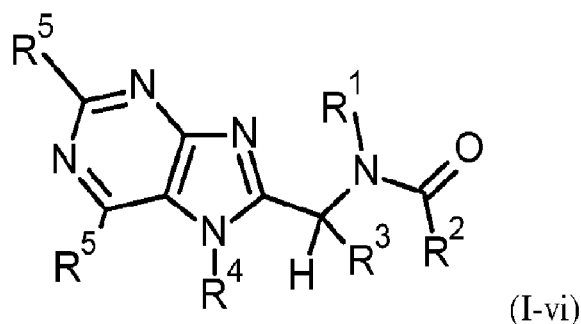
〔式中、構造要素  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は、構成 (1 - 1) において与えられている意味又は構成 (2 - 1) において与えられている意味又は構成 (3 - 1) において与えられている意味又は構成 (4 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 2) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0023】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - v i)

【化 1 4】

20



30

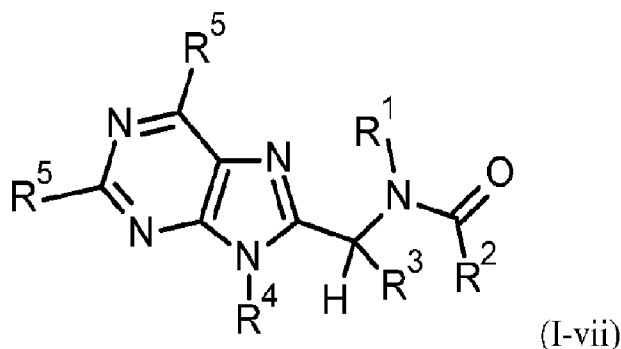
〔式中、構造要素  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は、構成 (1 - 1) において与えられている意味又は構成 (2 - 1) において与えられている意味又は構成 (3 - 1) において与えられている意味又は構成 (4 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 2) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0024】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - v i i)

【化 1 5】

40



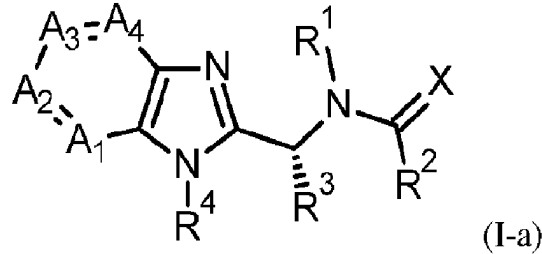
50

〔式中、構造要素  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $R^5$  は、構成 (1 - 1) において与えられている意味又は構成 (2 - 1) において与えられている意味又は構成 (3 - 1) において与えられている意味又は構成 (4 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 2) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

【0025】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - a)

【化16】



10

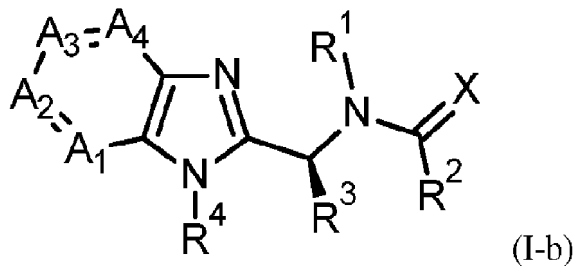
〔式中、構造要素  $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 、 $A_4$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $X$  は、構成 (1 - 1) において与えられている意味又は構成 (2 - 1) において与えられている意味又は構成 (3 - 1) において与えられている意味又は構成 (4 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 2) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

20

【0026】

好ましいさらなる実施形態では、本発明は、式 (I - b)

【化17】



30

〔式中、構造要素  $A_1$ 、 $A_2$ 、 $A_3$ 、 $A_4$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  及び  $X$  は、構成 (1 - 1) において与えられている意味又は構成 (2 - 1) において与えられている意味又は構成 (3 - 1) において与えられている意味又は構成 (4 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 1) において与えられている意味又は構成 (5 - 2) において与えられている意味を有する〕で表される化合物に関する。

40

【0027】

特に、本発明、中間体化合物 INT - 1 ~ INT - 7 を包含し、アミン及び酸の場合にはそれらの塩も包含し、並びに、アミン塩酸塩又はトリフラートの場合には遊離アミンも包含する (表 2 を参照されたい) :

INT - 1 : 6 - [ 2 - [ ( 1 S ) - 1 - アミノエチル ] イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩

INT - 2 : 1 - [ 3 - ( 5 - クロロ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン ; 2 , 2 , 2 - トリフルオロ酢酸

50

INT - 3 : 6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) - 7 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩

INT - 4 : メチル 6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボキシレート 塩酸塩

INT - 5 : 6 - [ 2 - [ 1 - アミノエチル ] - 6 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩

INT - 6 : 6 - [ 2 - [ 1 - アミノエチル ] - 5 - メチル - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩

INT - 7 : 1 - [ 1 - ( 5 - クロロ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン 塩酸塩

INT - 8 : 1 - [ 1 - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン トリフルオロ酢酸塩。

【 0 0 2 8 】

#### 定義

当業者は、表現「a」又は「an」が、本出願において使用されている場合、たとえ明示的に示されていなくても、その状況に応じて、「1」、「1以上」又は「少なくとも1」を意味し得るということを知っている。

【 0 0 2 9 】

環系及び基などの本明細書中に記載される全ての構造に関して、隣接する原子は、-O-O-又は-O-S-であってはならない。

【 0 0 3 0 】

可変数の可能な炭素原子（C原子）を有する構造は、より具体的に明記することを目的として、本出願においては、C炭素原子の下限-C炭素原子の上限構造（C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>構造）として記載され得る。例えば、アルキル基は3～10個の炭素原子で構成されることができ、その場合、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-アルキルに対応する。炭素原子とヘテロ原子で構成される環構造は、「LL～UL員」構造と記載され得る。6員環構造の1つの例は、トルエン（メチル基で置換されている6員環構造）である。

【 0 0 3 1 】

置換基に関する集合語、例えば、C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>-アルキルが、複合置換基、例えば、C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>-シクロアルキル-C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>-アルキルの最後にある場合、その複合置換基の最初にある構成要素、例えば、C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>-シクロアルキルは、同じように又は異なるように、そして、独立して、後者の置換基、例えば、C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>-アルキルで1置換又は多置換され得る。化学基、環系及び環状基に関して本出願中で使用されている全ての集合語は、「C<sub>LL</sub>-C<sub>UL</sub>」又は「LL～UL員」を追加することに、より具体的に明記することができる。

【 0 0 3 2 】

上記式中で与えられている記号の定義においては、以下の置換基を概して代表する集合語を使用した。

【 0 0 3 3 】

ハロゲンは、第7主族の元素、好ましくは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素、さらに好ましくは、フッ素、塩素及び臭素、一層さらに好ましくは、フッ素及び塩素に関する。

【 0 0 3 4 】

ヘテロ原子の例は、N、O、S、P、B、Siである。好ましくは、用語「ヘテロ原子」は、N、S及びOに関する。

【 0 0 3 5 】

本発明によれば、「アルキル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは1～6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,2-ジメチルプロピル、1,1-ジメチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシ

10

20

30

40

50

ル、1 - メチルペンチル、2 - メチルペンチル、3 - メチルペンチル、4 - メチルペンチル、1, 2 - ジメチルプロピル、1, 3 - ジメチルブチル、1, 4 - ジメチルブチル、2, 3 - ジメチルブチル、1, 1 - ジメチルブチル、2, 2 - ジメチルブチル、3, 3 - ジメチルブチル、1, 1, 2 - トリメチルプロピル、1, 2, 2 - トリメチルプロピル、1 - エチルブチル及び2 - エチルブチルを表す。1 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキル、例えば、とりわけ、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、n - ブチル、イソブチル、s - ブチル又はt - ブチルなども好ましい。本発明によるアルキルは、1 以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0036】

本発明によれば、「アルケニル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは2 ~ 6 個の炭素原子及び少なくとも1つの二重結合を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、ビニル、2 - プロペニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - メチル - 2 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、2 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1 - メチル - 2 - ブテニル、2 - メチル - 2 - ブテニル、3 - メチル - 2 - ブテニル、1 - メチル - 3 - ブテニル、2 - メチル - 3 - ブテニル、3 - メチル - 3 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 2 - プロペニル、2 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル、1 - メチル - 2 - ペンテニル、2 - メチル - 2 - ペンテニル、3 - メチル - 2 - ペンテニル、4 - メチル - 2 - ペンテニル、3 - メチル - 3 - ペンテニル、4 - メチル - 3 - ペンテニル、1 - メチル - 4 - ペンテニル、2 - メチル - 4 - ペンテニル、3 - メチル - 4 - ペンテニル、4 - メチル - 4 - ペンテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、2 - エチル - 3 - ブテニル、1, 1, 2 - トリメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロペニル及び1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロペニルを表す。2 ~ 4 個の炭素原子を有するアルケニル、例えば、とりわけ、2 - プロペニル、2 - ブテニル又は1 - メチル - 2 - プロペニルなども好ましい。本発明によるアルケニルは、1 以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0037】

本発明によれば、「アルキニル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは2 ~ 6 個の炭素原子及び少なくとも1つの三重結合を有する、直鎖又は分枝鎖の炭化水素、例えば、2 - プロピニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、2 - ペンチニル、3 - ペンチニル、4 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ブチニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロピニル、1 - エチル - 2 - プロピニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニル、1 - メチル - 2 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ペンチニル、1 - メチル - 4 - ペンチニル、2 - メチル - 3 - ペンチニル、2 - メチル - 4 - ペンチニル、3 - メチル - 4 - ペンチニル、4 - メチル - 2 - ペンチニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブチニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、1 - エチル - 3 - ブチニル、2 - エチル - 3 - ブチニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロピニル及び2, 5 - ヘキサジニルを表す。2 ~ 4 個の炭素原子を有するアルキニル、例えば、とりわけ、エチニル、2 - プロピニル又は2 - ブチニル - 2 - プロペニルなども好ましい。本発明によるアルキニルは、1 以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0038】

本発明によれば、「シクロアルキル」は、それ単独で又は化学基の一部として、好ましくは3 ~ 10 個の炭素を有する、単環式、二環式又は三環式の炭化水素、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオ



クチル、ビシクロ[2.2.1]ヘブチル、ビシクロ[2.2.2]オクチル又はアダマンチルを表す。3個、4個、5個、6個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキル、例えば、とりわけ、シクロプロピル又はシクロブチルなども好ましい。本発明によるシクロアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

**【0039】**

本発明によれば、「アルキルシクロアルキル」は、好ましくは4~10個又は4~7個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式のアルキルシクロアルキル、例えば、メチルシクロプロピル、エチルシクロプロピル、イソプロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチル及び4-メチルシクロヘキシルを表す。4個、5個又は7個の炭素原子を有するアルキルシクロアルキル、例えば、とりわけ、エチルシクロプロピル又は4-メチルシクロヘキシルなども好ましい。本発明によるアルキルシクロアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

**【0040】**

本発明によれば、「シクロアルキルアルキル」は、好ましくは4~10個又は4~7個の炭素原子を有する、単環式、二環式又は三環式のシクロアルキルアルキル、例えば、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル及びシクロペンチルエチルを表す。4個、5個又は7個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキル、例えば、とりわけ、シクロプロピルメチル又はシクロブチルメチルなども好ましい。本発明によるシクロアルキルアルキルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

**【0041】**

本発明によれば、「ヒドロキシアルキル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルコール、例えば、メタノール、エタノール、n-プロパノール、イソプロパノール、n-ブタノール、イソブタノール、s-ブタノール及びt-ブタノールを表す。1~4個の炭素原子を有するヒドロキシアルキル基も好ましい。本発明によるヒドロキシアルキル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

**【0042】**

本発明によれば、「アルコキシ」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のO-アルキル、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソプロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ及びt-ブトキシを表す。1~4個の炭素原子を有するアルコキシ基も好ましい。本発明によるアルコキシ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

30

**【0043】**

本発明によれば、「アルキルチオ」又は「アルキルスルファニル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のS-アルキル、例えば、メチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ及びt-ブチルチオを表す。1~4個の炭素原子を有するアルキルチオ基も好ましい。本発明によるアルキルチオ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

40

**【0044】**

本発明によれば、「アルキルスルフィニル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルスルフィニル、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル及びt-ブチルスルフィニルを表す。1~4個の炭素原子を有するアルキルスルフィニル基も好ましい。本発明によるアルキルスルフィニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換されることができ、そして、両方のエナンチオマーを包含する。

**【0045】**

本発明によれば、「アルキルスルホニル」は、好ましくは1~6個の炭素原子を有する

50

、直鎖又は分枝鎖アルキルスルホニル、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、 $n$ -プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、 $n$ -ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、 $s$ -ブチルスルホニル及び $t$ -ブチルスルホニルを表す。1~4個の炭素原子を有するアルキルスルホニル基も好ましい。本発明によるアルキルスルホニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0046】

本発明によれば、「シクロアルキルチオ」又は「シクロアルキルスルファニル」は、好ましくは3~6個の炭素原子を有する、 $-S$ -シクロアルキル、例えば、シクロプロピルチオ、シクロブチルチオ、シクロペンチルチオ、シクロヘキシルチオを表す。3~5個の炭素原子を有するシクロアルキルチオ基も好ましい。本発明によるシクロアルキルチオ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

【0047】

本発明によれば、「シクロアルキルスルフィニル」は、好ましくは3~6個の炭素原子を有する、 $-S(O)$ -シクロアルキル、例えば、シクロプロピルスルフィニル、シクロブチルスルフィニル、シクロペンチルスルフィニル、シクロヘキシルスルフィニルを表す。3~5個の炭素原子を有するシクロアルキルスルフィニル基も好ましい。本発明によるシクロアルキルスルフィニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換されることができ、そして、両方のエナンチオマーを包含する。

【0048】

本発明によれば、「シクロアルキルスルホニル」は、好ましくは3~6個の炭素原子を有する、 $-SO_2$ -シクロアルキル、例えば、シクロプロピルスルホニル、シクロブチルスルホニル、シクロペンチルスルホニル、シクロヘキシルスルホニルを表す。3~5個の炭素原子を有するシクロアルキルスルホニル基も好ましい。本発明によるシクロアルキルスルホニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0049】

本発明によれば、「フェニルチオ」又は「フェニルスルファニル」は、 $-S$ -フェニル、例えば、フェニルチオを表す。本発明によるフェニルチオ基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0050】

本発明によれば、「フェニルスルフィニル」は、 $-S(O)$ -フェニル、例えば、フェニルスルフィニルを表す。本発明によるフェニルスルフィニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換されることができ、そして、両方のエナンチオマーを包含する。

30

【0051】

本発明によれば、「フェニルスルホニル」は、 $-SO_2$ -フェニル、例えば、フェニルスルホニルを表す。本発明によるフェニルスルホニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0052】

本発明によれば、「アルキルカルボニル」は、メチルカルボニル、エチルカルボニル、 $n$ -プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、 $s$ -ブチルカルボニル及び $t$ -ブチルカルボニルなどの、好ましくは2~7個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキル $-C(=O)$ を表す。1~4個の炭素原子を有するアルキルカルボニルも好ましい。本発明によるアルキルカルボニルは、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

40

【0053】

本発明によれば、単独又は化学基の構成要素としての「アルコキシカルボニル」は、アルコキシ部分に好ましくは1~6個の炭素原子を有するか又は1~4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルコキシカルボニル、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、 $n$ -プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、 $s$ -ブトキシカルボニル及び $t$ -ブトキシカルボニルを表す。本発明によるアルコキシカルボニル基は、1以

50

上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0054】

本発明によれば、「アルキルアミノカルボニル」は、アルキル部分に好ましくは1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のアルキルアミノカルボニル、例えば、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n-プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、s-ブチルアミノカルボニル及びt-ブチルアミノカルボニルを表す。本発明によるアルキルアミノカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

【0055】

本発明によれば、「N,N-ジアルキルアミノカルボニル」は、アルキル部分に好ましくは1～6個の炭素原子又は1～4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝鎖のN,N-ジアルキルアミノカルボニル、例えば、N,N-ジメチルアミノカルボニル、N,N-ジエチルアミノカルボニル、N,N-ジ(n-プロピルアミノ)カルボニル、N,N-ジ(イソプロピルアミノ)カルボニル及びN,N-ジ(s-ブチルアミノ)カルボニルを表す。本発明によるN,N-ジアルキルアミノカルボニル基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

10

【0056】

本発明によれば、「アリール」は、好ましくは6～14個、特に6～10個の環炭素原子を有する、単環式、二環式又は多環式の芳香族系、例えば、フェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニルを表し、好ましくは、フェニルを表す。さらに、アリールは、結合部位が芳香族系上にある縮合多環式系、例えば、テトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、フルオレニル、ピフェニルなども表す。本発明によるアリール基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで置換され得る。

20

【0057】

置換されているアリールの例はアリールアルキルであり、これは、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル部分及び/又はC<sub>6</sub>-C<sub>14</sub>-アリール部分において1以上の同一であるか又は異なっているラジカルで同様に置換され得る。そのようなアリールアルキルの例としては、ベンジル及びフェニル-1-エチルなどを挙げることができる。

【0058】

本発明によれば、用語「多環式」環は、縮合された、架橋された及びスピロ環式の炭素環及びヘテロ環、並びに、単結合又は二重結合を介して連結された環系を意味する。

30

【0059】

本発明によれば、「ヘテロ環」、「ヘテロ環式環」又は「ヘテロ環式環系」は、少なくとも1個の炭素原子がヘテロ原子(好ましくは、N、O、S、P、B、Si、Seからなる群から選択されるヘテロ原子)で置き換えられており且つ飽和、不飽和又はヘテロ芳香族である少なくとも1つの環(ここで、該環は、置換されていなくても又は置換されていてもよく、結合部位は環原子上にある)を有する炭素環式環系を表す。異なるように定義されなていない限り、該ヘテロ環式環は、そのヘテロ環式環中に、好ましくは3～9個の環原子(特に、3～6個の環原子)と1個以上(好ましくは、1～4個、特に、1個、2個又は3個)のヘテロ原子(好ましくは、N、O及びSからなる群から選択されるヘテロ原子)を含んでいるが、2個の酸素原子は直接隣接してはならない。ヘテロ環式環は、通常、4個以下の窒素原子及び/又は2個以下の酸素原子及び/又は2個以下の硫黄原子を含んでいる。置換されていてもよいヘテロシクリルの場合、本発明は、多環式環系、例えば、8-アザビシクロ[3.2.1]オクタニル、1-アザビシクロ[2.2.1]ヘプチル、1-オキサ-5-アザスピロ[2.3]ヘキシル又は2,3-ジヒドロ-1H-インドールなども包含する。

40

【0060】

本発明によるヘテロシクリル基は、例えば、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、チアゾリジニル、オキサゾ

50

リジニル、ジオキサニル、ジオキサリル、ピラゾリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、オキセタニル、オキシラニル、アゼチジニル、アジリジニル、オキサゼチジニル、オキサジリジニル、オキサゼパニル、オキサジナニル、アゼパニル、オキソピロリジニル、ジオキソピロリジニル、オキソモルホリニル、オキソピペラジニル及びオキセパニルなどである。

【0061】

特に重要なのは、ヘテロアリール、即ち、ヘテロ芳香族系である。本発明によれば、用語「ヘテロアリール」は、ヘテロ芳香族化合物、即ち、ヘテロ環の上記定義に包含される完全に不飽和の芳香族ヘテロ環式化合物を表す。好ましいのは、上記群から選択される1~3個(好ましくは、1個又は2個)の同一であるか又は異なっているヘテロ原子を有する5~7員の環である。本発明によるヘテロアリールは、例えば、フリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-トリアゾリル及び1,2,4-トリアゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル及び1,2,5-オキサジアゾリル、アゼピニル、ピロリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、1,3,5-トリアジニル、1,2,4-トリアジニル及び1,2,3-トリアジニル、1,2,4-オキサジニル、1,3,2-オキサジニル、1,3,6-オキサジニル及び1,2,6-オキサジニル、オキセピニル、チエピニル、1,2,4-トリアゾロニル、並びに、1,2,4-ジアゼピニルである。本発明によるヘテロアリール基は、1以上の同一であるか又は異なっているラジカルでも置換され得る。

10

20

【0062】

本発明によれば、置換基=O(オキソ)は、メチレン(CH<sub>2</sub>)基の2個の水素原子又は水素以外の置換基のみを有する硫黄原子、窒素原子及びリン原子の孤立電子対に取って変わることができる。例えば、ラジカルC<sub>2</sub>-アルキルは、例えば、=O(オキソ)による置換によって-COCH<sub>3</sub>となり、ヘテロ環チエタン-3-イル-は、例えば、1つの=O(オキソ)基による置換によって1-オキソチエタン-3-イルとなり又は2つの=O(オキソ)基による置換によって1,1-ジオキソチエタン-3-イルとなる。

【0063】

本発明によれば、置換基=S(チオノ)は、メチレン(CH<sub>2</sub>)基の2個の水素原子に取って変わることができる。例えば、ラジカルC<sub>2</sub>-アルキルは、例えば、=S(チオノ)による置換によって-CSCH<sub>3</sub>となる。

30

【0064】

本明細書中で使用されている表現「置換されていてもよい」は、その置換されていてもよい基がさらなる置換基で置換されているか又はさらなる置換基で置換されていないことを意味する。

【0065】

用語「いずれの場合にも置換されていてもよい」は、基/置換基、例えば、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、シクロアルキル、アリール、フェニル、ベンジル、ヘテロシクリル及びヘテロアリールラジカルなどが置換されていることを意味し、これは、例えば、置換されていない基礎構造に由来する置換されているラジカルを意味し、ここで、該置換基(例えば、1の置換基、又は、複数の置換基、好ましくは、1、2、3、4、5、6又は7の置換基)は、例えば、アミノ、ヒドロキシル、ハロゲン、ニトロ、シアノ、イソシアノ、メルカプト、イソチオシアナト、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-カルボキシル、カルボンアミド、SF<sub>5</sub>、アミノスルホニル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-シクロアルキル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニル、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニル、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルキニル、N-モノ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、N,N-ジ-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキルアミノ、N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルカノイルアミノ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルケニルオキシ、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-アルキニルオキシ、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-シクロアルコキシ、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルケニルオキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ

40

50

カルボニル、 $C_2 - C_4$  - アルケニルオキシカルボニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニルオキシカルボニル、 $C_6$  - アリールオキシカルボニル、 $C_{10}$  - アリールオキシカルボニル、 $C_{14}$  - アリールオキシカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルカノイル、 $C_2 - C_4$  - アルケニルカルボニル、 $C_2 - C_4$  - アルキニルカルボニル、 $C_6$  - アリールカルボニル、 $C_{10}$  - アリールカルボニル、 $C_{14}$  - アリールカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_4$  - シクロアルキルチオ、 $C_2 - C_4$  - アルケニルチオ、 $C_5 - C_6$  - シクロアルケニルチオ、 $C_2 - C_4$  - アルキニルチオ、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルフィニル（ここで、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが包含される）、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルフィニル（ここで、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが包含される）、 $C_1 - C_4$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキルスルホニル、 $N$  - モノ -  $C_1 - C_4$  - アルキルアミノスルホニル、 $N$ ,  $N$  - ジ -  $C_1 - C_4$  - アルキルアミノスルホニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルホスフィニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルホスホニル（ここで、 $C_1 - C_4$  - アルキルホスフィニル及び $C_1 - C_4$  - アルキルホスホニルの両方のエナンチオマーが包含される）、 $N - C_1 - C_4$  - アルキルアミノカルボニル、 $N$ ,  $N$  - ジ -  $C_1 - C_4$  - アルキルアミノカルボニル、 $N - C_1 - C_4$  - アルカノイルアミノカルボニル、 $N - C_1 - C_4$  - アルカノイル -  $N - C_1 - C_4$  - アルキルアミノカルボニル、 $C_6$  - アリール、 $C_{10}$  - アリール、 $C_{14}$  - アリール、 $C_6$  - アリールオキシ、 $C_{10}$  - アリールオキシ、 $C_{14}$  - アリールオキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルチオ、 $C_6$  - アリールチオ、 $C_{10}$  - アリールチオ、 $C_{14}$  - アリールチオ、 $C_6$  - アリールアミノ、 $C_{10}$  - アリールアミノ、 $C_{14}$  - アリールアミノ、ベンジリアミノ、ヘテロシクリル及びトリアルキルシリル、二重結合を介して結合している置換基（例えば、 $C_1 - C_4$  - アルキリデン（例えば、メチリデン又はエチリデン）、オキソ基、イミノ基及び置換されているイミノ基）からなる群から選択される。2以上のラジカルが1以上の環を形成している場合、これらは、炭素環式、ヘテロ環式、飽和、部分的飽和、不飽和（例えば、芳香族環を包含する）であることができ、及び、さらに置換されていてもよい。例として上記で挙げられている置換基（「第1の置換基レベル」）は、それらが炭化水素質成分を含んでいる場合、それらの中にさらなる置換基（「第2の置換基レベル」）、例えば、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、ニトロ、シアノ、イソシアノ、アジド、アシルアミノ、オキソ基及びイミノ基からそれぞれ独立して選択される置換基のうち1つ以上を有していてもよい。用語「置換されている（されていてもよい）」基は、好ましくは、1又は2の置換基レベルのみを包含する。

#### 【0066】

本発明によるハロゲンで置換された化学基又はハロゲン化された基（例えば、アルキル又はアルコキシ）は、ハロゲンで1置換されているか、又は、置換基の可能な最大数までハロゲンで多置換されている。そのような基は、ハロ基（例えば、ハロアルキル）とも称される。ハロゲンで多置換されている場合、該ハロゲン原子は、同一であっても又は異なってもよく、そして、全てが1個の炭素原子に結合していてもよく又は複数の炭素原子に結合してもよい。ハロゲンは、特に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、好ましくは、フッ素、塩素又は臭素であり、さらに好ましくは、フッ素である。より特定的には、ハロゲンで置換されている基は、モノハロシクロアルキル、例えば、1 - フルオロシクロプロピル、2 - フルオロシクロプロピル又は1 - フルオロシクロブチル、モノハロアルキル、例えば、2 - クロロエチル、2 - フルオロエチル、1 - クロロエチル、1 - フルオロエチル、クロロメチル又はフルオロメチル、ペルハロアルキル、例えば、トリクロロメチル又はトリフルオロメチル又は $CF_2CF_3$ 、ポリハロアルキル、例えば、ジフルオロメチル、2 - フルオロ - 2 - クロロエチル、ジクロロメチル、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル又は2, 2, 2 - トリフルオロエチルである。ハロアルキルのさらなる例は、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル、2 - クロロ - 2,

2 - ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル及びペンタフルオロ - t - ブチルである。好ましいのは、1 ~ 4 個の炭素原子とフッ素、塩素及び臭素から選択される1 ~ 9 個（好ましくは、1 ~ 5 個）の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有するハロアルキルである。特に好ましいのは、1 個又は2 個の炭素原子とフッ素及び塩素から選択される1 ~ 5 個の同一であるか又は異なっているハロゲン原子を有するハロアルキル（例えば、とりわけ、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル又は2, 2 - ジフルオロエチル）である。ハロゲンで置換されている化合物のさらなる例は、ハロアルコキシ、例えば、 $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CHF}_2$  及び  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、ハロアルキルスルファニル、例えば、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1 - フルオロエチルチオ、2 - フルオロエチルチオ、2, 2 - ジフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリフルオロエチルチオ又は2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエチルチオ、ハロアルキルスルフィニル、例えば、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1 - フルオロエチルスルフィニル、2 - フルオロエチルスルフィニル、2, 2 - ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルフィニル及び2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエチルスルフィニル、ハロアルキルスルホニル基、例えば、ジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、1 - フルオロエチルスルホニル、2 - フルオロエチルスルホニル、2, 2 - ジフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニル及び2 - クロロ - 1, 1, 2 - トリフルオロエチルスルホニルである。

10

20

30

#### 【0067】

炭素原子を有するラジカルの場合、好ましいのは、1 ~ 4 個の炭素原子（特に、1 個又は2 個の炭素原子）を有するものである。一般に、ハロゲン（例えば、フッ素及び塩素）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  アルキル（好ましくは、メチル又はエチル）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  ハロアルキル（好ましくは、トリフルオロメチル）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  アルコキシ（好ましくは、メトキシ又はエトキシ）、 $(\text{C}_1 - \text{C}_4)$  ハロアルコキシ、ニトロ及びシアノの群から選択される置換基が好ましい。ここで、特に好ましいのは、置換基メチル、メトキシ、フッ素及び塩素である。

#### 【0068】

置換されているアミノ（例えば、1 置換アミノ又は2 置換アミノ）は、例えば、アルキル、ヒドロキシ、アミノ、アルコキシ、アシル及びアリーの群から選択される1 又は2 の同一であるか又は異なっているラジカルによって、N - 置換された置換アミノラジカルの群から選択されるラジカルを意味し；好ましくは、N - モノアルキルアミノ及びN, N - ジアルキルアミノ（例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、N, N - ジメチルアミノ、N, N - ジエチルアミノ、N, N - ジ - n - プロピルアミノ、N, N - ジイソプロピルアミノ又はN, N - ジブチルアミノ）、N - モノアルコキシアルキルアミノ又はN, N - ジアルコキシアルキルアミノ基（例えば、N - メトキシメチルアミノ、N - メトキシエチルアミノ、N, N - ジ（メトキシメチル）アミノ又はN, N - ジ（メトキシエチル）アミノ）、N - モノアリールアミノ及びN, N - ジアリールアミノ、例えば、置換されていてもよいアニリン、アシルアミノ、N, N - ジアシルアミノ、N - アルキル - N - アリーリアミノ、N - アルキル - N - アシルアミノ及び、さらに、飽和N - ヘテロ環を意味し；こ

40

50

で、好ましいのは、1～4個の炭素原子を有するアルキルラジカルであり；ここで、アールは、好ましくは、フェニル又は置換されているフェニルであり；アシルに関しては、以下でさらに与えられている定義が当てはまり、好ましくは、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルカノイルである。同様のことは、置換されているヒドロキシルアミノ又はヒドラジノにも適用される。

#### 【0069】

置換されているアミノは、さらに、窒素原子上に4つの有機置換基を有する第四級アンモニウム化合物（塩）も包含する。

#### 【0070】

置換されていてもよいフェニルは、好ましくは、置換されていないフェニルであるか、又は、ハロゲン、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルチオ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルスルフィニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルスルホニル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキルスルホニル、シアノ、イソシアノ及びニトロからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているフェニル、例えば、o-トリル、m-トリル及びp-トリル、ジメチルフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル及び4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル及び4-フルオロフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニル及び4-トリフルオロメチルフェニル、及び、4-トリクロロメチルフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,5-ジクロロフェニル、2,5-ジクロロフェニル及び2,3-ジクロロフェニル、o-メトキシフェニル、m-メトキシフェニル及びp-メトキシフェニル、4-ヘプタフルオロフェニルである。

10

20

#### 【0071】

置換されていてもよいシクロアルキルは、好ましくは、置換されていないシクロアルキルであるか、又は、ハロゲン、シアノ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルコキシ-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキル、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルキル及び(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-ハロアルコキシからなる群から選択される同一であるか若しくは異なっているラジカルで1置換若しくは多置換（好ましくは、最大で3置換）されているシクロアルキル、特に、1又は2の(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-アルキルラジカルで置換されているシクロアルキルである。

30

#### 【0072】

本発明の化合物は、好ましい実施形態で存在し得る。本明細書に記載されている個々の実施形態は、互いに組み合わせることができる。自然法則に反し、従って、当業者が自身の専門知識に基づいて除外するであろう組合せは含まれない。例えば、隣接する3個以上の酸素原子を有する環構造は除外される。

#### 【0073】

##### 異性体

式(I)で表される化合物は、その置換基の種類に応じて、幾何異性体の形態でも、及び/又は、光学活性異性体の形態でも、又は、種々の組成における対応する異性体混合物の形態でも、存在し得る。これらの立体異性体は、例えば、エナンチオマー、ジアステレオマー、アトロプ異性体又は幾何異性体である。従って、本発明は、純粋な立体異性体とそれら異性体の任意の混合物の両方を包含する。

40

#### 【0074】

##### 同位体変種

本発明は、式(I)で表される化合物の適切な全ての同位体変種も包含する。そのような化合物の同位体変種は、少なくとも1個の原子が、原子番号は同じであるが通常又は主

50

に天然で生じる原子量とは異なる原子量を有する別の原子で置き換えられている、式 ( I ) で表される化合物を意味するものと理解される。式 ( I ) で表される化合物の中に組み入れることが可能な同位体の例は、水素、炭素、窒素、酸素、リン、硫黄、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の同位体、例えば、 $^2\text{H}$  (重水素)、 $^3\text{H}$  (トリチウム)、 $^{13}\text{C}$ 、 $^{14}\text{C}$ 、 $^{15}\text{N}$ 、 $^{17}\text{O}$ 、 $^{18}\text{O}$ 、 $^{32}\text{P}$ 、 $^{33}\text{P}$ 、 $^{33}\text{S}$ 、 $^{34}\text{S}$ 、 $^{35}\text{S}$ 、 $^{36}\text{S}$ 、 $^{18}\text{F}$ 、 $^{36}\text{Cl}$ 、 $^{82}\text{Br}$ 、 $^{123}\text{I}$ 、 $^{124}\text{I}$ 、 $^{129}\text{I}$ 及び $^{131}\text{I}$ である。式 ( I ) で表される化合物の特定の同位体変種、例えば、特に、1種類以上の放射性同位体がその中に組み入れられているものは、例えば、作用機序又は活性成分の分布 (例えば、病原体の体内における作用機序又は活性成分の分布) について研究するのに、有用であり得る; この目的のためには、 $^3\text{H}$ 同位体又は $^{14}\text{C}$ 同位体で標識された化合物は、それらの製造及び検出が比較的容易であるため、特に適している。さらに、同位体 (例えば、重水素) を組み入れると、例えば、当該化合物の代謝安定性が増大する結果として、有利点 (例えば、半減期の延長、又は、必要とされる有効薬量の低減) がもたらされ得る。従って、式 ( I ) で表される化合物の同位体修飾は、本発明の好ましい実施形態も表し得る。式 ( I ) で表される化合物の同位体変種は、当業者には既知の方法によって、例えば、以下において記載されている方法及び代表的な実施形態において与えられている指示によって、個々の試薬及び/又は出発化合物 (分離された化合物) の適切な同位体修飾を用いて、調製することができる。

10

#### 【0075】

#### 方法及び使用

20

本発明は、害虫を防除する方法にも関し、ここで、該方法においては、式 ( I ) で表される化合物を害虫及び/又はそれらの生息環境に作用させる。害虫の該防除は、好ましくは、農業及び林業において、並びに、材料物質 (material) の保護において、実施される。好ましくは、ヒト又は動物の身体の外科的な又は治療的な処置方法及びヒト又は動物の身体に対して実施される診断方法は、上記方法から除外される。

#### 【0076】

本発明は、さらに、殺有害生物剤としての、特に、作物保護剤としての、式 ( I ) で表される化合物の使用にも関する。

#### 【0077】

本出願に関連して、用語「殺有害生物剤 (pesticide)」は、いずれの場合にも、常に、用語「作物保護剤」も包含する。

30

#### 【0078】

植物が良好な耐性を示し、恒温動物に対する毒性が望ましい程度であり、及び、良好な環境適合性を示す、式 ( I ) で表される化合物は、生物的ストレス要因及び非生物的ストレス要因に対して植物及び植物の器官を保護するのに適しており、収穫高を増大させるのに適しており、収穫物の質を向上させるのに適しており、また、農業において、園芸において、畜産業において、水性栽培において、森林で、庭園やレジャー施設で、貯蔵生産物や材料物質の保護において、及び、衛生学の分野において遭遇する害虫、特に、昆虫類、クモ形類動物、蠕虫類、特に、線虫類、及び、軟体動物を防除するのに適している。

#### 【0079】

40

本特許出願に関連して、用語「衛生学 (hygiene)」は、疾患 (特に、感染症) を予防することを目的とする任意の全ての手段、方法及び実施、並びに、ヒト及び動物の健康を保護するのに及び/又は環境を保護するのに及び/又は清潔を維持するのに役立つ任意の全ての手段、方法及び実施を意味するものと理解される。本発明によれば、これには、特に、きれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、例えば、繊維又は硬質表面 (特に、ガラス製、木製、コンクリート製、磁器製、セラミック製、プラスチック製の表面、又は、さらに、金属 (類) 製の表面) をきれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、並びに、これらを衛生害虫及び/又はその排泄物が存在していない状態に維持することを保証するための手段が包含される。これに関連して、好ましくは、ヒト又は動物の身体に対して施し得る外科的又は治療的な処

50



置方法、及び、ヒト又は動物の身体に対してなされる診断方法は、本発明による保護の範囲から除外される。

【0080】

用語「衛生学の分野」には、従って、そのような衛生学的手段、方法及び実施が重要である全ての領域、技術分野及び産業上の利用、例えば、調理場、パン屋、空港、浴室、スイミングプール、デパート、ホテル、病院、家畜小屋、畜産業などにおける衛生に関する全ての領域、技術分野及び産業上の利用が包含される。

【0081】

従って、用語「衛生害虫」は、衛生学の分野においてその存在が問題である、特に、健康上の理由に関して問題である、1種類以上の害虫を意味するものと理解される。従って、主な目的は、衛生学の分野において、衛生害虫の存在を回避するか若しくは最小限に抑制すること、及び/又は、衛生害虫との接触を回避するか若しくは最小限に抑制することである。このことは、特に、発生を予防するため及び既に存在している発生と取り組むための両方に使用することが可能な殺害虫剤を施用することによって達成することが可能である。害虫との接触を回避するか又は低減させる調製物を使用することも可能である。衛生害虫としては、例えば、以下に記載されている生物などを挙げるができる。

【0082】

かくして、用語「衛生学的な保護」には、そのような衛生学的手段、方法及び実施を維持及び/又は改善する全ての行為が包含される。

【0083】

式(I)で表される化合物は、好ましくは、殺有害生物剤として使用することができる。それらは、通常感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、並びに、全ての発育段階又は一部の発育段階に対して活性を示す。上記害虫としては、以下のものを挙げるができる：

【0084】

節足動物門の害虫、特に、クモ綱(Arachnida)の、例えば、アカルス属種(Acarus spp.)、例えば、アカルス・シロ(Acarus siro)、アケリア・クコ(Aceria kuko)、アケリア・シェルドニ(Aceria sheldoni)、アクトプス属種(Aculops spp.)、アクルス属種(Aculus spp.)、例えば、アクルス・フォクケウイ(Aculus fockeui)、アクルス・シュレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、アンブリオンマ属種(Amblyomma spp.)、アムフィテトラニクス・ビエネンシス(Amphitetranychus viennensis)、アルガス属種(Argas spp.)、ボオフィルス属種(Boophilus spp.)、ブレビバルプス属種(Brevipalpus spp.)、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)、ブリオビア・グラミヌム(Bryobia graminum)、ブリオビア・プラエチオサ(Bryobia praetiosa)、セントルロイデス属種(Centruroides spp.)、コリオプテス属種(Chorioptes spp.)、デルマニクス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス(Dermatophagoides pteronyssinus)、デルマトファゴイデス・ファリナエ(Dermatophagoides farinae)、デルマセントル属種(Dermacentor spp.)、エオテトラニクス属種(Eotetranychus spp.)、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ(Eotetranychus hicoriae)、エピトリメルス・ピリ(Epitimerus pyri)、エウテトラニクス属種(Eutetranychus spp.)、例えば、エウテトラニクス・バンクシ(Eutetranychus banksi)、エリオフィエス属種(Eriophyes spp.)、例えば、エリオフィエス・ピリ(Eriophyes pyri)、グリシファグス・ドメスティクス(Glycyphagus domesticus)、ハロチデウス・デストルクトル(Halotydeus destru

10

20

30

40

50

ctor)、ヘミタロソネムス属種 (*Hemitarsonemus* spp.)、例えば、ヘミタロソネムス・ラツス (*Hemitarsonemus latus*) (=ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*))、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イキソデス属種 (*Ixodes* spp.)、ラトロデクツス属種 (*Latrodectus* spp.)、ロキソスケレス属種 (*Loxosceles* spp.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (*Neutrombicula autumnalis*)、ヌフェルサ属種 (*Nuphersa* spp.)、オリゴニクス属種 (*Oligonychus* spp.)、例えば、オリゴニクス・コフェアエ (*Oligonychus coffeae*)、オリゴニクス・コニフェラルム (*Oligonychus coniferarum*)、オリゴニクス・イリシス (*Oligonychus ilicis*)、オリゴニクス・インジクス (*Oligonychus indicus*)、オリゴニクス・マンギフェルス (*Oligonychus mangiferus*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、オリゴニクス・プニカエ (*Oligonychus punicae*)、オリゴニクス・イオテルシ (*Oligonychus yothersi*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)、オルニトニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、パノニクス属種 (*Panonychus* spp.)、例えば、パノニクス・シトリ (*Panonychus citri*) (=メタテトラニクス・シトリ (*Metatetranychus citri*))、パノニクス・ウルミ (*Panonychus ulmi*) (=メタテトラニクス・ウルミ (*Metatetranychus ulmi*))、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocopturta oleivora*)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (*Platytetranychus multigituli*)、ポリファゴタルソネムス・ラツス (*Polyphagotarsonemus latus*)、プソロプテス属種 (*Psoroptes* spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipicephalus* spp.)、リゾグリフス属種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属種 (*Sarcoptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、ステネオタルソネムス属種 (*Steneotarsonemus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、タルソネムス属種 (*Tarsonemus* spp.)、例えば、タルソネムス・コンフス (*Tarsonemus confusus*)、タルソネムス・パリズ (*Tarsonemus pallidus*)、テトラニクス属種 (*Tetranychus* spp.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (*Tetranychus canadensis*)、テトラニクス・シンナバリヌス (*Tetranychus cinabarinus*)、テトラニクス・ツルケスタニ (*Tetranychus turkestanii*)、テトラニクス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (*Trombicula alfreddugesi*)、バエジョビス属種 (*Vaejovis* spp.)、バサテス・リコベルシシ (*Vasates lycopersici*) ;

ムカデ綱 (*Chilopoda*) の、例えば、ゲオフィルス属種 (*Geophilus* spp.)、スクチゲラ属種 (*Scutigera* spp.) ;

トビムシ目 (*Collembola*) 又はトビムシ綱の、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*) ; スミンツルス・ビリジス (*Smimthurus viridis*) ;

ヤスデ綱 (*Diplopoda*) の、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*) ;

昆虫綱 (*Insecta*) の、例えば、ゴキブリ目 (*Blattodea*) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (*Blattella orientalis*)、ブラッテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinai*)、ブラッテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、レウコファエ・マデラエ (*Leucophaea*

*a maderae* )、ロボプテラ・デシピエンス (*Loboptera decipiens*)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (*Neostylopyga rhombifolia*)、パンクロラ属種 (*Panchlora* spp.)、バルコブラッタ属種 (*Parcoblatta* spp.)、ペリプラネタ属種 (*Periplaneta* spp.)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (*Periplaneta americana*)、ペリプラネタ・オーストララシアエ (*Periplaneta australasiae*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*) ;  
 コウチュウ目 (*Coleoptera*) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (*Acalymma vittatum*)、アカントセリデス・オブテクトス (*Acanthoscelides obtectus*)、アドレツス属種 (*Adoretus* spp.)、  
 アエチナ・ツミダ (*Aethina tumida*)、アゲラスチカ・アルニ (*Agelastica alni*)、アグリルス属種 (*Agriilus* spp.)、例えば、アグリルス・プラニペンニス (*Agriilus planipennis*)、アグリルス・コキサリス (*Agriilus coxalis*)、アグリルス・ビリネアツス (*Agriilus bilineatus*)、アグリルス・アンキシウス (*Agriilus anxius*)、アグリオテス属種 (*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (*Agriotes linneatus*)、アグリオテス・マンクス (*Agriotes mancus*)、アグリオテス・オブスクルス (*Agriotes obscurus*)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (*Alphitobius diaperinus*)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (*Amphimallon solstitialis*)、アノビウム・ブクタツム (*Anobium punctatum*)、アノマラ・ズビア (*Anomala dubia*)、アノプロホラ属種 (*Anoplophora* spp.)、例えば、アノプロホラ・グラブリペンニス (*Anoplophora glabripennis*)、アントノムス属種 (*Anthonomus* spp.)、例えば、アントノムス・グランジス (*Anthonomus grandis*)、アントレヌス属種 (*Anthrenus* spp.)、アピオン属種 (*Apion* spp.)、アポゴニア属種 (*Apogonia* spp.)、アトウス・ハエモルホイダレス (*Athous haemorrhoidales*)、アトマリア属種 (*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (*Atomaria linearis*)、アタゲヌス属種 (*Attagenus* spp.)、バリス・カエルレセンス (*Baris caerulescens*)、ブルキジウス・オブテクトス (*Bruchidius obtectus*)、ブルクス属種 (*Bruchus* spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (*Bruchus pisorum*)、ブルクス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、カッシダ属種 (*Cassida* spp.)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotoma trifurcata*)、セウトリンクス属種 (*Ceutorrhynchus* spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (*Ceutorrhynchus assimilis*)、セウトリンクス・クアドリデンス (*Ceutorrhynchus quadridens*)、セウトリンクス・ラパエ (*Ceutorrhynchus rapae*)、カエトクネマ属種 (*Chaetocnema* spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (*Chaetocnema confinis*)、カエトクネマ・デンチクラタ (*Chaetocnema denticulata*)、カエトクネマ・エクチパ (*Chaetocnema ectypa*)、クレオヌス・メンジクス (*Cleonus mendicus*)、コノデルス属種 (*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属種 (*Cosmopolites* spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (*Cosmopolites sordidus*)、コステリトラ・ゼアランジカ (*Costelytra zealandica*)、クテニセラ属種 (*Ctenicera* spp.)、クルクリオ属種 (*Curculio* spp.)、例えば、クルクリオ・カリアエ (*Curculio caryae*)、クルクリオ・カリアトリペス (*Curculio caryatrypes*)、ク

ルクリオ・オブツス (*Curculio obtusus*)、クルクリオ・サイイ (*Curculio sayi*)、クリプトレステス・フェルギネウス (*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトレステス・プシルス (*Cryptolestes pusillus*)、クリプトリンクス・ラパチ (*Cryptorhynchus lapathi*)、クリプトリンクス・マンギフェラエ (*Cryptorhynchus mangiferae*)、シリンドロコプツルス属種 (*Cylindrocopturus* spp.)、シリンドロコプツルス・アドスペルス (*Cylindrocopturus adpersus*)、シリンドロコプツルス・フルニシ (*Cylindrocopturus furnissi*)、デンドロクトヌス属種 (*Dendroctonus* spp.)、例えば、デンドロクトヌス・ボンデロサエ (*Dendroctonus ponderosae*)、デルメステス属種 (*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属種 (*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ジアブロチカ・バルベリ (*Diabrotica barberi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ホワルジ (*Diabrotica undecimpunctata howardi*)、ジアブロチカ・ウンデシムプンクタタ・ウンデシムプンクタタ (*Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ビルギフェラ (*Diabrotica virgifera virgifera*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ・ゼアエ (*Diabrotica virgifera zeaee*)、ジコクロシス属種 (*Dichocrocis* spp.)、ジクラジスパ・アルミゲラ (*Dicladispa armigera*)、ジロボデルス属種 (*Diloboderus* spp.)、エピカエルス属種 (*Epicaerus* spp.)、エピラクナ属種 (*Epilachna* spp.)、例えば、エピラクナ・ボレアリス (*Epilachna borealis*)、エピラクナ・バリベスチス (*Epilachna varivestis*)、エピトリキス属種 (*Epitrix* spp.)、例えば、エピトリキス・ククメリス (*Epitrix cucumeris*)、エピトリキス・フスクラ (*Epitrix fuscula*)、エピトリキス・ヒルチペンニス (*Epitrix hirtipennis*)、エピトリキス・スブクリニタ (*Epitrix subcrinita*)、エピトリキス・ツベリス (*Epitrix tuberis*)、ファウスチヌス属種 (*Faustinus* spp.)、ギビウム・プシロイデス (*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス (*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス (*Hellula undalis*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、ヘテロニクス属種 (*Heteronyx* spp.)、ホプリア・アルゲンテア (*Hoplia argentea*)、ヒラモルファ・エレガンス (*Hylamorpha elegans*)、ヒロトルペス・バジュルス (*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ポストチカ (*Hypera postica*)、ヒポメセス・スクアモス (*Hypomeces squamosus*)、ヒポテネムス属種 (*Hypothenemus* spp.)、例えば、ヒポテネムス・ハムペイ (*Hypothenemus hampei*)、ヒポテネムス・オブスクルス (*Hypothenemus obscurus*)、ヒポテネムス・プベセンス (*Hypothenemus pubescens*)、ラクノステルナ・コンサンガイネア (*Lachnosterna consanguinea*)、ラシドデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザエ (*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属種 (*Lathridius* spp.)、レマ属種 (*Lema* spp.)、レプチノタルサ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、リモニウス・エクチプス (*Limonius ectypus*)、リッソロプトルス・オリゾフィルス (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リストロノツス属種 (*Listronotus* spp.) (=ヒペロデス属

10

20

30

40

50

種 (*Hyperodes* spp.)、リキス属種 (*Lixus* spp.)、ルペロ  
 デス属種 (*Luperodes* spp.)、ルペロモルファ・キサントデラ (*Lupe*  
*romorpha xanthodera*)、リクツス属種 (*Lyctus* spp.)  
 、メガシレネ属種 (*Megacyllene* spp.)、例えば、メガシレネ・ロビニ  
 アエ (*Megacyllene robiniae*)、メガセリス属種 (*Megascelis* spp.)、メラ  
 ノツス属種 (*Melanotus* spp.)、例えば、メラ  
 ノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)  
 、メロロンタ属種 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロンタ・メロロン  
 タ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクツス・  
 キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属  
 種 (*Necrobia* spp.)、ネオガレルセラ属種 (*Neogalerucella* spp.)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・  
 スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファ  
 グス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Oti*  
*orhynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Oti*  
*orhynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Oti*  
*orhynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Oti*  
*orhynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Oti*  
*orhynchus rugosostriarius*)、オチオリンクス・スルカツス (*Oti*  
*orhynchus sulcatus*)、オウレマ属種 (*Oulema* spp.)、  
 例えば、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリ  
 ザエ (*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジュクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllophaga* spp.)、フィロファガ  
 ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllotreta* spp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta armoraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア  
 ・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes* spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、プシリオデス属種 (*Psylliodes* spp.)、  
 例えば、プシリオデス・アフィニス (*Psylliodes affinis*)  
 )、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プシリオデス・プンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、  
 プチヌス属種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、リンコホルス属種 (*Rhynchophorus* spp.)、リンコホルス・フェルギネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム (*Rhynchophorus palmarum*)、スコリツス  
 属種 (*Scolytus* spp.)、例えば、スコリツス・ムルチストリアツス (*Scolytus multistriatus*)、シノキシロン・ペルホランス (*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、  
 例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフ  
 ィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス  
 (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus* spp.)

10

20

30

40

50

rus spp. )、ステゴビウム・パニセウム ( *Stegobium paniceum* )、ステルネクス属種 ( *Sternechus* spp. )、例えば、ステルネクス・パルダツス ( *Sternechus paludatus* )、シムフィレテス属種 ( *Symphyletes* spp. )、タニメクス属種 ( *Tanymecus* spp. )、例えば、タニメクス・ジラチコリス ( *Tanymecus dilatocollis* )、タニメクス・インジクス ( *Tanymecus indicus* )、タニメクス・パリアツス ( *Tanymecus palliatus* )、テネブリオ・モリトル ( *Tenebrio molitor* )、テネブリオイデス・マウレタニクス ( *Tenebriooides mauretanicus* )、トリボリウム属種 ( *Tribolium* spp. )、例えば、トリボリウム・アウダキス ( *Tribolium audax* )、トリボリウム・カスタネウム ( *Tribolium castaneum* )、トリボリウム・コンフスム ( *Tribolium confusum* )、トロゴデルマ属種 ( *Trogoderma* spp. )、チキウス属種 ( *Tychius* spp. )、キシロトレクス属種 ( *Xylotrechus* spp. )、ザブルス属種 ( *Zabrus* spp. )、例えば、ザブルス・テネブリオイデス ( *Zabrus tenebriooides* ) ;

ハサミムシ目 ( *Dermaptera* ) の、例えば、アニソラビス・マリチメ ( *Anisolabis maritime* )、ホルフィクラ・アウリクラリア ( *Forficula auricularia* )、ラビズラ・リパリア ( *Labidura riparia* ) ;

ハエ目 ( *Diptera* ) の、例えば、アエデス属種 ( *Aedes* spp. )、例えば、アエデス・アエギプチ ( *Aedes aegypti* )、アエデス・アルボピクツス ( *Aedes albopictus* )、アエデス・スチクチクス ( *Aedes sticticus* )、アエデス・ベキサンス ( *Aedes vexans* )、アグロミザ属種 ( *Agromyza* spp. )、例えば、アグロミザ・フロンテラ ( *Agromyza frontella* )、アグロミザ・パルビコルニス ( *Agromyza parvicornis* )、アナストレファ属種 ( *Anastrepha* spp. )、アノフェレス属種 ( *Anopheles* spp. )、例えば、アノフェレス・クアドリマクラツス ( *Anopheles quadrimaculatus* )、アノフェレス・ガムビアエ ( *Anopheles gambiae* )、アスホンジリア属種 ( *Asphondylia* spp. )、バクトロセラ属種 ( *Bactrocera* spp. )、例えば、バクトロセラ・ククルビタエ ( *Bactrocera cucurbitae* )、バクトロセラ・ドルサリス ( *Bactrocera dorsalis* )、バクトロセラ・オレアエ ( *Bactrocera oleae* )、ビピオ・ホルツラヌス ( *Bibio hortulanus* )、カリホラ・エリトロセファラ ( *Calliphora erythrocephala* )、カリホラ・ビシナ ( *Calliphora vicina* )、セラチチス・カピタタ ( *Ceratitis capitata* )、キロノムス属種 ( *Chironomus* spp. )、クリソミア属種 ( *Chrysomya* spp. )、クリソプス属種 ( *Chrysops* spp. )、クリソゾナ・プルビアリス ( *Chrysosona pluvialis* )、コクリオミア属種 ( *Cochliomya* spp. )、コンタリニア属種 ( *Contarinia* spp. )、例えば、コンタリニア・ジョンソニ ( *Contarinia johnsoni* )、コンタリニア・ナスツルチイ ( *Contarinia nasturtii* )、コンタリニア・ピリボラ ( *Contarinia pyrivora* )、コンタリニア・スクルジ ( *Contarinia schulzi* )、コンタリニア・ソルギコラ ( *Contarinia sorghicola* )、コンタリニア・トリチシ ( *Contarinia tritici* )、コルジロピア・アントロポファガ ( *Cordylobia anthropophaga* )、クリコトプス・シルベストリス ( *Cricotopus sylvestris* )、クレキス属種 ( *Culex* spp. )、例えば、クレキス・ピピエンス ( *Culex pipiens* )、クレキス・クインクエファシアツス ( *Culex quinquefasciatus* )、クリコイデス属種 ( *Culicoides* spp. )、クリセタ属種 ( *Culis*

eta spp. )、クテレブラ属種 (Cuterebra spp. )、ダクス・オレ  
 アエ (Dacus oleae)、ダシネウラ属種 (Dasineura spp. )、  
 例えば、ダシネウラ・ブラシカエ (Dasineura brassicae)、デリア  
 属種 (Delia spp. )、例えば、デリア・アントクア (Delia antiq  
 ua)、デリア・コアルクタタ (Delia coarctata)、デリア・フロリレ  
 ガ (Delia florilega)、デリア・プラツラ (Delia platura)、  
 デリア・ラジクム (Delia radicum)、デルマトビア・ホミニス (D  
 ermatobia hominis)、ドロソフィラ属種 (Drosophila s  
 pp. )、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル (Drosophila melano  
 gaster)、ドロソフィラ・スズキイ (Drosophila suzukii)、 10  
 エキノクネムス属種 (Echinocnemus spp. )、エウレイア・ヘラクレイ  
 (Euleia heraclei)、ファンニア属種 (Fannia spp. )、ガ  
 ステロフィルス属種 (Gasterophilus spp. )、グロッシナ属種 (Gl  
 ossina spp. )、ハエマトポタ属種 (Haematopota spp. )、  
 ヒドレリア属種 (Hydrellia spp. )、ヒドレリア・グリセオラ (Hydr  
 ellia griseola)、ヒレミア属種 (Hylemya spp. )、ヒッポ  
 ドスカ属種 (Hippobosca spp. )、ヒポデルマ属種 (Hypoderma  
 spp. )、リリオミザ属種 (Liriomyza spp. )、例えば、リリオミザ・  
 ブラシカエ (Liriomyza brassicae)、リリオミザ・フイドブレンシ  
 ス (Liriomyza huidobrensis)、リリオミザ・サチバエ (Lir 20  
 iomyza sativae)、ルシリア属種 (Lucilia spp. )、例えば  
 、ルシリア・クプリナ (Lucilia cuprina)、ルトゾミア属種 (Lut  
 zomyia spp. )、マンソニア属種 (Mansonina spp. )、ムスカ属  
 種 (Musca spp. )、例えば、ムスカ・ドメスチカ (Musca domest  
 ica)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ (Musca domestica vicin  
 a)、オエストルス属種 (Oestrus spp. )、オシネラ・フリト (Oscin  
 ella frit)、パラタニタルスス属種 (Paratanytarsus spp  
 . )、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ (Paralauterborniell  
 a subcincta)、ペゴミア又はペゴミイア属種 (Pegomya or Pe  
 gomymia spp. )、例えば、ペゴミア・ベタエ (Pegomya betae) 30  
 、ペゴミア・ヒオシアミ (Pegomya hyoscyami)、ペゴミア・ルビボラ  
 (Pegomya rubivora)、フレボトムス属種 (Phlebotomus  
 spp. )、ホルビア属種 (Phorbia spp. )、ホルミア属種 (Phormi  
 a spp. )、ピオフィラ・カセイ (Piophilica casei)、プラチパレア  
 ・ポエシロプテラ (Platyparea poeciloptera)、プロジプロシ  
 ス属種 (Prodiplosis spp. )、プシラ・ロサエ (Psila rosa  
 e)、ラゴレチス属種 (Rhagoletis spp. )、例えば、ラゴレチス・シン  
 グラタ (Rhagoletis cingulata)、ラゴレチス・コムプレタ (Rh  
 agoletis completa)、ラゴレチス・ファウスタ (Rhagoletis  
 fausta)、ラゴレチス・インジフェレンス (Rhagoletis indi 40  
 fferens)、ラゴレチス・メンダキス (Rhagoletis mendax)、  
 ラゴレチス・ポモネラ (Rhagoletis pomonella)、サルコファガ属  
 種 (Sarcophaga spp. )、シムリウム属種 (Simulium spp.  
 )、例えば、シムリウム・メリジオナレ (Simulium meridionale)  
 、ストモキス属種 (Stomoxys spp. )、タバヌス属種 (Tabanus s  
 pp. )、テタノポプス属種 (Tetanops spp. )、チブラ属種 (Tipul  
 a spp. )、例えば、チブラ・パルドサ (Tipula paludosa)、チブ  
 ラ・シムプレキス (Tipula simplex)、トキシトリパナ・クルビカウダ (T  
 oxotrypana curvicauda) ;

カメムシ目 (Hemiptera) の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ 50

(*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエア (*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス (*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ (*Acrida turrita*)、アシルトシボン属種 (*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシボン・ピスム (*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種 (*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種 (*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属種 (*Agonosцена* spp.)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・パロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、アオニジエラ・アウランチイ (*Aonidiella aurantii*)、アオニジエラ・シトリナ (*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフィス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフィス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフィス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフィス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフィス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフィス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフィス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフィス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフィス・イリノイセンシス (*Aphis illinoensis*)、アフィス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフィス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフィス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフィス・ボミ (*Aphis pomi*)、アフィス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフィス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジヤ・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルツム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleuciae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneosephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロプラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chloritauonuki*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Chrysomphalus aonidum*)、クリ



ソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ム  
 ビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomy  
 tilus halli*)、コックス属種 (*Coccus spp.*)、例えば、コック  
 ス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*C  
 occus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus  
 pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus viri  
 dis*)、クリプトミズス・リビス (*Cryptomyzus ribis*)、クリプト  
 ネオサ属種 (*Cryptoneossa spp.*)、クテナリタイナ属種 (*Ctena  
 rytaina spp.*)、ダルブルス属種 (*Dalbulus spp.*)、ジアレ  
 ウロデス・キテンデニ (*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウ 10  
 ロデス・シトリ (*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ (*Dia  
 phorina citri*)、ジアスピス属種 (*Diaspis spp.*)、ジウラ  
 フィス属種 (*Diuraphis spp.*)、ドラリス属種 (*Doralis spp  
 .*)、ドロシカ属種 (*Drosicha spp.*)、ジサフィス属種 (*Dysaphi  
 s spp.*)、例えば、ジサフィス・アピイホリア (*Dysaphis apiifo  
 lia*)、ジサフィス・プランタギネア (*Dysaphis plantaginea*)  
 、ジサフィス・ツリパエ (*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種 (*Dy  
 smicoccus spp.*)、エムポアスカ属種 (*Empoasca spp.  
 .*)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ (*Empoasca abrupta*)、エムポ  
 アスカ・ファバエ (*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ (*Emp 20  
 oasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ (*Empoasca solan  
 a*)、エムポアスカ・ステベンシ (*Empoasca stevensi*)、エリオソマ  
 属種 (*Eriosoma spp.*)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム (*Erios  
 oma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム (*Eriosoma lan  
 igerum*)、エリオソマ・ピリコラ (*Eriosoma pyricola*)、エリ  
 トロネウラ属種 (*Erythroneura spp.*)、エウカリプトリマ属種 (*Eu  
 calyptolyma spp.*)、エウフィルラ属種 (*Euphyllura sp  
 p.*)、エウセリス・ビロバツス (*Euscelis bilobatus*)、フェリシ  
 ア属種 (*Ferrisia spp.*)、フィオリニア属種 (*Fiorinia spp  
 .*)、フルカスピス・オセアニカ (*Furcaspis oceanica*)、ゲオコッ 30  
 クス・コフェアエ (*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種 (*Gly  
 caspis spp.*)、ヘテロプシラ・クバナ (*Heteropsylla cub  
 ana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ (*Heteropsylla spinulosa*)  
 、ホマロジスカ・コアグラタ (*Homalodisca coagulata*)、ヒア  
 ロプテルス・アルンジニス (*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプ  
 テルス・プルニ (*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種 (*Icerya  
 spp.*)、例えば、イセリア・プルカシ (*Icerya purchasi*)、イジオ  
 セルス属種 (*Idiocerus spp.*)、イジオスコプス属種 (*Idioscop  
 us spp.*)、ラオデルファキス・ストリアテルス (*Laodelphax str  
 iatellus*)、レカニウム属種 (*Lecanium spp.*)、例えば、レカニ 40  
 ウム・コルニ (*Lecanium corni*) (= パルテノレカニウム・コルニ (*Pa  
 rthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種 (*Lepidos  
 apheres spp.*)、例えば、レピドサフェス・ウルミ (*Lepidosaphes  
 ulmi*)、リパフィス・エリシミ (*Lipaphis erysimi*)、ロホレウカ  
 スピス・ジャポニカ (*Lopholeucaspis japonica*)、リコルマ・  
 デリカツラ (*Lycorma delicatula*)、マクロシフム属種 (*Macro  
 siphum spp.*)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ (*Macrosip  
 hum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ (*Macrosiphum lilii*)、マクロシフム・ロサエ (*Macrosiphum rosae*)、マクロス  
 テレス・ファシフロンス (*Macrosteles facifrons*)、マハナルバ 50

属種 (*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種 (*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム (*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス (*Monelliopsis pecanidis*)、ミズス属種 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotiana*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネオマスケリア属種 (*Neomaskellia* spp.)、ネホテッチキス属種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephotettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephotettix nigropictus*)、ネチゴニセラ・スペクトラ (*Nettigoniclla spectra*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lugens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・ブラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Oxya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベナエ (*Pemphigus populivenerae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属種 (*Perkinsiella* spp.)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェナコックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、フロエオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロドン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera* spp.)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera notabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカスピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウドコックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カルセオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコックス・コムストックイ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例えば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mali*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromalus* spp.)、ブルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidotus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランスレギアエ (*Quadr*

*aspidiotus juglansregiae* )、クアドラスピジオツス・オスト  
 レアエホルミス (*Quadraspidotus ostreaeformis*)、ク  
 アドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidotus pernicio-  
 s* )、クエサダ・ギガス (*Quesadagigas*)、ラストロコックス属  
 種 (*Rastrococcus spp.*)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosiphum  
 hum spp.*)、例えば、ロパロシフム・マイジス (*Rhopalosiphum  
 maidis*)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (*Rhopalosiphum ox-  
 yacanthae*)、ロパロシフム・パジ (*Rhopalosiphum padi*)  
 、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (*Rhopalosiphum rufiabdo-  
 minale*)、サイセチア属種 (*Saissetia spp.*)、例えば、サイセチ  
 ア・コフェアエ (*Saissetia coffeae*)、サイセチア・ミランダ (*Sa-  
 issetia miranda*)、サイセチア・ネグレクトア (*Saissetia neg-  
 lecta*)、サイセチア・オレアエ (*Saissetia oleae*)、スカホ  
 イデウス・チタヌ (*Scaphoideus titanus*)、スキザフィス・グラ  
 ミヌム (*Schizaphis graminum*)、セレナスピズス・アルチクラツス  
 (*Selenaspidus articulatus*)、シファ・フラバ (*Siphaf-  
 flava*)、シトピオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソガタ属種  
 (*Sogata spp.*)、ソガテラ・フルシフェラ (*Sogatella furc-  
 ifera*)、ソガトデス属種 (*Sogatodes spp.*)、スチクトセファラ・  
 フェスチナ (*Stictocephala festina*)、シホニヌス・フィリレア  
 エ (*Siphoninus phillyreae*)、テナラファラ・マライエンシス (*Ten-  
 alaphara malayensis*)、テトラゴノセフェラ属種 (*Tetr-  
 agonocephela spp.*)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tinoca-  
 lliscaryaefoliae*)、トマスピス属種 (*Tomaspis spp.*)  
 )、トキシプテラ属種 (*Toxoptera spp.*)、例えば、トキシプテラ・アウ  
 ランチイ (*Toxoptera aurantii*)、トキシプテラ・シトリシズス (*T-  
 oxoptera citricidus*)、トリアレウロデス・バボラリオルム (*Tr-  
 ialeurodes vaporariorum*)、トリオザ属種 (*Trioza s-  
 pp.*)、例えば、トリオザ・ジオスピリ (*Trioza diospyri*)、チフロ  
 シバ属種 (*Typhlocyba spp.*)、ウナスピス属種 (*Unaspis sp-  
 p.*)、ピテウス・ビチホリイ (*Viteus vitifolii*)、ジギナ属種 (*Z-  
 ygina spp.*) ;  
 カメムシ亜目 (*Heteroptera*) の、例えば、アエリア属種 (*Aelia s-  
 pp.*)、アナサ・トリスチス (*Anasa tristis*)、アンテスチオプシス属  
 種 (*Antestiopsis spp.*)、ボイセア属種 (*Boisea spp.*)  
 、ブリスス属種 (*Blissus spp.*)、カロコリス属種 (*Calocoris  
 spp.*)、カムピロンマ・リビダ (*Campylomma livida*)、カベレリ  
 ウス属種 (*Cavelerius spp.*)、シメキス属種 (*Cimex spp.*)  
 、例えば、シメキス・アドジュンクツス (*Cimex adjunctus*)、シメキス  
 ・ヘミプテルス (*Cimex hemipterus*)、シメキス・レクツラリウス (*C-  
 imex lectularius*)、シメキス・ピロセルス (*Cimex pilos-  
 ellus*)、コラリア属種 (*Collaria spp.*)、クレオンチアデス・ジル  
 ツス (*Creontiades dilutus*)、ダシヌス・ピペリス (*Dasynu-  
 s piperis*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatu-  
 s*)、ジコノコリス・ヘウエッチ (*Diconocoris hewetti*)、ジスデ  
 ルクス属種 (*Dysdercus spp.*)、エウスキスツス属種 (*Euschist-  
 us spp.*)、例えば、エウスキスツス・ヘロス (*Euschistus hero-  
 s*)、エウスキスツス・セルプス (*Euschistus servus*)、エウスキス  
 ツス・トリスチグムス (*Euschistus tristigmus*)、エウスキスツ  
 ス・バリオラリウス (*Euschistus variolarius*)、エウリデマ属

10

20

30

40

50

種 (*Eurydema* spp.)、エウリガステル属種 (*Eurygaster* spp.)、ハリオモルファ・ハリス (*Halyomorpha halys*)、ヘリオパルチス属種 (*Heliopeletis* spp.)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcias nobilellus*)、レプトコリス属種 (*Leptocorisa* spp.)、レプトコリス・バリコルニス (*Leptocorisa varicornis*)、レプトグロスス・オッシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属種 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エクスカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miridae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonion atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*)、ニシウス属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・ゲイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サーベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスターネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.) ;

ハチ目 (*Hymenoptera*) の、例えば、アクロミルメクス属種 (*Acromyrmex* spp.)、アタリア属種 (*Athalia* spp.)、例えば、アタリア・ロサエ (*Athalia rosae*)、アッタ属種 (*Atta* spp.)、カムボノツス属種 (*Camponotus* spp.)、ドリコベスブラ属種 (*Dolichovespula* spp.)、ジプリオン属種 (*Diprion* spp.)、例えば、ジプリオン・シミリス (*Diprion similis*)、ホプロカムパ属種 (*Hoplocampa* spp.)、例えば、ホプロカムパ・コオケイ (*Hoplocampa cookei*)、ホプロカムパ・テスツジネア (*Hoplocampa testudinea*)、ラシウス属種 (*Lasius* spp.)、リネピテマ (イリジオミルメクス) ・フミレ (*Linepithema (Iridiomyrmex) humile*)、モノモリウム・ファラオニス (*Monomorium pharaonis*)、パラトレキナ属種 (*Paratrechina* spp.)、パラベスブラ属種 (*Paravespula* spp.)、ブラギオレピス属種 (*Plagiolepis* spp.)、シレキス属種 (*Sirex* spp.)、例えば、シレキス・ノクチリオ (*Sirex noctilio*)、ソレノプシス・インビクタ (*Solenopsis invicta*)、タピノマ属種 (*Tapinoma* spp.)、テクノミルメクス・アルビペス (*Technomyrmex albipes*)、ウロセルス属種 (*Urocerus* spp.)、ベスバ属種 (*Vespa* spp.)、例えば、ベスバ・クラブロ (*Vespa crabro*)、ワスマンニア・アウロプンクタタ (*Wasmannia auropunctata*)、キセリス属種 (*Xeris* spp.) ;

ワラジムシ目 (*Isopoda*) の、例えば、アルマジリジウム・ブルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスクス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*) ;

シロアリ目 (*Isoptera*) の、例えば、コプトテルメス属種 (*Coptotermes* spp.) ;

mes spp. )、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランズ (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes* spp. )、インシテルメス属種 (*Incisitermes* spp. )、カロテルメス属種 (*Kalotermes* spp. )、マイクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、ナスチテルメス属種 (*Nasutitermes* spp. )、オドントテルメス属種 (*Odontotermes* spp. )、ポロテルメス属種 (*Porotermes* spp. )、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp. )、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ;

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp. )、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp. )、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama* spp. )、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属種 (*Anarsia* spp. )、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp. )、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属種 (*Argyroproce* spp. )、アウトグラファ属種 (*Autographa* spp. )、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブックラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberielia*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp. )、カコエシア属種 (*Cacoecia* spp. )、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルポカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルポシナ・ニポネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトピア・ブルマタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp. )、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura* spp. )、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cnaphalocerus* spp. )、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasia* spp. )、コノボモルファ属種 (*Conopomorpha* spp. )、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus* spp. )、コピタルシア属種 (*Copitarsia* spp. )、シジア属種 (*Cydia* spp. )、例えば、シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*)、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp. )、ジバロプシス属種 (*Diparopsis* spp. )、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、ジオリクトリア属種 (*Dioryctria* spp. )、例えば、ジオリクトリア・ジメルマニ (*Dioryctria zimmermani*)、エアリアス属種 (*Earias* spp. )、エクジトロファ・アウランチュム (*Ecdyto*

*lopha aurantium* )、エラスモパルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus* )、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina* )、エフェスチア属種 (*Ephestia* spp. )、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella* )、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella* )、エピノチア属種 (*Epinochia* spp. )、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas postvittana* )、エランニス属種 (*Erannis* spp. )、エルスコビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana* )、エチエラ属種 (*Etiella* spp. )、エウドシマ属種 (*Eudocima* spp. )、エウリア属種 (*Eulia* spp. )、エウボエシリア・アムビグエラ (*Eupoecilia ambiguella* )、エウプロクチス属種 (*Euproctis* spp. )、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea* )、エウキソア属種 (*Euxoa* spp. )、フェルチア属種 (*Feltia* spp. )、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella* )、グラシラリア属種 (*Gracillaria* spp. )、グラホリタ属種 (*Grapholitha* spp. )、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholitha molesta* )、グラホリタ・ブルニボラ (*Grapholitha prunivora* )、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp. )、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp. )、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera* )、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea* )、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp. )、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens* )、ヘピアルス属種 (*Hepialus* spp. )、例えば、ヘピアルス・フムリ (*Hepialus humuli* )、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella* )、ホモエオソマ属種 (*Homoeosoma* spp. )、ホモナ属種 (*Homona* spp. )、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella* )、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata* )、ランビデス属種 (*Lampides* spp. )、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp. )、ラスペイレシア・モレスタ (*Laspeyresia molesta* )、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis* )、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp. )、例えば、レウコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella* )、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp. )、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella* )、リトファネ・アンテンナタ (*Lithophane antennata* )、ロベシア属種 (*Lobesia* spp. )、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana* )、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta* )、リマントリア属種 (*Lymantria* spp. )、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar* )、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp. )、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella* )、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria* )、マルカ・テストラリス (*Maruca testulalis* )、マメストラ・ブラシカエ (*Mamestra brassicae* )、メラニチス・レダ (*Melanitis leda* )、モシス属種 (*Mocis* spp. )、モノピス・オブピエラ (*Monopis obviella* )、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata* )、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus* )、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp. )、オイケチクス属種 (*Oiketeticus* spp. )、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp. )、オペロフテラ属種 (*Operophtera* spp. )、オリア属種 (*Oria* spp. )、オルタガ属種 (*Orthaga* spp. )、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp. )、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis* )、パノリス・フランメ

10

20

30

40

50

ア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、  
ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴ  
ッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ  
属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthori  
maea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorima  
eae operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis  
citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.  
)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter bl  
ancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonoryct  
er crataegella*)、ピエリス属種 (*Pieris* spp.)、例えば、  
ピエリス・ラパエ (*Pieris rapae*)、プラチノタ・スツルタナ (*Platy  
nota stultana*)、プロジア・インテルプクテラ (*Plodia int  
erpunctella*)、ブルシア属種 (*Plusia* spp.)、ブルテラ・キシ  
ロステラ (*Plutella xylostella*) (=ブルテラ・マクリペンニス (*Plutella maculipennis*))、ポデシア属種 (*Podesia* s  
pp.)、例えば、ポデシア・シリングア (*Podesia syringae*)、ブラ  
イス属種 (*Prays* spp.)、プロデニア属種 (*Prodenia* spp.)、  
プロトパルセ属種 (*Protoparce* spp.)、プセウダレチア属種 (*Pseu  
daletia* spp.)、例えば、プセウダレチア・ユニpunkタ (*Pseudal  
etia unipuncta*)、プセウドブルシア・インクルデンス (*Pseudop  
lusia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nu  
bilalis*)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、スコエノビウ  
ス属種 (*Schoenobius* spp.)、例えば、スコエノビウス・ビpunkチフ  
エル (*Schoenobius bipunctifer*)、シルポファガ属種 (*Scirpoph  
aga innotata*)、例えば、シルポファガ・インノタタ (*Scirpoph  
aga innotata*)、スコチア・セゲツム (*Scotia segetum*)、  
セサミア属種 (*Sesamia* spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス (*Se  
samia inferens*)、スパルガノチス属種 (*Sparganothis* s  
pp.)、スポドプテラ属種 (*Spodoptera* spp.)、例えば、スポドプテ  
ラ・エラジアナ (*Spodoptera eradiana*)、スポドプテラ・エキシグ  
ア (*Spodoptera exigua*)、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodo  
ptera frugiperda*)、スポドプテラ・ブラエフィカ (*Spodopte  
ra praefica*)、スタトモポダ属種 (*Stathmopoda* spp.)、  
ステノマ属種 (*Stenoma* spp.)、ストモプテリキス・スプセシベラ (*Sto  
mopteryx subsecivella*)、シナンテドン属種 (*Synanthed  
on* spp.)、テシア・ソラニボラ (*Tecia solanivora*)、タウ  
メトポエア属種 (*Thaumetopoea* spp.)、テルメシア・ゲンマタリス (*Thermesia gemmatalis*)、チネア・クロアセラ (*Tinea cl  
oacella*)、チネア・ペリオネラ (*Tinea pellionella*)、  
チネオラ・ビッセリエラ (*Tineola bisselliella*)、トルトリキス  
属種 (*Tortrix* spp.)、トリコファガ・タペツェラ (*Trichophag  
a tapetzella*)、トリコブルシア属種 (*Trichoplusia* spp.  
)、例えば、トリコブルシア・ニ (*Trichoplusia ni*)、トリポリザ・  
インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ツタ・アブソルタ (*T  
uta absoluta*)、ピラコラ属種 (*Virachola* spp.) ;  
バッタ目 (*Orthoptera*) 又は (*Saltatoria*) の、例えば、アケタ  
・ドメスチクス (*Acheta domesticus*)、ジクロプルス属種 (*Dich  
roplus* spp.)、グリロタルパ属種 (*Gryllotalpa* spp.)、  
例えば、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalp  
a*)、ヒエログリフス属種 (*Hieroglyphus* spp.)、ロクスタ属種 (L  
50

ocusta spp. )、例えば、ロクスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプルス属種 (*Melanoplus* spp. )、例えば、メラノプルス・デバスタトル (*Melanoplus devastator*)、パラトランチクス・ウスリエンス (*Paratlanticus ussuriensis*)、スキストセルカ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) ;

シラミ目 (*Phthiraptera*) の、例えば、ダマリニア属種 (*Damalinia* spp. )、ハエマトピヌス属種 (*Haematopinus* spp. )、リノグナツス属種 (*Linognathus* spp. )、ペジクルス属種 (*Pediculus* spp. )、フィロキセラ・バスタトリキス (*Phylloxera vastatrix*)、フチルス・プビス (*Phthirus pubis*)、トリコデクテス属種 (*Trichodectes* spp. ) ; 10

チャタテムシ目 (*Psocoptera*) の、例えば、レピノツス属種 (*Lepinotus* spp. )、リボセリス属種 (*Liposcelis* spp. ) ;

ノミ目 (*Siphonaptera*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Ceratophyllus* spp. )、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephalides* spp. )、例えば、クテノセファリデス・カニス (*Ctenocephalides canis*)、クテノセファリデス・フェリス (*Ctenocephalides felis*)、プレクス・イリタンス (*Pulex irritans*)、ツンガ・ペネトランス (*Tunga penetrans*)、ксеノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*) ; 20

アザミウマ目 (*Thysanoptera*) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (*Anaphothrips obscurus*)、バリオトリプス・ビホルミス (*Baliothrips biformis*)、カエタナホトリプス・レエウウェニ (*Chaetanaphothrips leeuweni*)、ドレパノトリプス・レウテリ (*Drepanothrips reuteri*)、エンネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属種 (*Frankliniella* spp. )、例えば、フランクリニエラ・フスカ (*Frankliniella fusca*)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・スクルトゼイ (*Frankliniella schultzei*)、フランクリニエラ・トリチシ (*Frankliniella tritici*)、フランクリニエラ・バシニイ (*Frankliniella vaccinii*)、フランクリニエラ・ウィリアムシ (*Frankliniella williamsi*)、ハプロトリプス属種 (*Haplothrips* spp. )、ヘリオトリプス属種 (*Heliothrips* spp. )、ヘルシノトリプス・フェモラリス (*Hercinothrips femoralis*)、カコトリプス属種 (*Kakothrips* spp. )、リピホロトリプス・クルエンタツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトトリプス属種 (*Scirtothrips* spp. )、タエニオトリプス・カルダモミ (*Taeniothrips cardamomi*)、トリプス属種 (*Thrips* spp. )、例えば、トリプス・パルミ (*Thrips palmi*)、トリプス・タバシ (*Thrips tabaci*) ; 30 40

シミ目 (*Zygentoma* (= *Thysanura*) ) の、例えば、クテノレピスマ属種 (*Ctenolepisma* spp. )、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)、レスピモデス・インクイリヌス (*Lepismodes inquilinus*)、テルモビア・ドメスチカ (*Thermobia domestica*) ;

コムカデ綱 (*Symphyla*) の、例えば、スクチゲレラ属種 (*Scutigerebella* spp. )、例えば、スクチゲレラ・インマクラタ (*Scutigerebella immaculata*) ;

軟体動物門 (*Mollusca*) の害虫、例えば、ニマイガイ綱 (*Bivalvia*) の、例えば、ドレイセナ属種 (*Dreissena* spp. ) ; 及び、さらに、 50



マキガイ綱 (Gastropoda) の、例えば、アリオン属種 (Arion spp.)、例えば、アリオン・アテル・ルフス (Arion ater rufus)、ピオムファラリア属種 (Biomphalaria spp.)、ブリヌス属種 (Bulinus spp.)、デロセラス属種 (Deroceras spp.)、例えば、デロセラス・ラエベ (Deroceras laeve)、ガルバ属種 (Galba spp.)、リムナエア属種 (Lymnaea spp.)、オンコメラニア属種 (Oncomelania spp.)、ポマセア属種 (Pomacea spp.)、スクシネア属種 (Succinea spp.);

線形動物門 (Nematoda) の植物害虫 (即ち、植物寄生性線虫)、特に、アグレンクス属種 (Aglenchus spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (Aglenchus agricola)、アングイナ属種 (Anguina spp.)、例えば、アングイナ・トリチシ (Anguina tritici)、アフエレンコイデス属種 (Aphelenchoides spp.)、例えば、アフエレンコイデス・アラキジス (Aphelenchoides arachidis)、アフエレンコイデス・フラガリアエ (Aphelenchoides fragariae)、ベロノライムス属種 (Belonolaimus spp.)、例えば、ベロノライムス・グラシリス (Belonolaimus gracilis)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (Belonolaimus longicaudatus)、ベロノライムス・ノルトニ (Belonolaimus nortoni)、ブルサフェレンクス属種 (Bursaphelenchus spp.)、例えば、ブルサフェレンクス・ココフィルス (Bursaphelenchus cocophilus)、ブルサフェレンクス・エレムス (Bursaphelenchus eremus)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス (Bursaphelenchus xylophilus)、カコパウルス属種 (Cacopaurus spp.)、例えば、カコパウルス・ペスチス (Cacopaurus pestis)、クリコネメラ属種 (Criconemella spp.)、例えば、クリコネメラ・クルバタ (Criconemella curvata)、クリコネメラ・オノエンシス (Criconemella onoensis)、クリコネメラ・オルナタ (Criconemella ornata)、クリコネメラ・ルシウム (Criconemella rusium)、クリコネメラ・キセノブラキス (Criconemella xenoplax) (=メソクリコネマ・キセノブラキス (Mesocriconema xenoplax))、クリコネモイデス属種 (Criconemoides spp.)、例えば、クリコネモイデス・フェルニアエ (Criconemoides ferniae)、クリコネモイデス・オノエンセ (Criconemoides onoense)、クリコネモイデス・オルナツム (Criconemoides ornatum)、ジチレンクス属種 (Ditylenchus spp.)、例えば、ジチレンクス・ジブサシ (Ditylenchus dipsaci)、ドリコドルス属種 (Dolichodorus spp.)、グロボデラ属種 (Globodera spp.)、例えば、グロボデラ・パリダ (Globodera pallida)、グロボデラ・ロストキエンシス (Globodera rostochiensis)、ヘリコチレンクス属種 (Helicotylenchus spp.)、例えば、ヘリコチレンクス・ジヒステラ (Helicotylenchus dihystera)、ヘミクリコネモイデス属種 (Hemicriconemoides spp.)、ヘミシクリオホラ属種 (Hemicycliophora spp.)、ヘテロデラ属種 (Heterodera spp.)、例えば、ヘテロデラ・アベナエ (Heterodera avenae)、ヘテロデラ・グルシネス (Heterodera glycines)、ヘテロデラ・スカクチイ (Heterodera schachtii)、ヒルスクマニエラ属種 (Hirschmaniella spp.)、ホプロライムス属種 (Hoplolaimus spp.)、ロンギドルス属種 (Longidorus spp.)、例えば、ロンギドルス・アフリカヌス (Longidorus africanus)、メロイドギネ属種 (Meloidogyne spp.)、例えば、メロイドギネ

10

20

30

40

50

・キトウォオジ (*Meloidogyne chitwoodi*)、メロイドギネ・ファラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコツプス属種 (*Nacobbus* spp.)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus* spp.)、パラロングドルス属種 (*Paralongidorus* spp.)、パラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus* spp.)、パラトリコドルス属種 (*Paratrichodorus* spp.)、例えば、パラトリコドルス・ミノル (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paratylenchus* spp.)、プラチレンクス属種 (*Pratylenchus* spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プセウドハレンクス属種 (*Pseudohalenchus* spp.)、プシレンクス属種 (*Psilenchus* spp.)、プンクトデラ属種 (*Punctodera* spp.)、クイニスルシウス属種 (*Quinisulcius* spp.)、ラドホルス属種 (*Radopholus* spp.)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (*Radopholus citrophilus*)、ラドホルス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンクルス属種 (*Rotylenchulus* spp.)、ロチレンクス属種 (*Rotylenchus* spp.)、スクテロネマ属種 (*Scutellonema* spp.)、スバングイナ属種 (*Subanguina* spp.)、トリコドルス属種 (*Trichodorus* spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス (*Trichodorus obtusus*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*)、チレンコリンクス属種 (*Tylenchorhynchus* spp.)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス (*Tylenchorhynchus annulatus*)、チレンクルス属種 (*Tylenchulus* spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*)、キシフィネマ属種 (*Xiphinema* spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス (*Xiphinema index*)。

#### 【0085】

式 (I) で表される化合物は、場合により、特定の濃度又は特定の施用量において、除草剤、薬害軽減剤、成長調節剤若しくは植物の特性を改善する作用薬としても使用し得るか、又は、殺微生物剤 (*microbicide*) 若しくは除雄剤 (*gametocide*) として、例えば、殺菌剤 (*fungicide*)、抗真菌剤 (*antimycotic*)、殺細菌剤若しくは殺ウイルス剤 (これは、ウイロイドに対する作用薬も包含する) としても使用し得るか、又は、MLO (マイコプラズマ様生物) 及び RLO (リケッチア様生物) に対する作用薬としても使用し得る。適切な場合には、それらは、別の活性化化合物を合成するための中間体又は前駆物質としても使用することができる。

#### 【0086】

##### 製剤 / 使用形態

本発明は、さらに、製剤、特に、望ましくない動物害虫を防除するための製剤に関する。該製剤は、動物害虫及び / 又はそれらの生息環境に施用することができる。

#### 【0087】

本発明の製剤は、「即時使用可能な (*ready-for-use*)」使用形態として最終使用者に提供することができ、即ち、該製剤は、植物又は種子に対して噴霧装置又は散粉装置のような適切な装置によって直接施用することができる。あるいは、該製剤は、使用する前に、好ましくは水で、希釈することが必要な濃厚物の形態で最終使用者に提供することができる。従って、別途示されていない限り、表現「製剤」は、そのような濃厚物を意味し、一方、表現「使用形態」は、「即時使用可能な」溶液としての、即ち、通常はそのような希釈された製剤としての、最終使用者を意味する。

#### 【0088】

本発明の製剤は、慣習的な方法で、例えば、本発明の化合物を本明細書中に開示されている補助剤などの1種類以上の適切な補助剤と混合させることによって、調製することができる。

【0089】

該製剤は、少なくとも1の本発明の化合物及び少なくとも1種類の農業に適した補助剤（例えば、担体（単数又は複数）及び/又は界面活性剤（単数又は複数））を含んでいる。

【0090】

担体は、一般に不活性である、固体又は液体の天然又は合成の有機物質又は無機物質である。そのような担体は、概して、該化合物の施用、例えば、植物、植物の部分又は種子への施用を、改善させる。適切な固体担体の例としては、限定するものではないが、アンモニウム塩、特に、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム及び硝酸アンモニウム、天然岩粉、例えば、カオリン、クレー、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト及びケイ藻土、シリカゲル、並びに、合成岩粉、例えば、微粉化シリカ、アルミナ及びシリケートなどがある。粒剤を調製するのに典型的に有用な固体担体の例としては、限定するものではないが、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石及び苦灰岩、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、有機材料、例えば、紙、おがくず、ココナッツ殻、トウモロコシ穂軸及びタバコの葉柄などからなる顆粒などがある。適切な液体担体の例としては、限定するものではないが、水、有機溶媒及びそれを組み合わせたものなどがある。適切な溶媒の例としては、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の種類から選択されるものなどがある：芳香族及び非芳香族の炭化水素類（例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、アルキルベンゼン類、キシレン、トルエン、テトラヒドロナフテレン、アルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン）、アルコール類及びポリオール類（これらは、場合により、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい、例えば、エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノール又はグリコール）、ケトン類（例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、アセトフェノン又はシクロヘキサノン）、エステル類（これは、脂肪類及び油類を包含する）及び（ポリ）エーテル類、置換されていない及び置換されているアミン類、アミド類（例えば、ジメチルホルムアミド又は脂肪酸アミド類）及びそれらのエステル、ラクタム類（例えば、N-アルキルピロリドン類、特に、N-メチルピロリドン）及びラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類（例えば、ジメチルスルホキシド）、植物起源又は動物起源の油、ニトリル類（アルキルニトリル類、例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、又は、芳香族ニトリル類、例えば、ベンゾニトリル）、炭酸エステル類（環状炭酸エステル類、例えば、炭酸エチレン、炭酸プロピレン、炭酸ブチレン、又は、ジアルキル炭酸エステル、例えば、炭酸ジメチル、炭酸ジエチル、炭酸ジプロピル、炭酸ジブチル、炭酸ジオクチル）。該担体は、液化ガス増量剤、即ち、標準温度及び標準圧下では気体である液体、例えば、エアゾル噴射剤、例えば、八口炭化水素類、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などであることもできる。

【0091】

好ましい固体担体は、クレー、タルク及びシリカから選択される。

【0092】

好ましい液体担体は、水、脂肪酸アミド類及びそのエステル、芳香族及び非芳香族の炭化水素類、ラクタム類、ラクトン類、炭酸エステル類、ケトン類、（ポリ）エーテル類から選択される。

【0093】

担体の量は、典型的には、該製剤の、1～99.99重量%の範囲、好ましくは、5～99.9重量%の範囲、さらに好ましくは、10～99.5重量%の範囲、及び、最も好ましくは、20～99重量%の範囲である。

10

20

30

40

50

## 【0094】

液体担体は、典型的には、該製剤の20～90重量%の範囲、例えば、30～80重量%の範囲内で存在する。

## 【0095】

固体担体は、典型的には、該製剤の0～50重量%の範囲、好ましくは、5～45重量%の範囲、例えば、10～30重量%の範囲内で存在する。

## 【0096】

該製剤が2種以上の担体を含んでいる場合、そのおおよその範囲は、担体の総量を意味する。

## 【0097】

該界面活性剤は、イオン性（カチオン性又はアニオン性）、両性イオン性又は非イオン性の界面活性剤、例えば、イオン性又は非イオン性の乳化剤、泡形成剤、分散剤、湿潤剤、浸透増強剤及びそれらの任意の混合物であることができる。適切な界面活性剤の例としては、限定するものではないが、以下のものなどを挙げることができる：ポリアクリル酸の塩、エトキシ化ポリ（ - 置換）アクリレート誘導体、リグノスルホン酸の塩（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム）、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、アルコール若しくは脂肪酸若しくは脂肪アミンを含んでいる又は含んでいないエチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドの重縮合物（ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、例えば、ヒマシ油エトキシレート、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル）、置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリアルフェノール）、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコール若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール（例えば、グリセロール又はソルビトール又はスクロース）の脂肪酸エステル、スルフェート（例えば、アルキルスルフェート及びアルキルエーテルスルフェート）、スルホネート（例えば、アルキルするホネート、アリアルスルホネート及びアルキルベンゼンスルホネート）、ナフタレン/ホルムアルデヒドのスルホン化ポリマー、リン酸エステル、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液及びメチルセルロース。この段落における塩への言及は、好ましくは、それぞれのアルカリ塩、アルカリ土類金属塩及びアンモニウム塩を示している。

## 【0098】

好ましい界面活性剤は、エトキシ化ポリ（ - 置換）アクリレート誘導体、アルコールを含んでいるエチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドの重縮合物、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、アルキルベンゼンスルホネート、ナフタレン/ホルムアルデヒドのスルホン化ポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、例えば、ヒマシ油エトキシレート、リグノスルホン酸ナトリウム並びにアリアルフェノールエトキシレートから選択される。

## 【0099】

界面活性剤の量は、典型的には、該製剤の5～40重量%の範囲、例えば、10～20重量%の範囲である。

## 【0100】

適切な補助剤のさらなる例としては、以下のものなどがある：撥水剤、乾燥剤、結合剤（接着剤、粘着性付与剤、固定剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、天然のリン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び、合成リン脂質、ポリビニルピロリドン及びチロース）、増粘剤及び第2の増粘剤（例えば、セルロースエーテル、アクリル酸誘導体、キサンタンガム、変性クレー、例えば、Bentoneの名称で入手可能な製品、及び、微粉化シリカ）、安定剤（例えば、低温安定剤、防腐剤（例えば、ジクロロフェン、ベンジルアルコールヘミホルマール、1,2-ベンゾイソチアゾリン-3-オン、2-メチル-4-イソチアゾリン

10

20

30

40

50

- 3 - オン)、酸化防止剤、光安定剤、特に、紫外線安定剤、又は、化学的及び/若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤)、染料又は顔料(例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー(Prussian Blue);有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料)、消泡剤(例えば、シリコーン消泡剤及びステアリン酸マグネシウム)、不凍剤、固着剤、ジベレリン類、及び、加工助剤、鉱油及び植物油、芳香物質、蠟、栄養素(これは、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などの微量栄養素を包含する)、保護コロイド、揺変性物質、浸透剤、金属イオン封鎖剤、及び、錯体形成物質(complex former)。

#### 【0101】

該補助剤の選択は、本発明の化合物の意図された施用方法及び/又はその化合物の物理的特性に依存する。さらに、該補助剤は、該製剤又はその製剤から調製された使用形態に特別な特性(技術的特性、物理的特性及び/又は生物学的特性)を付与するために選択することもできる。補助剤を選択することによって、当該製剤を特定のニーズに合わせてカスタマイズすることができる。

#### 【0102】

該製剤は、殺虫/殺ダニ/殺線虫有効量の本発明の化合物(単数又は複数)を含んでいる。用語「有効量」は、栽培植物上の有害な昆虫/ダニ/線虫を防除するのに又は材料の保護において充分であり且つ処理された植物に実質的な損傷をもたらさない量を表す。そのような量は、広い範囲内でさまざまであることができ、そして、種々の要因、例えば、防除対象の昆虫/ダニ/線虫の種、処理された栽培植物又は材料、気候条件及び使用される本発明の特定の化合物などに依存する。通常、本発明による製剤は、0.01~99重量%、好ましくは、0.05~98重量%、さらに好ましくは、0.1~95重量%、一層さらに好ましくは、0.5~90重量%、最も好ましくは、1~80重量%の本発明化合物を含んでいる。製剤は、2種以上の本発明化合物を含むことができる。そのような場合、おおよその範囲は、本発明の化合物の総量を示している。

#### 【0103】

本発明の製剤は、溶液剤(例えば、水溶液剤)、エマルジョン剤、水性及び油性の懸濁液剤、粉末剤(例えば、水和剤、可溶性粉末剤)、粉剤、ペースト剤、顆粒剤(例えば、可溶性顆粒剤、ばらまき用顆粒剤)、サスポエマルジョン製剤、本発明の化合物を含浸させた天然産物又は合成産物、肥料、及び、さらに、ポリマー物質中にマイクロカプセル化したもののような、任意の慣習的な製剤タイプであることができる。本発明の化合物は、懸濁した形態、乳化した形態又は溶解した形態で存在することができる。特定の適切な製剤タイプの例は、溶液剤、水溶性濃厚剤(例えば、SL、LS)、分散性濃厚剤(DC)、懸濁液剤及び懸濁製剤(例えば、SC、OD、OF、FS)、乳剤(例えば、EC)、エマルジョン剤(例えば、EW、EO、ES、ME、SE)、カプセル剤(例えば、CS、ZC)、ペースト剤、パステル剤、水和剤又は粉剤(例えば、WP、SP、WS、DP、DS)、圧縮成形剤(pressing)(例えば、BR、TB、DT)、顆粒剤(例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫性製品(例えば、LN)、並びに、植物繁殖材料(例えば、種子)を処理するためのゲル製剤(例えば、GW、GF)である。これらの製剤タイプ及びさらなる製剤タイプは、国連食糧農業機関(FAO)によって定義されている。概要は、「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system”, Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, Croplife International」に示されている。

#### 【0104】

好ましくは、本発明の製剤は、以下のタイプのうちの1つの形態にある: EC、SC、FS、SE、OD、WG、WP、CS、さらに好ましくは、EC、SC、OD、WG、CS。

10

20

30

40

50

## 【0105】

製剤のタイプの例及びそれらの調製についての更なる詳細は、以下に示されている。本発明の2種以上の化合物が存在している場合、本発明の化合物の概略量は、本発明の化合物の総量を示している。このことは、当該製剤の任意のさらなる成分のうちの2種類以上の代表的なもの（例えば、湿潤剤、結合剤）が存在している場合、そのような成分にも準用される。

## 【0106】

(i) 水溶性濃厚剤 (SL, LS)

10 ~ 60 重量%の本発明の少なくとも1の化合物及び5 ~ 15 重量%の界面活性剤（例えば、アルコールを含んでいるエチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドの重縮合物）を、総量が100重量%となるような量の水及び/又は水溶性溶媒（例えば、プロピレングリコールなどのアルコール類、又は、炭酸プロピレンなどのカルボネート類）に溶解させる。施用前に、該濃厚物を水で希釈する。

10

## 【0107】

(ii) 分散性濃厚剤 (DC)

5 ~ 25 重量%の本発明の少なくとも1の化合物並びに1 ~ 10 重量%の界面活性剤及び/又は結合剤（例えば、ポリビニルピロリドン）を、総量が100重量%になるような量の有機溶媒（例えば、シクロヘキサノン）に溶解させる。水で希釈することで、分散液が得られる。

20

## 【0108】

(iii) 乳剤 (EC)

15 ~ 70 重量%の本発明の少なくとも1の化合物及び5 ~ 10 重量%の界面活性剤（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレートの混合物）を、総量が100重量%となるような量の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素又は脂肪酸アミド）と必要に応じて付加的な水溶性溶媒に溶解させる。水で希釈することで、エマルションが得られる。

## 【0109】

(iv) エマルション剤 (EW, EO, ES)

5 ~ 40 重量%の本発明の少なくとも1の化合物及び1 ~ 10 重量%の界面活性剤（例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシレートの混合物、又は、アルコールを含んでいる若しくは含んでいないエチレンオキシド及び/若しくはプロピレンオキシドの重縮合物）を20 ~ 40 重量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に溶解させる。この混合物を、乳化機を用いて、総量が100重量%となるような量の水に添加する。得られた製剤は、均質なエマルションである。施用の前に、該エマルションを水でさらに希釈することができる。

30

## 【0110】

(v) 懸濁液剤及び懸濁製剤(v-1) 水性 (SC, FS)

適切な粉碎装置（例えば、攪拌ボールミル）の中で、20 ~ 60 重量%の本発明の少なくとも1の化合物を、2 ~ 10 重量%の界面活性剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル）、0.1 ~ 2 重量%の増粘剤（例えば、キサンタンガム）及び水を加えて微粉碎して、微細活性物質懸濁液が得られる。水は、総量が100重量%となるような量で添加する。水で希釈することで、活性物質の安定な懸濁液が得られる。FSタイプの製剤では、40重量%までの結合剤（例えば、ポリビニルアルコール）を添加する。

40

## 【0111】

(v-2) 油性 (OD, OF)

適切な粉碎装置（例えば、攪拌ボールミル）の中で、20 ~ 60 重量%の本発明の少なくとも1の化合物を、2 ~ 10 重量%の界面活性剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル）、0.1 ~ 2 重量%の増粘剤（例え

50

ば、変性クレー、特に、Bentone、又は、シリカ）及び有機担体を加えて微粉碎して、微細活性物質油懸濁液が得られる。該有機担体は、総量が100重量%となるような量で添加する。水で希釈することで、活性物質の安定な分散液が得られる。

【0112】

(vi) 顆粒水和剤及び水溶性顆粒剤(WG、SG)

1~90重量%（好ましくは、20~80重量%、最も好ましくは、50~80重量%）の本発明の少なくとも1の化合物を、界面活性剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルキルナフチルスルホン酸ナトリウム）及び場合により担体物質を加えて微粉碎し、並びに、典型的な技術機器（例えば、押出造粒、噴霧乾燥造粒、流動床造粒）を用いて顆粒水和剤又は水溶性顆粒剤に変換させる。該界面活性剤及び担体物質は、総量が100重量%となるような量で使用される。水で希釈することで、活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

10

【0113】

(vii) 水和剤及び水溶性粉末剤(WP、SP、WS)

50~80重量%の本発明の少なくとも1の化合物を、ローター・ステータミルの中で、1~20重量%の界面活性剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム、アルキルナフチルスルホン酸ナトリウム）及び総量が100重量%となるような量の固体担体（例えば、シリカゲル）を加えて粉碎する。水で希釈することで、活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

20

【0114】

(viii) ゲル剤(GW、GF)

攪拌ボールミルの中で、5~25重量%の本発明の少なくとも1の化合物を、3~10重量%の界面活性剤（例えば、リグノスルホン酸ナトリウム）、1~5重量%の結合剤（例えば、カルボキシメチルセルロース）及び総量が100重量%となるような量の水を加えて微粉碎する。これにより、活性物質の微細な懸濁液が得られる。水で希釈することで、活性物質の安定な懸濁液が得られる。

【0115】

(ix) マイクロエマルジョン剤(ME)

5~20重量%の本発明の少なくとも1の化合物を、5~30重量%の有機溶媒ブレンド（例えば、脂肪酸ジメチルアミドとシクロヘキサノン）、10~25重量%の界面活性剤ブレンド（例えば、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテルとアリールフェノールエトキシレート）及び総量が100重量%となるような量の水に添加する。その混合物を1時間攪拌して、熱力学的に安定なマイクロエマルジョンを自然発生的に生成させる。

30

【0116】

(x) マイクロカプセル(CS)

5~50重量%の本発明の少なくとも1の化合物、0~40重量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）、2~15重量%のアクリルモノマー（例えば、メチルメタクリレート、メタクリル酸及びジ-又はトリアクリレート）を含んでいる油相を、保護コロイド（例えば、ポリビニールアルコール）の水性溶液の中に分散させる。ラジカル開始剤によって開始されるラジカル重合によって、ポリ(メタ)アクリレートマイクロカプセルが形成される。あるいは、5~50重量%の本発明の少なくとも1の化合物、0~40重量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）及びイソシアネートモノマー（例えば、ジフェニルメテン-4,4'-ジイソシアネート）を含んでいる油相を、保護コロイド（例えば、ポリビニールアルコール）の水性溶液の中に分散させ、これによって、ポリ尿素マイクロカプセルが形成される。場合により、ポリアミン（例えば、ヘキサメチレンジアミン）を添加しても、ポリウレアマイクロカプセルが形成される。該モノマーは、CS製剤の全重量の1~10%になる。

40

【0117】

(xi) 散粉性粉末剤(dustable powders)(DP、DS)

1~10重量%の本発明の少なくとも1の化合物を微粉碎し、総量が100重量%とな

50

るような量の固体担体（例えば、微粉化カオリン）と密接に混合させる。

【0118】

(xii) 粒剤 (GR、FG)

0.5 ~ 30 重量%の本発明の少なくとも1の化合物を微粉碎し、総量が100重量%となるような量の固体担体（例えば、シリケート）と結合させる。

【0119】

(xiii) 微量散布用液剤 (ultra-low volume liquids) (UL)

1 ~ 50 重量%の本発明の少なくとも1の化合物を、総量が100重量%となるような量の有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）に溶解させる。

10

【0120】

製剤タイプ(i) ~ (xiii)は、場合により、さらなる補助剤、例えば、0.1 ~ 1重量%の防腐剤、0.1 ~ 1重量%の消泡剤、0.1 ~ 1重量%の染料及び/又は顔料、並びに、5 ~ 10重量%の凍結防止剤などを含むことができる。

【0121】

混合物

式(I)で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の持続期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性(repulsion)を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤(microbiologicals)、有益種、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤(phytonic)、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物として使用することもできる。さらに、そのような活性化化合物組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び/又は、非生物的要因（例えば、高温又は低温）に対する耐性、渇水に対する耐性又は含水量若しくは土壌塩分濃度の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能及び結果性能を改善することも可能であり、発芽能力及び根の発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫量を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫された生産物の品質及び/若しくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命を長くすることも可能であり、並びに/又は、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

20

30

さらに、式(I)で表される化合物は、別の活性化化合物又は情報化学物質（例えば、誘引剤、及び/又は、鳥忌避剤、及び/又は、植物活性化剤、及び/又は、成長調節剤、及び/又は、肥料）との混合物の中に存在させることもできる。同様に、式(I)で表される化合物は、植物の特性（例えば、生長、収穫量及び収穫物の品質）を向上させるために使用することも可能である。

本発明による特定の実施形態では、式(I)で表される化合物は、製剤の中に、又は、そのような製剤から調製された使用形態の中に、さらなる化合物（好ましくは、以下に記載されている化合物）と混合された状態で存在している。

【0122】

以下に記載されている化合物のうちの1種類が種々の互変異性体形態で存在し得る場合、それらの形態も、いずれの場合にも、たとえ明確に言及されていなくても、同様に包含される。さらに、名前が挙げられている全ての混合相手剤は、それらの官能基によって可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

40

【0123】

殺虫剤/殺ダニ剤/殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって識別されている活性化化合物は、既知であり、そして、例えば、農薬ハンドブック(pesticide handbook) ("The Pesticide Manual" 16th Ed., British Crop Protection Council 2012)に記載されているか、又は、インタ

50



ーネット上で見いだすことができる（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。その分類は、本特許出願の出願時点において最新の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいている。

【0124】

(1) アセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害薬、好ましくは、

カルバメート系、これは、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、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、エチオフエンカルブ、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、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC 及びキシリルカルブから選択される；又は、

10

有機リン酸エステル系、これは、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、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス - メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン - S - メチル、ダイアジノン、ジクロルボス / D D V P、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファミフル、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、O - (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル、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 - メチル、パラチオン - メチル、フェントエート、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、プロペタムホス、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、テブピリムホス、テムホス、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、トリクロルホン及びバミドチオンから選択される。

20

【0125】

(2) GABA 制御塩化物チャンネル遮断薬、好ましくは、

シクロジエン - 有機塩素系、これは、クロルダン及びエンドスルファンから選択される；又は、

30

フェニルピラゾール系 (フィプロール系)、これは、エチプロール及びフィプロニルから選択される。

【0126】

(3) ナトリウムチャンネルモジュレーター、好ましくは、

ピレスロイド系、これは、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン s - シクロペンテニル異性体、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 [ (1R) - トランス - 異性体 ]、デルタメトリン、エムペントリン [ (EZ) - (1R) - 異性体 ]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、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 - フルパリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン [ (1R) - トランス - 異性体 ]、プラレトリン、プレトリン類 (除虫菊 (pyrethrum))、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [ (1R) - 異性体 ]、トラロメトリン及びトランスフルトリンから選択される；又は、

40

DDT；又は、メトキシクロル。

【0127】

(4) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) 競合的モジュレーター、好ま

50

しくは、

ネオニコチノイド系、これは、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、チアクロプリド及びチアメトキサムから選択される；又は、

ニコチン；又は、

スルホキシミン系、これは、スルホキサフロルから選択される；又は、

ブテノリド系、これは、フルピラジフロンから選択される；又は、

メソイオン系、これは、トリフルメゾピリムから選択される。

【0128】

(5) ニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アロステリックモジュレーター (部位I)、好ましくは、  
スピノシン系、これは、スピネトラム及びスピノサドから選択される。

【0129】

(6) グルタミン酸制御塩化物チャンネル (GluCl) アロステリックモジュレーター、好ましくは、  
アベルメクチン系/ミルベマイシン系、これは、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン及びミルベメクチンから選択される。

【0130】

(7) 幼若ホルモン模倣物質、好ましくは、  
幼若ホルモン類似体、これは、ハイドロプレン、キノプレン及びメトプレンから選択される；又は、  
フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

【0131】

(8) 種々の特定されていない (多部位) 阻害薬、好ましくは、  
ハロゲン化アルキル系、これは、臭化メチル及び別のハロゲン化アルキルから選択される；又は、  
クロロピクリン；又は、フッ化スルフルル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石；又は、  
イソシアン酸メチル生成物質、これは、ダゾメット (diazomet) 及びメタムから選択される。

【0132】

(9) 弦音器官TRPVチャンネルモジュレーター、好ましくは、  
ピリジンアゾメタン系、これは、ピメトロジン及びピリフルキナゾンから選択される；  
又は、  
ピロペン系、これは、アフィドピロペンから選択される。

【0133】

(10) CHS1に作用するダニ成長阻害薬、これは、クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、ジフロピダジン及びエトキサゾールから選択される。

【0134】

(11) 昆虫腸膜の微生物ディスラプター、これは、バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subsp. israelensis*)、バシルス・スファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*) 及びBt植物タンパク質 (これは、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb及びCry34Ab1/35Ab1から選択される) から選択される。

- 【0135】  
 (12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、好ましくは、ATPディスラプター、これは、ジアフェンチウロンから選択される；又は、有機スズ化合物、これは、アゾシクロチン、シヘキサチン及び酸化フェンブタスズから選択される；又は、プロバルギット；又は、テトラジホン。
- 【0136】  
 (13) プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤、これは、クロルフェナピル、DNOC及びスルフルアミドから選択される。
- 【0137】  
 (14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、これは、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム (thiocyclam) 及びチオスルタップ-ナトリウムから選択される。
- 【0138】  
 (15) CHS1に作用するキチン生合成の阻害薬、好ましくは、ベンゾイル尿素系、これは、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、テフルベンズロン及びトリフルムロンから選択される。
- 【0139】  
 (16) キチン生合成の阻害薬 (タイプ1)、これは、プロロフェジンから選択される。
- 【0140】  
 (17) 脱皮ディスラプター (特に、双翅目 (Diptera) に対して、即ち、双翅類 (dipterans) に対して)、これは、シロマジンから選択される。
- 【0141】  
 (18) エクジソン受容体作動薬、好ましくは、ジアシルヒドラジン系、これは、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド及びテブフェノジドから選択される。
- 【0142】  
 (19) オクトパミン受容体作動薬、これは、アミトラズから選択される。
- 【0143】  
 (20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、これは、ヒドラメチルノン、アセキノシル、フルアクリピリム及びピフェナゼートから選択される。
- 【0144】  
 (21) ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬、好ましくは、METI殺ダニ剤及び殺虫剤、これは、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、テブフェンピラド及びトルフェンピラドから選択される；又は、ロテノン (Derris)。
- 【0145】  
 (22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、好ましくは、オキサジアジン系、これは、インドキサカルブから選択される；又は、セミカルバゾン系、これは、メタフルミゾンから選択される。
- 【0146】  
 (23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、好ましくは、テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、これは、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロピジオン及びスピロテトラマトから選択される。
- 【0147】  
 (24) ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害薬、好ましくは、ホスフィド系、これは、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン及びリン化亜鉛から選択される；又は、

10

20

30

40

50

シアン化物、これは、シアン化カルシウム、シアン化カリウム及びシアン化ナトリウムから選択される。

## 【0148】

(25) ミトコンドリア複合体 I I 電子伝達阻害薬、好ましくは、  
- ケトニトリル誘導体、これは、シエノピラフェン及びシフルメトフェンから選択される；又は、  
カルボキシアニリド系、これは、ピフルブミドから選択される。

## 【0149】

(28) リアノジン受容体モジュレーター、好ましくは、  
ジアミド系、これは、クロラントラニリプロール、シアントラニルプロール、シクラニ  
10  
リプロール、フルベンジアミド及びテトラリニプロールから選択される。

## 【0150】

(29) 弦音器官モジュレーター（標的部位が定義されていない）、これは、フロニ  
カミドから選択される。

## 【0151】

(30) G A B A 制御塩化物チャンネルアロステリックモジュレーター、好ましくは、  
メタジアミド系、これは、プロフラニリドから選択される；又は、  
イソオキサゾール系、これは、フルキサメタミドから選択される。

## 【0152】

(31) バキュロウイルス、好ましくは、  
20  
顆粒病ウイルス (G V s)、これは、コドリング (*Cydia pomonella*)  
G V 及びコドリングモドキ (*Thaumatotibia leucotreta*) (G  
V) から選択される；又は、  
核多角体病ウイルス (N P V s)、これは、ピロードマメケムシ (*Anticarsia  
a gemmatalis*) MNPV、フルシピリプロール (*Flucypriprole*)  
及びオオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) NPV から選択  
される。

## 【0153】

(32) ニコチン性アセチルコリン受容体アロステリックモジュレーター（部位 I I  
30  
）、これは、G S - オメガ / カッパ H X T X - H v 1 a ペプチドから選択される。

## 【0154】

(33) 以下のものから選択されるさらなる活性化合物： アシノナピル、アフォキ  
ソレイナー、アザジラクチン、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ベンズピリモキサン  
、プロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレトリン (*chloropral  
lethrin*)、氷晶石 (*cryolite*)、シクロブトリフルラム (*Cyclob  
utrifluram*)、シクロキサプリド、シエトピラフェン (*Cyetpyrafen*)、  
シハロジアミド (*cyhalodiamide*)、シプロフラニリド (*Cypro  
flaniilide*) (CAS 2375110-88-4)、ジクロロメゾチアズ、ジ  
40  
コホル、ジムプロピリダズ (*dimpopyridaz*)、  
- メトフルトリン、  
-  
モムフルトリン (*epsilon-momfluthrin*)、フロメトキン、フルアザ  
インドリジン、フルシピリプロール (*Flucypriprole*) (CAS 177  
1741-86-6)、フルエンシルホン、フルフェネリム、フルフェノキシストロピン  
、フルフィプロール、フルヘキサホン、フルオピラム、フルピリミン、フルララネル、フ  
フェノジド、フルベンチオフェノックス (*Flupentiofenox*)、グアジピル  
、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、イソシクロセラム、  
- ビフェン  
50  
トリン、  
- テフルトリン、ロチラネル、メベルフルトリン、ニコフルプロール (*Nic  
ofluprole*) (CAS 1771741-86-6)、オキサゾスルフィル、パ  
イコングディング (*paichongding*)、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリ  
ミノストロピン、サララネル、スピドキサマト (*Spidoxamat*)、スピロブジク  
ロフェン (*spirobudiclofen*)、テトラメチルフルトリン、テトラクロラ

ントラニリブロール、チゴラネル ( t i g o l a n e r )、チオキサザフェン、チオフル  
 オキシメート ( t h i o f l u o x i m a t e )、チクロピラゾフロル ( T y c l o p y  
 r a z o f l o r )、ヨードメタン； さらに、バシルス・フィルムス ( B a c i l l u  
 s f i r m u s ) に基づく調製物 ( I - 1 5 8 2 , V o t i v o ) 及びアザジラクチ  
 ン ( B i o N e e m )、並びに、さらに、以下の化合物： 1 - { 2 - フルオロ - 4 - メ  
 チル - 5 - [ ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) スルフィニル ] フェニル } - 3 - ( ト  
 リフルオロメチル ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン ( W O 2 0 0 6 / 0  
 4 3 6 3 5 から既知 ) ( C A S 8 8 5 0 2 6 - 5 0 - 6 )、2 - クロロ - N - [ 2 - {  
 1 - [ ( 2 E ) - 3 - ( 4 - クロロフェニル ) プロパ - 2 - エン - 1 - イル ] ピペリジン  
 - 4 - イル } - 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] イソニコチンアミド ( W O 2 0 0  
 6 / 0 0 3 4 9 4 から既知 ) ( C A S 8 7 2 9 9 9 - 6 6 - 1 )、3 - ( 4 - クロロ -  
 2 , 6 - ジメチルフェニル ) - 4 - ヒドロキシ - 8 - メトキシ - 1 , 8 - ジアザスピロ [  
 4 . 5 ] デカ - 3 - エン - 2 - オン ( W O 2 0 1 0 0 5 2 1 6 1 から既知 ) ( C A S 1  
 2 2 5 2 9 2 - 1 7 - 0 )、3 - ( 4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル ) - 8 - メト  
 キシ - 2 - オキソ - 1 , 8 - ジアザスピロ [ 4 . 5 ] デカ - 3 - エン - 4 - イル エチル  
 カルボネート ( E P 2 6 4 7 6 2 6 から既知 ) ( C A S 1 4 4 0 5 1 6 - 4 2 - 6 )、  
 P F 1 3 6 4 ( J P 2 0 1 0 / 0 1 8 5 8 6 から既知 ) ( C A S 1 2 0 4 7 7 6 - 6 0  
 - 2 )、( 3 E ) - 3 - [ 1 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジル ) メチル ] - 2 - ピリジリ  
 デン ] - 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - プロパン - 2 - オン ( W O 2 0 1 3 / 1 4 4 2 1 3  
 から既知 ) ( C A S 1 4 6 1 7 4 3 - 1 5 - 6 )、N - [ 3 - ( ベンジルカルバモイル  
 ) - 4 - クロロフェニル ] - 1 - メチル - 3 - ( ペンタフルオロエチル ) - 4 - ( トリフ  
 ルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド ( W O 2 0 1 0 / 0 5 1 9 2 6  
 から既知 ) ( C A S 1 2 2 6 8 8 9 - 1 4 - 0 )、5 - プロモ - 4 - クロロ - N - [ 4  
 - クロロ - 2 - メチル - 6 - ( メチルカルバモイル ) フェニル ] - 2 - ( 3 - クロロ - 2  
 - ピリジル ) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ( C N 1 0 3 2 3 2 4 3 1 から既知 ) ( C  
 A S 1 4 4 9 2 2 0 - 4 4 - 3 )、4 - [ 5 - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 4 , 5  
 - ジヒドロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - イソオキサゾリル ] - 2 - メチル - N -  
 ( シス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル ) ベンズアミド、4 - [ 5 - ( 3 , 5 - ジクロロ  
 フェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - イソオキサゾリル ]  
 - 2 - メチル - N - ( トランス - 1 - オキシド - 3 - チェタニル ) ベンズアミド及び 4 -  
 [ ( 5 S ) - 5 - ( 3 , 5 - ジクロロフェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 5 - ( トリフルオ  
 ロメチル ) - 3 - イソオキサゾリル ] - 2 - メチル - N - ( シス - 1 - オキシド - 3 - チ  
 エタニル ) ベンズアミド ( W O 2 0 1 3 / 0 5 0 3 1 7 A 1 から既知 ) ( C A S 1 3 3  
 2 6 2 8 - 8 3 - 7 )、N - [ 3 - クロロ - 1 - ( 3 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾール  
 - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ ( 3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル ) スルフィニル  
 ] プロパンアミド、( + ) - N - [ 3 - クロロ - 1 - ( 3 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾ  
 ール - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ ( 3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル ) スルフィ  
 ニル ] プロパンアミド及び ( - ) - N - [ 3 - クロロ - 1 - ( 3 - ピリジニル ) - 1 H -  
 ピラゾール - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ ( 3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル ) ス  
 ルフィニル ] プロパンアミド ( W O 2 0 1 3 / 1 6 2 7 1 5 A 2、W O 2 0 1 3 / 1 6 2  
 7 1 6 A 2、U S 2 0 1 4 / 0 2 1 3 4 4 8 A 1 から既知 ) ( C A S 1 4 7 7 9 2 3 -  
 3 7 - 7 )、5 - [ [ ( 2 E ) - 3 - クロロ - 2 - プロペン - 1 - イル ] アミノ ] - 1 -  
 [ 2 , 6 - ジクロロ - 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 4 - [ ( トリフルオロメ  
 チル ) スルフィニル ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル ( C N 1 0 1 3 3 7 9 3  
 7 A から既知 ) ( C A S 1 1 0 5 6 7 2 - 7 7 - 2 )、3 - プロモ - N - [ 4 - クロロ  
 - 2 - メチル - 6 - [ ( メチルアミノ ) チオキソメチル ] フェニル ] - 1 - ( 3 - クロロ  
 - 2 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド、( L i u d a i b e n j  
 i a x u a n a n、C N 1 0 3 1 0 9 8 1 6 A から既知 ) ( C A S 1 2 3 2 5 4 3 - 8  
 5 - 9 )； N - [ 4 - クロロ - 2 - [ [ ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) アミノ ] カルボニル  
 ] - 6 - メチルフェニル ] - 1 - ( 3 - クロロ - 2 - ピリジニル ) - 3 - ( フルオロメト  
 10  
 20  
 30  
 40  
 50

キシ) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2012 / 034403 A1 から既知) (CAS 1268277 - 22 - 0)、N - [2 - (5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル] - 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (WO 2011 / 085575 A1 から既知) (CAS 1233882 - 22 - 8)、4 - [3 - [2, 6 - ジクロロ - 4 - [(3, 3 - ジクロロ - 2 - プロペン - 1 - イル) オキシ]フェノキシ]プロポキシ] - 2 - メトキシ - 6 - (トリフルオロメチル)ピリミジン (CN 101337940 A から既知) (CAS 1108184 - 52 - 6); (2E) - 及び2 (Z) - 2 - [2 - (4 - シアノフェニル) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン] - N - [4 - (ジフルオロメトキシ)フェニル]ヒドラジンカルボキサミド (CN 101715774 A から既知) (CAS 1232543 - 85 - 9); 3 - (2, 2 - ジクロロエテニル) - 2, 2 - ジメチル - 4 - (1H - ベンゾイミダゾール - 2 - イル)フェニル - シクロプロパンカルボン酸エステル (CN 103524422 A から既知) (CAS 1542271 - 46 - 4); (4aS) - 7 - クロロ - 2, 5 - ジヒドロ - 2 - [[メトキシカルボニル][4 - [(トリフルオロメチル)チオ]フェニル]アミノ]カルボニル]インデノ[1, 2 - e][1, 3, 4]オキサジアジン - 4 a (3H) - カルボン酸メチルエステル (CN 102391261 A から既知) (CAS 1370358 - 69 - 2); 6 - デオキシ - 3 - O - エチル - 2, 4 - ジ - O - メチル - , 1 - [N - [4 - [1 - [4 - (1, 1, 2, 2, 2 - ペンタフルオロエトキシ)フェニル] - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - イル]フェニル]カルバメート] - L - マンノピラノース (US 2014 / 0275503 A1 から既知) (CAS 1181213 - 14 - 8); 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ[3.2.1]オクタン (CAS 1253850 - 56 - 4)、(8 - アンチ) - 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ[3.2.1]オクタン (CAS 933798 - 27 - 7)、(8 - シン) - 8 - (2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 3 - (6 - トリフルオロメチル - ピリダジン - 3 - イル) - 3 - アザ - ビシクロ[3.2.1]オクタン (WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1 から既知) (CAS 934001 - 66 - 8)、N - [4 - (アミノチオソメチル) - 2 - メチル - 6 - [(メチルアミノ)カルボニル]フェニル] - 3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (CN 103265527 A から既知) (CAS 1452877 - 50 - 7)、3 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 1 - メチル - 1, 8 - ジアザスピロ[4.5]デカン - 2, 4 - ジオン (WO 2014 / 187846 A1 から既知) (CAS 1638765 - 58 - 8)、3 - (4 - クロロ - 2, 6 - ジメチルフェニル) - 8 - メトキシ - 1 - メチル - 2 - オキソ - 1, 8 - ジアザスピロ[4.5]デカ - 3 - エン - 4 - イル - カルボン酸エチルエステル (WO 2010 / 066780 A1、WO 2011151146 A1 から既知) (CAS 1229023 - 00 - 0)、N - [1 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド (WO 2014 / 053450 A1 から既知) (CAS 1594624 - 87 - 9)、N - [2 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 2H - 1, 2, 3 - トリアゾール - 4 - イル] - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド (WO 2014 / 053450 A1 から既知) (CAS 1594637 - 65 - 6)、N - [1 - (3, 5 - ジフルオロ - 2 - ピリジニル) - 1H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - (トリフルオロメチル)ベンズアミド (WO 2014 / 053450 A1 から既知) (CAS 1594626 - 19 - 3)、(3R) - 3 - (2 - クロロ - 5 - チアゾリル) - 2, 3 - ジヒドロ - 8 - メチル - 5, 7 - ジオキソ - 6 - フェニル - 5H - チアゾロ[3, 2 - a]ピリミジニウム内部塩 (WO 2018 / 177970 A1 から既知) (CAS 2246757 - 58 - 2); 3 - (2 - クロロ - 5 - チアゾリ

10

20

30

40

50

ル) - 2, 3 - ジヒドロ - 8 - メチル - 5, 7 - ジオキソ - 6 - フェニル - 5 H - チアゾロ [ 3, 2 - a ] ピリミジニウム内部塩 ( W O 2 0 1 8 / 1 7 7 9 7 0 A 1 から既知 ) ( C A S 2 2 4 6 7 5 7 - 5 6 - 0 ) ; N - [ 3 - クロロ - 1 - ( 3 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ] - 2 - ( メチルスルホニル ) - プロパンアミド ( W O 2 0 1 9 / 2 3 6 2 7 4 A 1 から既知 ) ( C A S 2 3 9 6 7 4 7 - 8 3 - 2 ) 、 N - [ 2 - ブロモ - 4 - [ 1, 2, 2, 2 - テトラフルオロ - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 2 - フルオロ - 3 - [ ( 4 - フルオロベンゾイル ) アミノ ] - ベンズアミド ( W O 2 0 1 9 0 5 9 4 1 2 A 1 から既知 ) ( C A S 1 2 0 7 9 7 7 - 8 7 - 4 ) 、 3 - ブロモ - 1 - ( 3 - クロロ - 2 - ピリジニル ) - N - [ 4, 6 - ジクロロ - 3 - フルオロ - 2 - [ ( メチルアミノ ) カルボニル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド ( フルクロロジアミド ( F l u c h l o r o d i a m i d e ) ; C N 1 1 0 8 3 5 3 3 0 A 、 C N 1 0 6 9 7 7 4 9 4 A から既知 ) ( C A S : 2 1 2 9 1 4 7 - 0 3 - 9 ) 。

10

20

30

40

50

#### 【 0 1 5 5 】

#### 殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって識別されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、農薬ハンドブック ( pesticide handbook ) ( “ The Pesticide Manual ” 16th Ed., British Crop Protection Council 2012 ) に記載されているか、又は、インターネット上で見いだすことができる ( 例えば、 “ <http://www.alanwood.net/pesticides> ” ) 。その分類は、本特許出願の出願時点において最新の「Nematicide IRAC Mode of Action Classification Groups」に基づいている。

#### 【 0 1 5 6 】

( グループ N - 1 ) アセチルコリンエステラーゼ ( A C h E ) 阻害薬、好ましくは、  
( N - 1 A ) カルバメート系、これは、アルジカルブ、ベンフラカルブ、カルボフラン、カルボスルファン及びチオジカルブから選択される；又は、  
( N - 1 B ) 有機リン酸エステル系、これは、カズサホス、エトプロホス、フェナミホス、ホスチアゼート、イミシアホス、ホレート及びテルブホスから選択される。

#### 【 0 1 5 7 】

( グループ N - 2 ) グルタミン酸制御塩化物チャンネル ( G l u C l ) アロステリックモジュレーター、好ましくは、  
アベルメクチン系、これは、アバメクチン及びエマメクチン安息香酸塩から選択される。

#### 【 0 1 5 8 】

( グループ N - 3 ) ミトコンドリア複合体 I I 電子伝達阻害薬、特に、コハク酸 - 補酵素 Q 還元酵素の阻害薬、好ましくは、  
ピリジニルメチル - ベンズアミド系、これは、フルオピラムから選択される。

#### 【 0 1 5 9 】

( グループ N - 4 ) 脂質合成 / 成長調節モジュレーター、特に、アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害薬、好ましくは、  
テロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、これは、スピロテトラマトから選択される。

#### 【 0 1 6 0 】

( グループ N - U N ) さまざまな化学反応を伴う未知の又は特定されていない作用機序を有する化合物、これは、フルエンシルホン、フルアザインドリジン、フルフラール、イプロジオン及びチオキサザフェンから選択される。

#### 【 0 1 6 1 】

( グループ N - U N X ) 未知の又は特定されていない作用機序を有する化合物：推定される多部位阻害薬、好ましくは、

揮発性硫黄生成剤、これは、二硫化炭素及び二硫化ジメチル（D M D S）から選択される；又は、

二硫化炭素遊離促進物質、これは、テトラチオ炭酸ナトリウムから選択される；又は、ハロゲン化アルキル、これは、臭化メチル及びヨウ化メチル（ヨードメタン）から選択される；又は、

ハロゲン化炭化水素、これは、1, 2 - ジブromo - 3 - クロロプロパン（D B C P）及び1, 3 - ジクロロプロペンから選択される；又は、

クロロピクリン；又は、

イソチオシアン酸メチル生成剤、これは、イソチオシアン酸アリル、ダゾメット（d i a z o m e t）、メタムカリウム及びメタムナトリウムから選択される。

10

#### 【0162】

（グループN - U N B） 未知の又は特定されていない作用機序を有する細菌剤（b a c t e r i a l a g e n t s）（n o n - B t）、好ましくは、

細菌又は細菌に由来するもの、これは、以下のものから選択される：ブルクホルデリア属種（*Burkholderia* spp.）、例えば、ブルクホルデリア・リノジェンシス（*Burkholderia* r i n o j e n s i s）A 3 9 6、バシルス属種（*Bacillus* spp.）、例えば、バシルス・フィルムス（*Bacillus* f i r m u s）、バシルス・リケニホルミス（*Bacillus* l i c h e n i f o r m i s）、バシルス・アミロリクエファシエンス（*Bacillus* a m y l o l i q u e f a c i e n s）又はバシルス・サブチリス（*Bacillus* s u b t i l i s）、パステウリア属種（*Pasteuria* spp.）、例えば、パステウリア・ペネトランス（*Pasteuria* p e n e t r a n s）又はパステウリア・ニシザワエ（*Pasteuria* n i s h i z a w a e）、*Pseudomonas* spp.）、例えば、*Pseudomonas*・クロロラフィス（*Pseudomonas* c h l o r o r a p h i s）又は*Pseudomonas*・フルオレセンス（*Pseudomonas* f l u o r e s c e n s）、及び、*Streptomyces* spp.）、例えば、*Streptomyces*・リジクス（*Streptomyces* l y d i c u s）、*Streptomyces*・ジクロウィイ（*Streptomyces* d i c k l o w i i）又は*Streptomyces*・アルボグリセオルス（*Streptomyces* a l b o g r i s e o l u s）。

20

30

#### 【0163】

（グループN - U N F） 未知の又は特定されていない作用機序を有する真菌剤（f u n g a l a g e n t s）、好ましくは、

真菌又は真菌に由来するもの、これは、以下のものから選択される：アクチノミセス属種（*Actinomyces* spp.）、例えば、アクチノミセス・ストレプトコックス（*Actinomyces* s t r e p t o c o c c u s）、アルトロボトリス属種（*Arthrobotryx* spp.）、例えば、アルトロボトリス・オリゴスポラ（*Arthrobotryx* o l i g o s p o r a）、アスペルギルス属種（*Aspergillus* spp.）、例えば、アスペルギルス・ニゲル（*Aspergillus* n i g e r）、ムスコドル属種（*Muscodora* spp.）、例えば、ムスコドル・アルプス（*Muscodora* a l b u s）、ミロテシウム属種（*Myrothecium* spp.）、例えば、ミロテシウム・ベルカリヤ（*Myrothecium* v e r r u c a r i a）、*Paecilomyces* spp.）、例えば、*Paecilomyces*・リラシヌス（*Paecilomyces* l i l a c i n u s）（*Purpureocillium* l i l a c i n u m）、*Paecilomyces*・カルネウス（*Paecilomyces* c a r n e u s）又は*Paecilomyces*・フモソロセウス（*Paecilomyces* f u m o s o r o s e u s）、*Pochonia* spp.）、例えば、*Pochonia*・クラミドスポリア（*Pochonia* c h l a m y d o s p o r i a）、及び、*Trichoderma* spp.）、例えば、*Trichoderma*・ハルジアヌム（*Trichoderma* h a r z i a n u m）、

40

50



トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*)、トリコデルマ・アトロピリダエ (*Trichoderma atroviride*) 又はトリコデルマ・ピリダエ (*Trichoderma viride*)。

【0164】

(グループ N - UNE) 植物又は動物に由来する未知の又は特定されていない作用機序を有する作用物質 (これは、合成抽出物及び未精製油を包含する)、好ましくは、

以下のものから選択される、植物又は動物に由来する作用物質：アザジラクチン、ツバキ油かす、精油、ニンニク抽出物、ポンガミア油、テルペン類 (例えば、カルバクロール)、及び、キヤラ・サポナリア (*Quillaja saponaria*) 抽出物。

【0165】

殺菌剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「The Pesticide Manual (16th Ed. British Crop Protection Council)」に記載されているか、又は、インターネットで検索することができる (例えば、[www.alanwood.net/pesticides](http://www.alanwood.net/pesticides))。

クラス (1) ~ (15) の名前が挙げられている全ての殺菌性混合相手剤は、それらの官能基によって可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。クラス (1) ~ (15) の名前が挙げられている全ての混合相手剤は、適切な場合には、互変異性体形態を包含し得る。

【0166】

(1) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、(1.001) シプロコナゾール、(1.002) ジフェノコナゾール、(1.003) エポキシコナゾール、(1.004) フェンブコナゾール、(1.005) フェンヘキサミド、(1.006) フェンプロピジン、(1.007) フェンプロピモルフ、(1.008) フェンピラザミン、(1.009) フルキンコナゾール、(1.010) フルトリアホル、(1.011) ヘキサコナゾール、(1.012) イマザリル、(1.013) 硫酸イマザリル、(1.014) イブコナゾール、(1.015) イブフェントリフルコナゾール、(1.016) メフェントリフルコナゾール、(1.017) メトコナゾール、(1.018) ミクロブタニル、(1.019) パクロブトラゾール、(1.020) ペンコナゾール、(1.021) プロクロラズ、(1.022) プロピコナゾール、(1.023) プロチオコナゾール、(1.024) ピリソキサゾール、(1.025) スピロキサミン、(1.026) テブコナゾール、(1.027) テトラコナゾール、(1.028) トリアジメノール、(1.029) トリデモルフ、(1.030) トリチコナゾール、(1.031) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.032) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.033) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.034) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.035) (2R) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.036) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.037) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.038) (2S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル)]

10

20

30

40

50

フェニル] - 1 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、 ( 1 . 0 3 9 ) ( R ) - [ 3 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル ) - 5 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル ] ( ピリジン - 3 - イル ) メタノール、 ( 1 . 0 4 0 ) ( S ) - [ 3 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル ) - 5 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル ] ( ピリジン - 3 - イル ) メタノール、 ( 1 . 0 4 1 ) [ 3 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル ) - 5 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 2 - オキサゾール - 4 - イル ] ( ピリジン - 3 - イル ) メタノール、 ( 1 . 0 4 2 ) 1 - ( { ( 2 R , 4 S ) - 2 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) フェニル ] - 4 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル } メチル ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 ( 1 . 0 4 3 ) 1 - ( { ( 2 S , 4 S ) - 2 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) フェニル ] - 4 - メチル - 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル } メチル ) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 ( 1 . 0 4 4 ) 1 - { [ 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 ( 1 . 0 4 5 ) 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 R ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 ( 1 . 0 4 6 ) 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 S ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、 ( 1 . 0 4 7 ) 2 - [ ( 2 R , 4 R , 5 R ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチル - ヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 4 8 ) 2 - [ ( 2 R , 4 R , 5 S ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 4 9 ) 2 - [ ( 2 R , 4 S , 5 R ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 0 ) 2 - [ ( 2 R , 4 S , 5 S ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 1 ) 2 - [ ( 2 S , 4 R , 5 R ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチル - ヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 2 ) 2 - [ ( 2 S , 4 R , 5 S ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 3 ) 2 - [ ( 2 S , 4 S , 5 R ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 4 ) 2 - [ ( 2 S , 4 S , 5 S ) - 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 5 ) 2 - [ 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2 , 6 , 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル ] - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 6 ) 2 - [ 6 - ( 4 - プロモフェノキシ ) - 2 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] - 1 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、 ( 1 . 0 5 7 ) 2 - [ 6 - ( 4 - クロロフェノキシ ) - 2 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] - 1 - ( 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、 ( 1 . 0 5 8 ) 2 - { [ 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 5 9 ) 2 - { [ r e l ( 2 R , 3 R ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン、 ( 1 . 0 6 0 ) 2 - { [ r e l ( 2 R , 3 S

) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) - オキシラン -  
 2 - イル ] メチル } - 2 , 4 - ジヒドロ - 3 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - チオン  
 、 ( 1 . 0 6 1 ) 3 - [ 2 - ( 1 - クロロシクロプロピル ) - 3 - ( 3 - クロロ - 2 - フ  
 ルオロ - フェニル ) - 2 - ヒドロキシ - プロピル ] イミダゾール - 4 - カルボニトリル、  
 ( 1 . 0 6 2 ) 4 - [ [ 6 - [ r a c - ( 2 R ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル )  
 - 1 , 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - ( 5 - チオキソ - 4 H - 1 , 2 , 4 - トリ  
 アゾール - 1 - イル ) プロピル ] - 3 - ピリジル ] オキシ ] - ベンゾニトリル、 ( 1 . 0  
 6 3 ) 5 - ( 4 - クロロベンジル ) - 2 - ( クロロメチル ) - 2 - メチル - 1 - ( 1 H -  
 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル ) シクロ - ペンタノール、 ( 1 . 0 6 4 ) 5  
 - ( アリルスルファニル ) - 1 - { [ 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフ  
 ルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、  
 ( 1 . 0 6 5 ) 5 - ( アリルスルファニル ) - 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 R ) - 3 - ( 2  
 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチ  
 ル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 ( 1 . 0 6 6 ) 5 - ( アリルスルファニル ) -  
 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 S ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジフルオ  
 ロ - フェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール、 ( 1 . 0 6 7 )  
 メチル 2 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) フェニル ] - 2  
 - ヒドロキシ - 3 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパノエート、 ( 1 . 0 6 8 )  
 N ' - ( 2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - フェノキシフェニル ) - N - エチル  
 - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 6 9 ) N ' - [ 2 - クロロ - 4 - ( 2 - フル  
 オロフェノキシ ) - 5 - メチルフェニル ] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド  
 、 ( 1 . 0 7 0 ) N ' - [ 5 - ブロモ - 6 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 -  
 イルオキシ ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル ] - N - エチル - N - メチルイミドホルム  
 アミド、 ( 1 . 0 7 1 ) N ' - { 4 - [ ( 4 , 5 - ジクロロ - 1 , 3 - チアゾール - 2 -  
 イル ) オキシ ] - 2 , 5 - ジメチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムア  
 ミド、 ( 1 . 0 7 2 ) N ' - { 5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - [ ( 1 - プロポキシプロパ  
 ン - 2 - イル ) オキシ ] ピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムア  
 ミド、 ( 1 . 0 7 3 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( 1 R ) - 1 - ( 3 , 5 - ジフルオロ  
 フェニル ) エトキシ ] - 2 - メチル - ピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイ  
 ミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 4 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( 1 S ) - 1 - ( 3 , 5  
 - ジフルオロフェニル ) - エトキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル -  
 N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 5 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( シス - 4  
 - イソプロピルシクロヘキシル ) オキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチ  
 ル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 6 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( トラン  
 ス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル ) オキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N  
 - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 7 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ 1 - ( 3 , 5 -  
 ジフルオロフェニル ) エトキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N  
 - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 8 ) N - イソプロピル - N ' - [ 5 -  
 メトキシ - 2 - メチル - 4 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - フ  
 エニルエチル ) フェニル ] - N - メチルイミドホルムアミド。

10

20

30

40

【 0 1 6 7 】

( 2 ) 複合体 I 又は複合体 I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、 ( 2 . 0 0 1 ) ベ  
 ンゾピンジフルピル、 ( 2 . 0 0 2 ) ピキサフェン、 ( 2 . 0 0 3 ) ポスカリド、 ( 2 .  
 0 0 4 ) カルボキシシン、 ( 2 . 0 0 5 ) シクロブトリフルラム、 ( 2 . 0 0 6 ) フルベネ  
 テラム、 ( 2 . 0 0 7 ) フルインダピル、 ( 2 . 0 0 8 ) フルオピラム、 ( 2 . 0 0 9 )  
 フルトラニル、 ( 2 . 0 1 0 ) フルキサピロキサド、 ( 2 . 0 1 1 ) フラメトピル、 ( 2 .  
 0 1 2 ) インピルフルキサム、 ( 2 . 0 1 3 ) イソフェタミド、 ( 2 . 0 1 4 ) イソフ  
 ルシプラム、 ( 2 . 0 1 5 ) イソピラザム、 ( 2 . 0 1 6 ) ベンフルフェン、 ( 2 . 0 1  
 7 ) ペンチオピラド、 ( 2 . 0 1 8 ) ピジフルメトフェン、 ( 2 . 0 1 9 ) ピラプロポイ  
 ン、 ( 2 . 0 2 0 ) ピラジフルミド、 ( 2 . 0 2 1 ) セダキサソ、 ( 2 . 0 2 2 ) 1 , 3

50

- ジメチル - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 3 ) 1 , 3 - ジメチル - N - [ ( 3 R ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 4 ) 1 , 3 - ジメチル - N - [ ( 3 S ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 5 ) 1 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - N - [ 2 ' - ( トリフルオロメチル ) ピフェニル - 2 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 6 ) 2 - フルオロ - 6 - ( トリフルオロメチル ) - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) ベンズアミド、 ( 2 . 0 2 7 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 8 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - N - [ ( 3 S ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 9 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - [ ( 3 R ) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 3 0 ) 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - [ ( 3 S ) - 7 - フルオロ - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 3 1 ) 5 , 8 - ジフルオロ - N - [ 2 - ( 2 - フルオロ - 4 - { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 2 - イル ] オキシ } フェニル ) エチル ] キナゾリン - 4 - アミン、 ( 2 . 0 3 2 ) N - [ ( 1 R , 4 S ) - 9 - ( ジクロロメチレン ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル ] - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 3 3 ) N - [ ( 1 S , 4 R ) - 9 - ( ジクロロメチレン ) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 1 , 4 - メタノナフタレン - 5 - イル ] - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 3 4 ) N - [ 1 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) - 1 - メトキシプロパン - 2 - イル ] - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 3 5 ) N - [ r a c - ( 1 S , 2 S ) - 2 - ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) シクロブチル ] - 2 - ( トリフルオロメチル ) ニコチンアミド。

10

20

30

【 0 1 6 8 】

( 3 ) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、 ( 3 . 0 0 1 ) アメトクトラジン、 ( 3 . 0 0 2 ) アミスルプロム、 ( 3 . 0 0 3 ) アゾキシストロビン、 ( 3 . 0 0 4 ) クメトキシストロビン ( c o u m e t h o x y s t r o b i n )、 ( 3 . 0 0 5 ) クモキシストロビン、 ( 3 . 0 0 6 ) シアゾファミド、 ( 3 . 0 0 7 ) ジモキシストロビン、 ( 3 . 0 0 8 ) エノキサストロビン、 ( 3 . 0 0 9 ) ファモキサドン、 ( 3 . 0 1 0 ) フェンアミドン、 ( 3 . 0 1 1 ) フェンピコキサミド、 ( 3 . 0 1 2 ) フロリルピコキサミド、 ( 3 . 0 1 3 ) フルフェノキシストロビン、 ( 3 . 0 1 4 ) フルオキサストロビン、 ( 3 . 0 1 5 ) クレソキシム - メチル、 ( 3 . 0 1 6 ) マンデストロビン、 ( 3 . 0 1 4 ) メトミノストロビン、 ( 3 . 0 1 8 ) メチルテトラプロール、 ( 3 . 0 1 9 ) オリサストロビン、 ( 3 . 0 2 0 ) ピコキシストロビン、 ( 3 . 0 2 1 ) ピラクロストロビン、 ( 3 . 0 2 2 ) ピラメトストロビン、 ( 3 . 0 2 3 ) ピラオキシストロビン、 ( 3 . 0 2 4 ) トリフロキシストロビン、 ( 3 . 0 2 5 ) ( 2 E ) - 2 - { 2 - [ ( { [ ( 1 E ) - 1 - ( 3 - { [ ( E ) - 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル ] オキシ } フェニル ) エチリデン ] アミノ } オキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - ( メトキシイミノ ) - N - メチルアセトアミド、 ( 3 . 0 2 6 ) ( 2 E , 3 Z ) - 5 - { [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] オキシ } - 2 - ( メトキシイミノ ) - N , 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド、 ( 3 . 0 2 7 ) ( 2 R ) - 2 - { 2 - [ ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、 ( 3 . 0 2 8 ) ( 2 S ) - 2 - { 2 - [ ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ

40

50

- N - メチルアセトアミド、( 3 . 0 2 9 ) N - ( 3 - エチル - 3 , 5 , 5 - トリメチルシクロヘキシル ) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミド、( 3 . 0 3 0 ) ( 2 E , 3 Z ) - 5 - { [ 1 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] オキシ } - 2 - ( メトキシイミノ ) - N , 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド、( 3 . 0 3 1 ) { 5 - [ 3 - ( 2 , 4 - ジメチルフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - 2 - メチルベンジル } カルバミン酸メチル。

【 0 1 6 9 】

( 4 ) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、( 4 . 0 0 1 ) カルベンダジム、( 4 . 0 0 2 ) ジエトフェンカルブ、( 4 . 0 0 3 ) エタボキサム、( 4 . 0 0 4 ) フルオピコリド、( 4 . 0 0 5 ) フルオピモミド、( 4 . 0 0 6 ) メトラフェノン、( 4 . 0 0 7 ) ペンシクロン、( 4 . 0 0 8 ) ピリダクロメチル、( 4 . 0 0 9 ) ピリオフェノン ( クラザフェノン ) ( *chlazafenone* )、( 4 . 0 1 0 ) チアベンダゾール、( 4 . 0 1 1 ) チオファネート - メチル、( 4 . 0 1 2 ) ゴキサミド、( 4 . 0 1 3 ) 3 - クロロ - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 6 - メチルピリダジン、( 4 . 0 1 4 ) 3 - クロロ - 5 - ( 6 - クロロピリジン - 3 - イル ) - 6 - メチル - 4 - ( 2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル ) ピリダジン、( 4 . 0 1 5 ) 4 - ( 2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 6 ) 4 - ( 2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 7 ) 4 - ( 2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - プロモフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 8 ) 4 - ( 2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 9 ) 4 - ( 2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 0 ) 4 - ( 2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 1 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 2 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 3 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 4 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 5 ) 4 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 3 , 6 - ジメチルピリダジン、( 4 . 0 2 6 ) N - ( 2 - プロモ - 6 - フルオロフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 7 ) N - ( 2 - プロモフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 8 ) N - ( 4 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン。

【 0 1 7 0 】

( 5 ) 多部位に作用を示し得る化合物、例えば、( 5 . 0 0 1 ) ボルドー液、( 5 . 0 0 2 ) カプタホール、( 5 . 0 0 3 ) キャプタン、( 5 . 0 0 4 ) クロロタロニル、( 5 . 0 0 5 ) 水酸化銅、( 5 . 0 0 6 ) ナフテン酸銅、( 5 . 0 0 7 ) 酸化銅、( 5 . 0 0 8 ) 塩基性塩化銅、( 5 . 0 0 9 ) 硫酸銅 ( 2 + )、( 5 . 0 1 0 ) ジチアノン、( 5 . 0 1 1 ) ドジン、( 5 . 0 1 2 ) ホルベット、( 5 . 0 1 3 ) マンゼブ、( 5 . 0 1 4 ) マンネブ、( 5 . 0 1 5 ) メチラム、( 5 . 0 1 6 ) メチラム亜鉛 ( *metiram zinc* )、( 5 . 0 1 7 ) オキシニ銅、( 5 . 0 1 8 ) プロピネブ、( 5 . 0 1 9 ) 硫黄及び硫黄剤、例えば、多硫化カルシウム、( 5 . 0 2 0 ) チウラム、( 5 . 0 2 1 ) ジネブ、( 5 . 0 2 2 ) ジラム、( 5 . 0 2 3 ) 6 - エチル - 5 , 7 - ジオキソ - 6 , 7 -

10

20

30

40

50

ジヒドロ - 5 H - ピロロ [ 3 ' , 4 ' : 5 , 6 ] [ 1 , 4 ] ジチイノ [ 2 , 3 - c ] [ 1 , 2 ] チアゾール - 3 - カルボニトリル。

【 0 1 7 1 】

( 6 ) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、( 6 . 0 0 1 ) アシベンゾラル - S - メチル、( 6 . 0 0 2 ) ホセチル - アルミニウム、( 6 . 0 0 3 ) ホセチル - カルシウム、( 6 . 0 0 4 ) ホセチル - ナトリウム、( 6 . 0 0 5 ) イソチアニル、( 6 . 0 0 6 ) 亜リン酸及びその塩、( 6 . 0 0 3 ) プロベナゾール、( 6 . 0 0 4 ) チアジニル。

【 0 1 7 2 】

( 7 ) アミノ酸及びノ又はタンパク質の生合成の阻害薬、例えば、( 7 . 0 0 1 ) シプロジニル、( 7 . 0 0 2 ) カスガマイシン、( 7 . 0 0 3 ) カスガマイシン塩酸塩水和物、( 7 . 0 0 4 ) オキシテトラサイクリン、( 7 . 0 0 5 ) ピリメタニル。 10

【 0 1 7 3 】

( 8 ) A T P 産生の阻害薬、例えば、( 8 . 0 0 1 ) シルチオファミン。

【 0 1 7 4 】

( 9 ) 細胞壁合成の阻害薬、例えば、( 9 . 0 0 1 ) ベンチアバリカルブ、( 9 . 0 0 2 ) ジメトモルフ、( 9 . 0 0 3 ) フルモルフ、( 9 . 0 0 4 ) イプロバリカルブ、( 9 . 0 0 5 ) マンジプロパミド、( 9 . 0 0 6 ) ピリモルフ ( p y r i m o r p h )、( 9 . 0 0 7 ) バリフェナレート、( 9 . 0 0 8 ) ( 2 E ) - 3 - ( 4 - t e r t - ブチルフェニル ) - 3 - ( 2 - クロロピリジン - 4 - イル ) - 1 - ( モルホリン - 4 - イル ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン、( 9 . 0 0 9 ) ( 2 Z ) - 3 - ( 4 - t e r t - ブチルフェニル ) - 3 - ( 2 - クロロピリジン - 4 - イル ) - 1 - ( モルホリン - 4 - イル ) プロパ - 2 - エン - 1 - オン。 20

【 0 1 7 5 】

( 1 0 ) 脂質の合成若しくは輸送又は膜の合成の阻害薬、例えば、( 1 0 . 0 0 1 ) フルオキサピプロリン、( 1 0 . 0 0 2 ) ナタマイシン、( 1 0 . 0 0 3 ) オキサチアピプロリン、( 1 0 . 0 0 4 ) プロパモカルブ、( 1 0 . 0 0 5 ) プロパモカルブ塩酸塩、( 1 0 . 0 0 6 ) プロパモカルブ - ホセチレート、( 1 0 . 0 0 7 ) トルクロホス - メチル、( 1 0 . 0 0 8 ) 1 - ( 4 - { 4 - [ ( 5 R ) - 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル ] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル ) - 2 - [ 5 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] エタノン、( 1 0 . 0 0 9 ) 1 - ( 4 - { 4 - [ ( 5 S ) - 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル ] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル ) - 2 - [ 5 - メチル - 3 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] エタノン、( 1 0 . 0 1 0 ) 2 - [ 3 , 5 - ビス ( ジフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - 1 - [ 4 - ( 4 - { 5 - [ 2 - ( プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ ) フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] エタノン、( 1 0 . 0 1 1 ) 2 - [ 3 , 5 - ビス ( ジフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - 1 - [ 4 - ( 4 - { 5 - [ 2 - クロロ - 6 - ( プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ ) フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] エタノン、( 1 0 . 0 1 2 ) 2 - [ 3 , 5 - ビス ( ジフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - 1 - [ 4 - ( 4 - { 5 - [ 2 - フルオロ - 6 - ( プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ ) フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] エタノン、( 1 0 . 0 1 3 ) 2 - { ( 5 R ) - 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3 , 5 - ビス ( ジフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニル メタンスルホネート、( 1 0 . 0 1 4 ) 2 - { ( 5 S ) - 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3 , 5 - ビス ( ジフルオロメチル ) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1 , 3 - チアゾール - 4 50

-イル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル} - 3 - クロロフェニル  
 メタンスルホネート、(10.015) 2 - { 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス(ジフル  
 オロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 - イル) - 1  
 , 3 - チアゾール - 4 - イル] - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル}  
 フェニル メタンスルホネート、(10.016) 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 5 - メチル - 3  
 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチル} ピペリジン - 4 -  
 イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 1, 5 - ジヒドロ - 2, 4 - ベンゾジオキセ  
 ピン - 6 - イル メタンスルホネート、(10.017) 9 - フルオロ - 3 - [ 2 - ( 1  
 - { [ 5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチ  
 ル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 1, 5 - ジヒドロ - 2  
 , 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホネート、(10.018) 3 - [ 2  
 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチ  
 ル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 1, 5 - ジヒドロ - 2  
 , 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホネート、(10.019) 3 - [ 2  
 - ( 1 - { [ 3, 5 - ビス(ジフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] アセチ  
 ル} ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3 - チアゾール - 4 - イル] - 9 - フルオロ - 1, 5  
 - ジヒドロ - 2, 4 - ベンゾジオキセピン - 6 - イル メタンスルホネート。

10

## 【0176】

(11)メラニン生合成の阻害薬、例えば、(11.001)トルプロカルブ、(1  
 1.002)トリシクラゾール。

20

## 【0177】

(12)核酸合成の阻害薬、例えば、(12.001)ベナラキシル、(12.00  
 2)ベナラキシル - M(キララキシル)、(12.003)メタラキシル、(12.00  
 4)メタラキシル - M(メフェノキサム)。

## 【0178】

(13)シグナル伝達の阻害薬、例えば、(13.001)フルジオキシニル、(1  
 3.002)イブロジオン、(13.003)プロシミドン、(13.004)プロキナ  
 ジド、(13.005)キノキシフェン、(13.006)ピンクロゾリン。

## 【0179】

(14)脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、(14.001)フルアジナム  
 、(14.002)メプチルジノカップ。

30

## 【0180】

(15)さらなる化合物、例えば、(15.001)アブシジン酸、(15.002  
 )アミノピリフェン、(15.003)ベンチアゾール、(15.004)ベトキサジン  
 、(15.005)カプシマイシン(capsimycin)、(15.006)カルボ  
 ン、(15.007)キノメチオネート、(15.008)クフラネブ、(15.009  
 )シフルフェナミド、(15.010)シモキサニル、(15.011)シプロスルファ  
 ミド、(15.012)ジピメチトロン、(15.013)フルチアニル、(15.01  
 4)イブフルフェノキン、(15.015)イソチオシアン酸メチル、(15.016)  
 ミルディオマイシン、(15.017)ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、(15.  
 018)ニトロタル - イソプロピル、(15.019)オキシフェンチン(oxyfe  
 nthiin)、(15.020)ペンタクロロフェノール及び塩、(15.021)ピ  
 カルブトラゾクス、(15.022)キノフメリン、(15.023)D - タガトース、  
 (15.024)テブフロキン、(15.025)テクロフタラム、(15.026)ト  
 ルニファニド(tolnifanide)、(15.027)2 - (6 - ベンジルピリジ  
 ン - 2 - イル)キナゾリン、(15.028)2 - [6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシ  
 フェニル) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル]キナゾリン、(15.029)2 - フェ  
 ニルフェノール及び塩、(15.030)4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オー  
 ル(互変異性体形態: 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2(1H) - オン)、(1  
 5.031)4 - オキソ - 4 - [(2 - フェニルエチル)アミノ]ブタン酸、(15.0

40

50

32) 5 - アミノ - 1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、(15.033) 5 -  
 クロロ - N' - フェニル - N' - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル) チオフェン - 2 - スルホ  
 ノヒドラジド、(15.034) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - フルオロベンジル) オキシ  
 ] - ピリミジン - 4 - アミン、(15.035) 5 - フルオロ - 2 - [(4 - メチルベン  
 ジル) オキシ] ピリミジン - 4 - アミン、(15.036) 5 - フルオロ - 4 - イミノ -  
 3 - メチル - 1 - [(4 - メチルフェニル) スルホニル] - 3, 4 - ジヒドロピリミジン  
 - 2 (1H) - オン、(15.037) ブタ - 3 - イン - 1 - イル {6 - [(Z)  
 ) - (1 - メチル - 1H - テトラゾール - 5 - イル) (フェニル) メチレン] アミノ } オ  
 キシ) メチル] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、(15.038) エチル (2Z)  
 - 3 - アミノ - 2 - シアノ - 3 - フェニルアクリレート、(15.039) フェナジン - 10  
 1 - カルボン酸、(15.040) プロピル 3, 4, 5 - トリヒドロキシベンゾエート  
 、(15.041) キノリン - 8 - オール、(15.042) キノリン - 8 - オール スル  
 フェート (2:1)、(15.043) 1 - (4, 5 - ジメチル - 1H - ベンゾイミダ  
 ゴール - 1 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキ  
 ノリン、(15.044) 1 - (5 - (フルオロメチル) - 6 - メチル - ピリジン - 3 -  
 イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、(1  
 5.045) 1 - (5, 6 - ジメチルピリジン - 3 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3,  
 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、(15.046) 1 - (6 - (ジフルオ  
 ロメチル) - 5 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメ  
 チル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン、(15.047) 1 - (6 - (ジフルオロメチル 20  
 ) - 5 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3,  
 4 - ジヒドロイソキノリン、(15.048) 1 - (6, 7 - ジメチルピラゾロ [1, 5  
 - a] ピリジン - 3 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒド  
 ロイソキノリン、(15.049) 2 - {2 - フルオロ - 6 - [(8 - フルオロ - 2 - メ  
 チルキノリン - 3 - イル) オキシ] フェニル} プロパン - 2 - オール、(15.050)  
 3 - (4, 4, 5 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン -  
 1 - イル) キノリン、(15.051) 3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル -  
 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) - 8 - フルオロキノリン、(15.052)  
 3 - (4, 4 - ジフルオロ - 5, 5 - ジメチル - 4, 5 - ジヒドロチエノ [2, 3 - c]  
 ピリジン - 7 - イル) キノリン、(15.053) 3 - (5 - フルオロ - 3, 3, 4, 4 30  
 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) キノリン、(15.054)  
 ) 5 - プロモ - 1 - (5, 6 - ジメチルピリジン - 3 - イル) - 3, 3 - ジメチル - 3,  
 4 - ジヒドロイソキノリン、(15.055) 8 - フルオロ - 3 - (5 - フルオロ - 3,  
 3, 4, 4 - テトラメチル - 3, 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル) - キノリン、(1  
 5.056) 8 - フルオロ - 3 - (5 - フルオロ - 3, 3 - ジメチル - 3, 4 - ジヒド  
 ロイソキノリン - 1 - イル) - キノリン、(15.057) 8 - フルオロ - N - (4, 4  
 , 4 - トリフルオロ - 2 - メチル - 1 - フェニルブタン - 2 - イル) キノリン - 3 - カル  
 ボキサミド、(15.058) 8 - フルオロ - N - [(2S) - 4, 4, 4 - トリフルオ  
 ロ - 2 - メチル - 1 - フェニルブタン - 2 - イル] キノリン - 3 - カルボキサミド、(1  
 5.059) 9 - フルオロ - 2, 2 - ジメチル - 5 - (キノリン - 3 - イル) - 2, 3 - 40  
 ジヒドロ - 1, 4 - ベンゾオキサゼピン、(15.060) N - (2, 4 - ジメチル - 1  
 - フェニルペンタン - 2 - イル) - 8 - フルオロキノリン - 3 - カルボキサミド、(15  
 .061) N - [(2S) - 2, 4 - ジメチル - 1 - フェニルペンタン - 2 - イル] - 8  
 - フルオロキノリン - 3 - カルボキサミド、(15.062) 1, 1 - ジエチル - 3 - [  
 [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェ  
 ニル] メチル] 尿素、(15.063) 1, 3 - ジメトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリ  
 フルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メチル] 尿素  
 、(15.064) 1 - [[3 - フルオロ - 4 - (5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2  
 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) フェニル] メチル] アゼパン - 2 - オン、(15.  
 065) 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 50



3 - イル]フェニル]メチル]ピペリジン - 2 - オン、(15.066)1 - メトキシ -  
 1 - メチル - 3 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素、(15.067)1 - メトキシ - 3 - メチル -  
 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素、(15.068)1 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - [[4 -  
 [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素、(15.069)2, 2 - ジフルオロ - N - メチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]アセトア  
 ミド、(15.070)3, 3 - ジメチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]ピペリジン - 2 - オン 10  
 、(15.071)3 - エチル - 1 - メトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素、(15.072)4, 4 - ジメチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オ  
 キサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]ピロリジン - 2 - オン、(15.073)4, 4 - ジメチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサ  
 ジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]イソオキサゾリジン - 3 - オン、(15.074)4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]  
 フェニル ジメチルカルバメート、(15.075)5, 5 - ジメチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メ  
 チル]イソオキサゾリジン - 3 - オン、(15.076)5 - メチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチ  
 ル]ピロリジン - 2 - オン、(15.077)エチル 1 - {4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンジル} - 1H - ピラゾール -  
 4 - カルボキシレート、(15.078)メチル{4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル}カルバメート、(15.079)  
 N - (1 - メチルシクロプロピル) - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.080)N - (2, 4 - ジフルオ  
 ロフェニル) - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.081)N - (2 - フルオロフェニル) - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(1 30  
 5.082)N, 2 - ジメトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド、(15.083)N, N - ジメチル - 1 - {4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサ  
 ジアゾール - 3 - イル]ベンジル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - アミン、(15.084)N - [(E) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.085)N -  
 [(E) - N - メトキシ - C - メチル - カルボンイミドイル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.086)  
 )N - [(Z) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.087)N - [(Z) - N 40  
 - メトキシ - C - メチル - カルボンイミドイル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.088)N - [[2  
 , 3 - ジフルオロ - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル] - 3, 3, 3 - トリフルオロ - プロパンアミド、(15  
 .089)N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド、(15.090)N - [4 - [5 - (トリ  
 フルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]シクロブ  
 ロパンカルボキサミド、(15.091)N - {2, 3 - ジフルオロ - 4 - [5 - (トリ  
 フルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンジル}ブタンアミド  
 、(15.092)N - {4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジア

ゾール - 3 - イル]ベンジル}シクロプロパンカルボキサミド、(15.093)N - {4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル}プロパンアミド、(15.094)N - アリル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]アセトアミド、(15.095)N - アリル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド、(15.096)N - エチル - 2 - メチル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド、(15.097)N - メトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]シクロプロパンカルボキサミド、(15.098)N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド、(15.099)N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンゼンカルボチオアミド、(15.100)N - メチル - N - フェニル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]ベンズアミド。

10

【0181】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

式(I)で表される化合物は、生物学的殺有害生物剤と組み合わせることができる。

【0182】

生物学的殺有害生物剤には、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質及び二次代謝産物)が包含される。

20

【0183】

生物学的殺有害生物剤には、細菌類、例えば、芽胞形成性細菌、根にコロニーを形成する細菌及び生物学的殺虫剤、殺菌剤又は殺線虫剤として作用する細菌などがある。

【0184】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な上記細菌類の例は、以下のものである：

バシルス・アミロリクエファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)株FZB42(DSM 231179)、又は、バシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス(*B. cereus*)株CN CM I - 1562、又は、バシルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)株I - 1582(受託番号 CNCM I - 1582)、又は、バシルス・プミルス(*Bacillus pumilus*)、特に、株GB34(受託番号 ATCC 700814)及び株QST2808(受託番号 NRRL B - 30087)、又は、バシルス・スプチリス(*Bacillus subtilis*)、特に、株GB03(受託番号 ATCC SD - 1397)、又は、バシルス・スプチリス(*Bacillus subtilis*)株QST713(受託番号 NRRL B - 21661)、又は、バシルス・スプチリス(*Bacillus subtilis*)株OST 30002(受託番号 NRRL B - 50421)、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス(*B. thuringiensis subspecies israelensis*)(抗原型 H - 14)株AM65 - 52(受託番号 ATCC 1276)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ(*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株ABTS - 1857(SD - 1372)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ(*B. thuringiensis subsp. kurstaki*)株HD - 1、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス(*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*)株NB 176(SD - 5428)、パステウリア・ペネトランス(*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種(*Pasteuria spp.*)(口チレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniform*

30

40

50

is) 線虫) - PR3 (受託番号 ATCC SD - 5834)、ストレプトミセス・ミクロフラブス (*Streptomyces microflavus*) 株 AQ6121 (= QRD 31.013、NRRL B - 50550)、ストレプトミセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) 株 AQ 6047 (受託番号 NRRL 30232)。

【0185】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な菌類及び酵母類の例は、以下のものである：

ベアウベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*)、特に、株 ATCC 74040、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*)、特に、株 CON/M/91-8 (受託番号 DSM - 9660)、レカニシリウム属種 (*Lecanicillium* spp.)、特に、株 HRO LEC 12、レカニシリウム・レカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (以前は、ベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) として知られていた)、特に、株 KV01、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*)、特に、株 F52 (DSM3884 / ATCC 90448)、メトスクニコウイア・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に、株 NRRL Y - 30752、パエシロミセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (現在：イサリア・フモソロセア (*Isaria fumosorosea*))、特に、株 IFPC 200613 又は株 Apopka 97 (受託番号 ATCC 20874)、パエシロミセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*)、特に、パエシロミセス・リラシヌス (*P. lilacinus*) 株 251 (AGAL 89/030550)、タラロミセス・フラブス (*Talaromyces flavus*)、特に、株 V117b、トリコデルマ・アトロピリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に、株 SC1 (受託番号 CBS 122089)、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、特に、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*T. harzianum rifai*) T39 (受託番号 CNCM I - 952)。

【0186】

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能なウイルス類の例は、以下のものである：

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) 顆粒病ウイルス (GV)、コドリング (*Cydia pomonella*) 顆粒病ウイルス (GV)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多角体病ウイルス (NPV)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) mNPV、ツマジロクサヨトウ (*Spodoptera frugiperda*) mNPV、エジプトヨトウ (*African cotton leafworm*) (*Spodoptera littoralis*) NPV。

【0187】

植物又は植物の部分又は植物の器官に対して「接種源」として加えられて、それらの特定の特性によって植物の成長及び植物の健康を増進する細菌類及び菌類も、同様に包含される。挙げることができる例は、以下のものである：

アグロバクテリウム属種 (*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum 属種 (*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種 (*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種 (*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種 (*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セバシア (*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セバシア (*Pseudomonas cepacia*) として知られていた)、ギガスポラ属種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラ・モノスポルム (*Gi*

g as p o r a m o n o s p o r u m )、グロムス属種 ( G l o m u s s p p . )、ラッカリア属種 ( L a c c a r i a s p p . )、ラクトバシルス・ブクネリ ( L a c t o b a c i l l u s b u c h n e r i )、パラグロムス属種 ( P a r a g l o m u s s p p . )、ピソリツス・チンクトルス ( P i s o l i t h u s t i n c t o r u s )、プセウドモナス属種 ( P s e u d o m o n a s s p p . )、リゾビウム属種 ( R h i z o b i u m s p p . )、特に、リゾビウム・トリホリイ ( R h i z o b i u m t r i f o l i i )、リゾポゴン属種 ( R h i z o p o g o n s p p . )、スクレロデルマ属種 ( S c l e r o d e r m a s p p . )、スイルス属種 ( S u i l l u s s p p . )、ストレプトミセス属種 ( S t r e p t o m y c e s s p p . )。

#### 【0188】

10

生物学的殺有害生物剤として使用されているか又は使用することが可能な、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物（これは、タンパク質及び二次代謝産物を包含する）の例は、以下のものである：

ニンニク ( A l l i u m s a t i v u m )、ニガヨモギ ( A r t e m i s i a a b s i n t h i u m )、アザジラクチン ( a z a d i r a c h t i n )、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス ( C a s s i a n i g r i c a n s )、セラストルス・アングラツス ( C e l a s t r u s a n g u l a t u s )、アメリカアリタソウ ( C h e n o p o d i u m a n t h e l m i n t i c u m )、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ ( D r y o p t e r i s f i l i x - m a s )、スギナ ( E q u i s e t u m a r v e n s e )、Fortune Aza、Fungastop、Head Up (キノア ( C h e n o p o d i u m q u i n o a ) サポニン抽出物)、除虫菊 ( P y r e t h r u m / P y r e t h r i n s )、スリナムニガキ ( Q u a s s i a a m a r a )、コナラ属 ( Q u e r c u s )、キラヤ属 ( Q u i l l a j a )、Regalia、(「Requiem<sup>TM</sup> Insecticide」)、ロテノン、リアニア/リアノジン、ヒレハリソウ ( S y m p h y t u m o f f i c i n a l e )、ヨモギギク ( T a n a c e t u m v u l g a r e )、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ ( T r o p a e u l u m m a j u s )、セイヨウイラクサ ( U r t i c a d i o i c a )、Veratrin、セイヨウヤドリギ ( V i s c u m a l b u m )、アブラナ科 ( B r a s s i c a c e a e ) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末、並びに、オリーブ油から得られるバイオ殺虫性/殺ダニ性活性物質、特に、例えば、商標名 F L I P P E R (登録商標) を有する製品中に、活性成分として含まれている、炭素鎖長 C<sub>16</sub> - C<sub>20</sub> を有する不飽和脂肪/カルボン酸。

20

30

#### 【0189】

##### 混合成分としての薬害軽減剤

式 ( I ) で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセット (-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (-エチル)、メフェンピル (-ジエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2 - メトキシ - N - ( { 4 - [ (メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド ( C A S 1 2 9 5 3 1 - 1 2 - 0 )、4 - (ジクロロアセチル) - 1 - オキサ - 4 - アザスピロ [ 4 . 5 ] デカン ( C A S 7 1 5 2 6 - 0 7 - 3 )、2 , 2 , 5 - トリメチル - 3 - (ジクロロアセチル) - 1 , 3 - オキサゾリジン ( C A S 5 2 8 3 6 - 3 1 - 4 ) などと組み合わせることができる。

40

#### 【0190】

##### 植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分の処理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（天然に発生している作物植物を包含する）のような全ての植物及び植物の部分、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、コショウ、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、

50

ホウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物 ( Brassica oleracea ) ( 例えば、キャベツ ) 及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物 ( 果実を有するもの、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウの木 ) などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、品種所有権によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物は、全ての成育段階、例えば、種子、実生、及び、幼植物 ( 未成熟植物 ) から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、塊茎、根及び根茎などである。収穫された植物又は収穫された植物の部分、並びに、栄養繁殖器官 ( vegetative propagation material ) 及び生殖繁殖器官 ( generative propagation material )、例えば、実生、塊茎、根茎、挿穂 ( cutting ) 及び種子なども、植物の部分に包含される。

10

#### 【 0 1 9 1 】

式 ( I ) で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の本発明による処理は、慣習的な処理方法によって、例えば、浸漬、散布、気化、煙霧 ( fogging )、ばらまき、塗布、注入などによって、直接的に行うか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境 ( environment ) 若しくは貯蔵空間に作用させることにより行い、また、繁殖器官 ( propagation material ) の場合、特に種子の場合は、さらに、1以上のコーティングを施すことによっても行う。

20

#### 【 0 1 9 2 】

上記で既に述べたように、本発明に従って、全ての植物及びそれらの部分を処理することができる。好ましい実施形態では、野生の植物種及び植物品種、又は、交雑若しくはプロトプラスト融合のような慣習的な生物学的育種法により得られた植物種及び植物品種、並びに、さらに、それらの部分を処理する。好ましいさらに別の実施形態では、適切な場合には慣習的な方法と組み合わせた遺伝子工学的な方法により得られたトランスジェニック植物及び植物品種 ( 遺伝子組換え生物 ) 及びそれらの部分を処理する。用語「部分 ( parts )」又は「植物の部分 ( parts of plants )」又は「植物の部分 ( plant parts )」については、既に上記で説明した。本発明は、特に好ましくは、それぞれ市販されている慣習的な品種又は使用されている慣習的な品種の植物を処理するために使用される。植物品種は、慣習的な育種又は突然変異誘発又は組換え DNA 技術によって得られた、新しい特性 ( 「形質」 ) を有する植物を意味するものと理解される。それらは、品種、変種、生物型又は遺伝子型であることができる。

30

#### 【 0 1 9 3 】

##### トランスジェニック植物、種子処理及び統合イベント

本発明によれば、式 ( I ) で表される化合物は、有利には、トランスジェニック植物、植物品種又は植物の部品に有利な及び / 又は有用な特性 ( 形質 ) を付与する遺伝物質を受け取ったそれらの植物、植物品種又は植物の部品を処理するために使用することが可能である。従って、本発明は、1つ以上の組換え形質又はトランスジェニックイベント又はそれらの組合せと組み合わせることができることが企図されている。本出願の目的に関して、トランスジェニックイベントは、植物ゲノムの染色体の中の特定の位置 ( 遺伝子座 ) に特定の組換え DNA 分子を挿入することによって作成される。この挿入によって、「イベント」と称される新規 DNA 配列が形成され、そして、挿入された組換え DNA 分子と、その挿入された DNA の両末端に隣接 ( adjacent to ) / 隣接 ( flanking ) しているある程度の量のゲノム DNA によって特徴付けられる。そのような形質又はトランスジェニックイベントとしては、限定するものではないが、害虫抵抗性、水利用

40

50

効率、収量性能、干ばつ耐性、種子品質、改善された栄養品質、ハイブリッド種子産生及び除草剤耐性などがあり、ここで、該形質は、そのような形質又はトランスジェニックイベントを欠いている植物と比較して測定される。そのような有利な及び/又は有用な特性(形質)の具体的な例は、向上した植物の成長、活力、ストレス耐性、直立性(*standability*)、倒伏耐性、養分摂取、植物栄養及び/又は収量であり、特に、改善された成長、高温又は低温に対する向上した耐性、干ばつ又は水若しくは土壌の塩分レベルに対する向上した耐性、強化された開花性能、向上した収穫の容易性、加速された成熟、増大した収量、収穫された生産物の向上した品質及び/又は向上した栄養価、収穫された生産物の向上した貯蔵寿命及び/又は向上した加工性、並びに、有害動物及び有害微生物(例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類)に対する向上した抵抗性又は耐性である。 10

【0194】

そのような有害動物及び有害微生物(特に、昆虫類)に対する抵抗性又は耐性の特性を付与するタンパク質をコード化するDNA配列の中で、特に、文献に広く記載され、当業者によく知られているBtタンパク質をコード化するバシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)に由来する遺伝物質が挙げられる。さらにまた、フォトラブズス(*Photobabdus*)などの細菌から抽出されたタンパク質も挙げられる(WO97/17432及びWO98/08932)。特に、以下のものが挙げられる: Bt Cryタンパク質又はVIPタンパク質(これは、Cry1A、Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1IA、Cry1IIA、Cry1IIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb及びCryIFタンパク質を包含する)又は毒性を示すそれらのフラグメント、並びに、さらに、それらのハイブリッド又は組み合わせ、特に、Cry1Fタンパク質又はCry1Fタンパク質由来のハイブリッド(例えば、ハイブリッドCry1A-Cry1Fタンパク質又は毒性を示すそのフラグメント)、Cry1A型タンパク質又は毒性を示すそのフラグメント、好ましくは、Cry1Acタンパク質又はCry1Acタンパク質由来のハイブリッド(例えば、ハイブリッドCry1Ab-Cry1Acタンパク質)、又は、Cry1Ab若しくはBt2タンパク質又は毒性を示すそのフラグメント、Cry2Ae、Cry2Af若しくはCry2Agタンパク質又は毒性を示すそのフラグメント、Cry1A.105タンパク質又は毒性を示すそのフラグメント、VIP3Aa19タンパク質、VIP3Aa20タンパク質、COT202又はCOT203ワタイイベントにおいて産生されるVIP3Aタンパク質、「Estruch et al. (1996), Proc Natl Acad Sci USA, 28; 93(11): 5389-94」に記載されているVIP3Aaタンパク質又は毒性を示すそのフラグメント、WO2001/47952に記載されているCryタンパク質、キセノラブズス(*Xenorhabdus*)に由来する殺虫性タンパク質(WO98/50427に記載されている)、セラチア(*Serratia*)に由来する殺虫性タンパク質(特に、セラチア・エントモフィラ(*S. entomophila*)に由来する殺虫性タンパク質)、又は、フォトラブズス(*Photobabdus*)属各種に由来する殺虫性タンパク質、例えば、WO98/08932に記載されているフォトラブズス(*Photobabdus*)に由来するTc-タンパク質。さらにまた、上記で挙げられている配列(特に、毒性を示すそれらのフラグメントの配列)といくつかのアミノ酸(1~10、好ましくは1~5)が異なっているそれらタンパク質の任意の変異体若しくは突然変異、又は、シグナルペプチド(例えば、プラスチドシグナルペプチド)又は他のタンパク質若しくはペプチドに融合しているそれらタンパク質の任意の変異体若しくは突然変異体も、ここに包含される。 20 30 40

【0195】

そのような特性の別の特に重要な例は、1種類以上の除草剤(例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン)に対する耐性を付与されることである。形質転換された植物細胞及び植物に特定の除草剤に対する耐性の特性を付与するタンパク質をコード化するDNA配列の中で、特に、以下のものが挙げられる: グ 50

ルホシネート除草剤に対する耐性を付与するWO2009/152359に記載されているbar遺伝子若しくはPAT遺伝子又はストレプトミセス・コエリカラー (*Streptomyces coelicolor*) 遺伝子、EPSPSを標的とする除草剤 (特に、グリホセート及びその塩などの除草剤) に対する耐性を付与する適切なEPSPS (5-エノールピルピルシキミ酸-3-リン酸-シクターゼ) をコード化する遺伝子、グリホセート-n-アセチルトランスフェラーゼをコード化する遺伝子、又は、グリホセート酸化還元酵素をコード化する遺伝子。さらなる適切な除草剤耐性形質としては、以下のものなどがある: 少なくとも1種類のALS (アセト乳酸合成酵素) 阻害薬 (例えば、WO2007/024782)、突然変異シロイヌナズナ (*Arabidopsis*) ALS/AHAS 遺伝子 (例えば、米国特許第6,855,533号)、2,4-D (2,4-ジクロロフェノキシ酢酸) に対する耐性を付与する2,4-D-モノオキシゲナーゼをコード化する遺伝子、及び、ジカンバ (3,6-ジクロロ-2-メトキシ安息香酸) に対する耐性を付与するジカンバモノオキシゲナーゼをコード化する遺伝子。

10

## 【0196】

そのような特性のさらに別の特に重要な例は、例えば、全身獲得抵抗性 (SAR)、システムイン (*systemin*)、フィトアレキシン、誘導因子並びにさらに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び/又はウイルス類に対する向上した抵抗性である。

## 【0197】

本発明に従って好ましくは処理することが可能なトランスジェニック植物又は植物品種における特に有用なトランスジェニックイベントとしては、以下のものを挙げるができる: イベント531/PV-GHBK04 (ワタ、昆虫防除、WO2002/040677に記載されている)、イベント1143-14A (ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128569に記載されている); イベント1143-51B (ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128570に記載されている); イベント1445 (ワタ、除草剤耐性、寄託されていない、US-A2002-120964又はWO2002/034946に記載されている); イベント17053 (イネ、除草剤耐性、PTA-9843として寄託されている、WO2010/117737に記載されている); イベント17314 (イネ、除草剤耐性、PTA-9844として寄託されている、WO2010/117735に記載されている); イベント281-24-236 (ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、PTA-6233として寄託されている、WO2005/103266又はUS-A2005-216969に記載されている); イベント3006-210-23 (ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、PTA-6233として寄託されている、US-A2007-143876又はWO2005/103266に記載されている); イベント3272 (トウモロコシ、品質に関する形質、PTA-9972として寄託されている、WO2006/098952又はUS-A2006-230473に記載されている); イベント33391 (コムギ、除草剤耐性、PTA-2347として寄託されている、WO2002/027004に記載されている)、イベント40416 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-11508として寄託されている、WO11/075593に記載されている); イベント43A47 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-11509として寄託されている、WO2011/075595に記載されている); イベント5307 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC PTA-9561として寄託されている、WO2010/077816に記載されている); イベントASR-368 (ベントグラス、除草剤耐性、ATCC PTA-4816として寄託されている、US-A2006-162007又はWO2004/053062に記載されている); イベントB16 (トウモロコシ、除草剤耐性、寄託されていない、US-A2003-126634に記載されている); イベントBPS-CV127-9 (ダイズ、除草剤耐性、NCIMB No. 41603として寄託されている、WO2010/080829に記載されている); イベントBLR1 (アブラナ、雄性不稔の回復、NCIMB 41193として寄託されている、WO2005/074

20

30

40

50

671に記載されている)、イベントCE43-67B(ワタ、昆虫防除、DSMAC2724として寄託されている、US-A2009-217423又はWO2006/128573に記載されている);イベントCE44-69D(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、US-A2010-0024077に記載されている);イベントCE44-69D(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128571に記載されている);イベントCE46-02A(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128572に記載されている);イベントCOT102(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、US-A2006-130175又はWO2004/039986に記載されている);イベントCOT202(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、US-A2007-067868又はWO2005/054479に記載されている);イベントCOT203(ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2005/054480に記載されている););イベントDAS21606-3/1606(ダイズ、除草剤耐性、PTA-11028として寄託されている、WO2012/033794に記載されている)、イベントDAS40278(トウモロコシ、除草剤耐性、ATCCPTA-10244として寄託されている、WO2011/022469に記載されている);イベントDAS-44406-6/pDAB8264.44.06.1(ダイズ、除草剤耐性、PTA-11336として寄託されている、WO2012/075426に記載されている)、イベントDAS-14536-7/pDAB8291.45.36.2(ダイズ、除草剤耐性、PTA-11335として寄託されている、WO2012/075429に記載されている)、イベントDAS-59122-7(トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCCPTA11384として寄託されている、US-A2006-070139に記載されている);イベントDAS-59132(トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、寄託されていない、WO2009/100188に記載されている);イベントDAS68416(ダイズ、除草剤耐性、ATCCPTA-10442として寄託されている、WO2011/066384又はWO2011/066360に記載されている);イベントDP-098140-6(トウモロコシ、除草剤耐性、ATCCPTA-8296として寄託されている、US-A2009-137395又はWO08/112019に記載されている);イベントDP-305423-1(ダイズ、品質に関する形質、寄託されていない、US-A2008-312082又はWO2008/054747に記載されている);イベントDP-32138-1(トウモロコシ、ハイブリダイゼーション系、ATCCPTA-9158として寄託されている、US-A2009-0210970又はWO2009/103049に記載されている);イベントDP-356043-5(ダイズ、除草剤耐性、ATCCPTA-8287として寄託されている、US-A2010-0184079又はWO2008/002872に記載されている);イベントEE-I(ナス、昆虫防除、寄託されていない、WO07/091277に記載されている);イベントFil17(トウモロコシ、除草剤耐性、ATCC209031として寄託されている、US-A2006-059581又はWO98/044140に記載されている);イベントFG72(ダイズ、除草剤耐性、PTA-11041として寄託されている、WO2011/063413に記載されている)、イベントGA21(トウモロコシ、除草剤耐性、ATCC209033として寄託されている、US-A2005-086719又はWO98/044140に記載されている);イベントGG25(トウモロコシ、除草剤耐性、ATCC209032として寄託されている、US-A2005-188434又はWO98/044140に記載されている);イベントGHB119(ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCCPTA-8398として寄託されている、WO2008/151780に記載されている);イベントGHB614(ワタ、除草剤耐性、ATCCPTA-6878として寄託されている、US-A2010-050282又はWO2007/017186に記載されている);イベントGJ11(トウモロコシ、除草剤耐性、ATCC209030として寄託されている、US-A2005-188434又はWO98/044140に記載されている);イベントGM RZ13(テンサイ、ウイルス抵抗性、NCIMB-41601として寄託されてい

10

20

30

40

50



る、WO2010/076212に記載されている)；イベントH7-1(テンサイ、除草剤耐性、NCIMB 41158又はNCIMB 41159として寄託されている、US-A2004-172669又はWO2004/074492に記載されている)；イベントJOPLIN1(コムギ、病害耐性、寄託されていない、US-A2008-064032に記載されている)；イベントLL27(ダイズ、除草剤耐性、NCIMB 41658として寄託されている、WO2006/108674又はUS-A2008-320616に記載されている)；イベントLL55(ダイズ、除草剤耐性、NCIMB 41660として寄託されている、WO2006/108675又はUS-A2008-196127に記載されている)；イベントLLcotton25(ワタ、除草剤耐性、ATCC PTA-3343として寄託されている、WO2003/013224又はUS A2003-097687に記載されている)；イベントLLRICE06(イネ、除草剤耐性、ATCC 203353として寄託されている、US 6,468,747又はWO2000/026345に記載されている)；イベントLLRice62(イネ、除草剤耐性、ATCC 203352として寄託されている、WO2000/026345に記載されている)、イベントLLRICE601(イネ、除草剤耐性、ATCC PTA-2600として寄託されている、US-A2008-2289060又はWO2000/026356に記載されている)；イベントLY038(トウモロコシ、品質に関する形質、ATCC PTA-5623として寄託されている、US-A2007-028322又はWO2005/061720に記載されている)；イベントMIR162(トウモロコシ、昆虫防除、PTA-8166として寄託されている、US-A2009-300784又はWO2007/142840に記載されている)；イベントMIR604(トウモロコシ、昆虫防除、寄託されていない、US-A2008-167456又はWO2005/103301に記載されている)；イベントMON15985(ワタ、昆虫防除、ATCC PTA-2516として寄託されている、US-A2004-250317又はWO2002/100163に記載されている)；イベントMON810(トウモロコシ、昆虫防除、寄託されていない、US-A2002-102582に記載されている)；イベントMON863(トウモロコシ、昆虫防除、ATCC PTA-2605として寄託されている、WO2004/011601又はUS-A2006-095986に記載されている)；イベントMON87427(トウモロコシ、受粉制御、ATCC PTA-7899として寄託されている、WO2011/062904に記載されている)；イベントMON87460(トウモロコシ、ストレス耐性、ATCC PTA-8910として寄託されている、WO2009/111263又はUS-A2011-0138504に記載されている)；イベントMON87701(ダイズ、昆虫防除、ATCC PTA-8194として寄託されている、US-A2009-130071又はWO2009/064652に記載されている)；イベントMON87705(ダイズ、品質に関する形質-除草剤耐性、ATCC PTA-9241として寄託されている、US-A2010-0080887又はWO2010/037016に記載されている)；イベントMON87708(ダイズ、除草剤耐性、ATCC PTA-9670として寄託されている、WO2011/034704に記載されている)；イベントMON87712(ダイズ、収量、PTA-10296として寄託されている、WO2012/051199に記載されている)、イベントMON87754(ダイズ、品質に関する形質、ATCC PTA-9385として寄託されている、WO2010/024976に記載されている)；イベントMON87769(ダイズ、品質に関する形質、ATCC PTA-8911として寄託されている、US-A2011-0067141又はWO2009/102873に記載されている)；イベントMON88017(トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-5582として寄託されている、US-A2008-028482又はWO2005/059103に記載されている)；イベントMON88913(ワタ、除草剤耐性、ATCC PTA-4854として寄託されている、WO2004/072235又はUS-A2006-059590に記載されている)；イベン

トMON88302 (アブラナ、除草剤耐性、PTA-10955として寄託されている、WO2011/153186に記載されている)、イベントMON88701 (ワタ、除草剤耐性、PTA-11754として寄託されている、WO2012/134808に記載されている)、イベントMON89034 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC PTA-7455として寄託されている、WO07/140256又はUS-A2008-260932に記載されている); イベントMON89788 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC PTA-6708として寄託されている、US-A2006-282915又はWO2006/130436に記載されている); イベントMS11 (アブラナ、受粉制御-除草剤耐性、ATCC PTA-850又はPTA-2485として寄託されている、WO2001/031042に記載されている); イベントMS8 (アブラナ、受粉制御-除草剤耐性、ATCC PTA-730として寄託されている、WO2001/041558又はUS-A2003-188347に記載されている); イベントNK603 (トウモロコシ、除草剤耐性、ATCC PTA-2478として寄託されている、US-A2007-292854に記載されている); イベントPE-7 (イネ、昆虫防除、寄託されていない、WO2008/114282に記載されている); イベントRF3 (アブラナ、受粉制御-除草剤耐性、ATCC PTA-730として寄託されている、WO2001/041558又はUS-A2003-188347に記載されている); イベントRT73 (アブラナ、除草剤耐性、寄託されていない、WO2002/036831又はUS-A2008-070260に記載されている); イベントSYHT0H2 / SYN-000H2-5 (ダイズ、除草剤耐性、PTA-11226として寄託されている、WO2012/082548に記載されている)、イベントT227-1 (テンサイ、除草剤耐性、寄託されていない、WO2002/44407又はUS-A2009-265817に記載されている); イベントT25 (トウモロコシ、除草剤耐性、寄託されていない、US-A2001-029014又はWO2001/051654に記載されている); イベントT304-40 (ワタ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-8171として寄託されている、US-A2010-077501又はWO2008/122406に記載されている); イベントT342-142 (ワタ、昆虫防除、寄託されていない、WO2006/128568に記載されている); イベントTC1507 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、寄託されていない、US-A2005-039226又はWO2004/099447に記載されている); イベントVIP1034 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、ATCC PTA-3925として寄託されている、WO2003/052073に記載されている)、イベント32316 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、PTA-11507として寄託されている、WO2011/084632に記載されている)、イベント4114 (トウモロコシ、昆虫防除-除草剤耐性、PTA-11506として寄託されている、WO2011/084621に記載されている)、イベントEE-GM3/FG72 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-11041) [これは、場合により、イベントEE-GM1/LL27又はイベントEE-GM2/LL55とスタックされている] (WO2011/063413A2)、イベントDAS-68416-4 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-10442、WO2011/066360A1)、イベントDAS-68416-4 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-10442、WO2011/066384A1)、イベントDP-040416-8 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA-11508、WO2011/075593A1)、イベントDP-043A47-3 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA-11509、WO2011/075595A1)、イベントDP-004114-3 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA-11506、WO2011/084621A1)、イベントDP-032316-8 (トウモロコシ、昆虫防除、ATCC受託番号PTA-11507、WO2011/084632A1)、イベントMON-88302-9 (アブラナ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-10955、WO2011/153186A1)、イベントDAS-21606-3 (ダイズ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-11028

、WO2012/033794A2)、イベントMON-87712-4(ダイズ、品質に関する形質、ATCC受託番号PTA-10296、WO2012/051199A2)、イベントDAS-44406-6(ダイズ、スタックされた除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-11336、WO2012/075426A1)、イベントDAS-14536-7(ダイズ、スタックされた除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-11335、WO2012/075429A1)、イベントSYN-000H2-5(ダイズ、除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-11226、WO2012/082548A2)、イベントDP-061061-7(アブラナ、除草剤耐性、寄託番号未入手、WO2012/071039A1)、イベントDP-073496-4(アブラナ、除草剤耐性、寄託番号未入手、US2012131692)、イベント8264.44.06.1(ダイズ、スタックされた除草剤耐性、受託番号PTA-11336、WO2012075426A2)、イベント8291.45.36.2(ダイズ、スタックされた除草剤耐性、受託番号PTA-11335、WO2012075429A2)、イベントSYHT0H2(ダイズ、ATCC受託番号PTA-11226、WO2012/082548A2)、イベントMON88701(ワタ、ATCC受託番号PTA-11754、WO2012/134808A1)、イベントKK179-2(アルファルファ、ATCC受託番号PTA-11833、WO2013/003558A1)、イベントpDAB8264.42.32.1(ダイズ、スタックされた除草剤耐性、ATCC受託番号PTA-11993、WO2013/010094A1)、イベントMZDT09Y(トウモロコシ、ATCC受託番号PTA-13025、WO2013/012775A1)。

10

20

## 【0198】

さらに、そのようなトランスジェニックイベントのリストは、米国農務省(USDA)動植物検疫局(APHIS)によって提供されており、そして、ワールドワイドウェブのそれらのウェブサイト「[aphis.usda.gov](http://aphis.usda.gov)」で見いだすことができる。本出願に関しては、本出願の出願日に存在している/存在していた当該リストの状況が関連する。

## 【0199】

望まれる当該形質を付与する遺伝子/イベントは、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。挙げることができるトランスジェニック植物の例は、重要な作物植物、例えば、穀類(コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク)、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物(果実を有するもの、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウ)などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な形質は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性、並びに、1種類以上の除草剤に対する植物の向上した抵抗性である。

30

## 【0200】

好ましくは本発明に従って処理され得るそのような植物、植物の部分又は植物の種子の商業的に入手可能な例としては、以下のような商標名で販売又は販売されている市販製品(例えば、植物の種子)などがある: GENUITY(登録商標)、DROUGHTGARD(登録商標)、SMARTSTAX(登録商標)、RIB COMPLETE(登録商標)、ROUNDUP READY(登録商標)、VT DOUBLE PRO(登録商標)、VT TRIPLE PRO(登録商標)、BOLLGARD II(登録商標)、ROUNDUP READY 2 YIELD(登録商標)、YIELDGARD(登録商標)、ROUNDUP READY 2(登録商標) XTEND™、INTACTARR2 PRO(登録商標)、VISTIVE GOLD(登録商標)、及び/又は、XTENDFLEX™。

40

## 【0201】

作物保護 - 処理の種類

50

式 ( I ) で表される化合物を用いた植物及び植物の部分の処理は、慣習的な処理方法を用いて、例えば、浸漬、散布、噴霧、灌漑、気化、散粉、煙霧、ばらまき、泡状化、塗布、拡散 ( spreading - on )、注入、灌水 ( 灌注 ( drenching ) )、点滴灌漑などによって、直接的に実施するか、又は、該化合物を植物及び植物の部分の周囲、生息環境若しくは貯蔵空間に作用させることによって実施し、また、繁殖器官 ( propagation material ) の場合、特に種子の場合は、さらに、乾式種子処理用の粉末、液体種子処理用の溶液、スラリー処理用の水溶性粉末として、被覆によって、1以上の被膜によるコーティングなどによっても処理する。さらに、式 ( I ) で表される化合物を微量散布法 ( ultra - low volume method ) によって施用することも可能であり、又は、該施用形態又は式 ( I ) で表される化合物自体を土壤中に注入することも可能である。 10

#### 【 0 2 0 2 】

植物の好ましい直接的な処理は、茎葉施用 ( 即ち、式 ( I ) で表される化合物を茎葉部に施用する ) であり、その場合、その処理頻度及び施用量は、当該有害生物の発生のレベルに従って適合させるべきである。

#### 【 0 2 0 3 】

浸透移行性活性化合物の場合、式 ( I ) で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。その場合、該植物は、その植物の生息環境に対して式 ( I ) で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌注 ( drenching ) によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させること ( 即ち、植物の生育場所 ( 例えば、土壌、又は、水耕系 ) に式 ( I ) で表される化合物の液体形態を含浸させること ) によって、又は、土壌施用 ( 即ち、本発明による式 ( I ) で表される化合物を固体形態で ( 例えば、顆粒形態で ) 植物の生育場所に導入すること ) によって、又は、滴下施用 ( 多くの場合、「化学溶液灌水 ( chemigation ) 」とも称される ) ( 即ち、植物の近傍の定められた位置に、本発明による式 ( I ) で表される化合物を変動する量の水と一緒に、特定の期間にわたって、地表面又は地下のドリップラインから液体施用すること ) によって、実施することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式 ( I ) で表される化合物 ( 例えば、粒剤として ) を計量して湛水された水田に供給することによっても、実施することができる。 20

#### 【 0 2 0 4 】

#### デジタル技術

本発明の化合物は、モデルと組み合わせて、例えば、場所特異的作物管理、サテライト農業、精密農業 ( precision farming ) 又は精密農業 ( precision agriculture ) のためのコンピュータプログラムに組み込まれたモデルと組み合わせて、使用することができる。そのようなモデルは、収益性、持続可能性及び環境保護を最適化する目的で、土壌、天候、作物 ( 例えば、種類、生育段階、植物の健康状態 )、雑草 ( 例えば、種類、生育段階 )、病害、害虫、栄養素、水、水分、バイオマス、衛星データ、収穫量などのさまざまなソースからのデータを用いて、農業現場の場所特異的管理をサポートする。特に、そのようなモデルは、農学的な決定を最適化するのに、農業施用の精度を制御するのに、及び、実施した作業を記録するのに、役立つ。 30

#### 【 0 2 0 5 】

一例として、あるモデルが、害虫の発生をモデル化し、作物植物に本発明の化合物を施用することが推奨される閾値に達したと計算される場合、適切な投与計画に従って、本発明の化合物を作物植物に施用することができる。

#### 【 0 2 0 6 】

農学モデルを含んでいる市販のシステムとしては、例えば、The Climate Corporation製のFieldScripts™、BASF製のXarvio™、John Deere製のAGLogic™などがある。

#### 【 0 2 0 7 】

本発明の化合物は、農場車両 ( 例えば、トラクター、ロボット、ヘリコプター、飛行機 50

、無人航空機（UAV）、例えば、ドローンなど）に取り付けられた又はその中に収容された、スポット散布装置又は精密散布装置などのコンピューター化された散布装置と組み合わせて使用することも可能である。そのような装置は、通常、入力センサー（例えば、カメラなど）及び処理装置（これは、入力データを解析するように構成されており、及び、その入力データの解析に基づいて、作物植物（それぞれ、雑草）に本発明の化合物を特定の正確な方法で施用する決定を提供するように構成されている）を含んでいる。そのようなコンピューター化された散布装置の使用は、通常、記録されたデータを定位するための及び農場車両を誘導又は制御するための位置システム（例えば、GPS受信機）、情報を分かりやすい地図上に表すための地理情報システム（GIS）、並びに、散布などの必要な農作業を実行するための適切な農場車両も必要とする。

10

#### 【0208】

一例として、カメラで取得した画像から害虫を検出することができる。一例として、その害虫は、前記画像に基づいて、識別及び/又は分類することができる。そのような識別及び/又は分類では、画像処理アルゴリズムを使用することができる。そのような画像処理アルゴリズムは、機械学習アルゴリズム、例えば、学習済みニューラルネットワーク（trained neural network）、決定木などを利用することができる。及び、人工知能アルゴリズムを利用することができる。このようにして、本明細書中に記載されている化合物は、必要な場所のみ施用することができる。

#### 【0209】

##### 種子の処理

植物の種子を処理することによる害虫の防除は、長い間知られており、継続的に改良が加えられている。しかしながら、種子の処理には、必ずしも満足のいくように解決することができるわけではない一連の問題が伴っている。かくして、植物の貯蔵中、播種後又は出芽後に殺有害生物剤を追加で施用することを不要とするか又は少なくとも著しく低減させるような、種子及び発芽中の植物を保護する方法を開発することは望ましい。さらに、使用する活性化合物によって植物自体に損傷を引き起こすことなく、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物が最適に保護されるように、使用する活性化合物の量を最適化することも望ましい。特に、種子を処理する方法では、最少量の殺有害生物剤を使用して種子の最適な保護を達成し、及び、さらに、発芽中の植物の最適な保護も達成するために、害虫抵抗性トランスジェニック植物又は害虫耐性トランスジェニック植物の内因性の殺虫特性又は殺線虫特性も考慮に入れるべきである。

20

30

#### 【0210】

従って、本発明は、特に、害虫による攻撃から種子及び発芽中の植物を保護する方法にも関し、ここで、該方法は、当該種子を式（I）で表される化合物のうちの1種類で処理することによる。種子及び発芽中の植物を害虫による攻撃から保護するための本発明の方法は、さらに、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、1回の操作で同時に又は順次に処理するような方法も包含する。それは、さらにまた、該種子を、式（I）で表される化合物と混合成分によって、異なる時点で処理するような方法も包含する。

#### 【0211】

本発明は、さらに、種子及びその種子から生じた植物を害虫に対して保護するために種子を処理するための、式（I）で表される化合物の使用にも関する。

40

#### 【0212】

さらに、本発明は、害虫に対して保護されるように、本発明による式（I）で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（I）で表される化合物と混合成分によって異なる時点で処理された種子にも関する。式（I）で表される化合物と混合成分によって異なる時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（I）で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は

50

、さらにまた、式（I）で表される化合物と混合成分が被膜の成分として又は被膜に加えられたさらなる1つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

【0213】

さらに、本発明は、式（I）で表される化合物で処理された後で、埃による種子の摩耗を防止するために、フィルムコーティングプロセスに付される種子にも関する。

【0214】

式（I）で表される浸透移行的に作用する化合物の場合の有利な点の1つは、種子を処理することによって、害虫に対して、その種子自体が保護されるのみではなく、その種子から生じる植物も出芽後に保護されるという事実である。このようにして、播種時又は播種後間もなくに作物を直接処理する手間を省くことができる。

10

【0215】

式（I）で表される化合物で種子を処理することによって、処理された種子の発芽及び出芽が増進され得るということも、さらなる有利な点であると見なされるべきである。

【0216】

式（I）で表される化合物を、特に、トランスジェニック種子に対しても使用することが可能であるということも、有利であると考えられる。

【0217】

さらに、式（I）で表される化合物は、シグナル伝達技術の組成物又は化合物と組合せて使用することも可能であり、それによって、共生生物（例えば、根粒菌、菌根菌及び/又は内部寄生性の細菌若しくは菌類）によるコロニー形成が良好になり、及び/又は、窒素固定が最適化される。

20

【0218】

式（I）で表される化合物は、農業において、温室内で、森林で又は園芸において使用される全ての植物品種の種子を保護するのに適している。特に、これは、穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、アワ及びエンバク）、トウモロコシ、ワタ、ダイズ、イネ、ジャガイモ、ヒマワリ、コーヒー、タバコ、カノラ、なたね、ビート（例えば、テンサイ及び飼料用ビート）、ラッカセイ、野菜（例えば、トマト、キュウリ、インゲンマメ（bean）、アブラナ科野菜、タマネギ及びレタス）、果実植物、芝生及び観賞植物の種子である。穀類（例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ及びエンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、カノラ、なたね、野菜類及びイネの種子を処理することは、特に重要である。

30

【0219】

既に上記で記載したように、式（I）で表される化合物によるトランスジェニック種子の処理も、特に重要である。これは、特に、殺虫特性及び/又は殺線虫特性を有するポリペプチドの発現を制御する少なくとも1種類の異種遺伝子を概して含んでいる植物の種子である。トランスジェニック種子内のこれらの異種遺伝子は、バシルス（*Bacillus*）種、リゾビウム（*Rhizobium*）種、プセウドモナス（*Pseudomonas*）種、セラチア（*Serratia*）種、トリコデルマ（*Trichoderma*）種、クラビバクテル（*Clavibacter*）種、グロムス（*Glomus*）種又はグリオクラジウム（*Gliocladium*）種などの微生物に由来し得る。本発明は、バシルス属種（*Bacillus* sp.）に由来する少なくとも1種類の異種遺伝子を含んでいるトランスジェニック種子を処理するのに特に適している。それは、特に好ましくは、バシルス・ツリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）に由来する異種遺伝子である。

40

【0220】

本発明に関連して、式（I）で表される化合物は、種子に対して施用する。好ましくは、該種子は、処理中の損傷を回避するのに十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。一般に使用される種子は、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種

50

子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子（例えば、プライミング）を使用することもできる。イネの種子の場合、イネ胚の特定の段階（鳩胸段階）に達するまで、例えば水中に、浸漬させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が刺激され、及び、出芽がより均一になる。

【0221】

種子を処理する場合、種子の発芽が悪影響を受けないように、又は、生じた植物が損傷を受けないように、種子に施用する式（I）で表される化合物の量及び/又はさらなる添加剤の量を選択することに対して、一般的に注意しなくてはならない。このことは、とりわけ、特定の施用量で薬害作用を示し得る活性化合物の場合に、確実に実施しなければならない。

10

【0222】

一般に、式（I）で表される化合物は、適切な製剤に含ませて種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤及び方法は、当業者には知られている。

【0223】

式（I）で表される化合物は、慣習的な種子粉衣製剤、例えば、溶液剤、エマルジョン剤、懸濁液剤、粉末剤、泡剤、スラリー剤又は種子用の別のコーティング組成物などに変換させることが可能であり、及び、さらに、ULV製剤に変換させることも可能である。

【0224】

これらの製剤は、既知方法で、式（I）で表される化合物を、慣習的な添加剤、例えば、慣習的な増量剤、及び、さらに、溶媒又は希釈剤、着色剤、湿潤剤、分散剤、乳化剤、消泡剤、防腐剤、第2の増粘剤、粘着剤、ジベレリン類などと混合させ、及び、さらに、水と混合させることによって、調製する。

20

【0225】

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

【0226】

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

30

【0227】

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

40

【0228】

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

【0229】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐

50

剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げることができる。

【0230】

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

【0231】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の中に存在させることができる粘着剤は、種子粉衣剤中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースを好ましいものとして挙げることができる。

【0232】

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

【0233】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤は、広い範囲のさまざまな種類の種子を処理するために、直接的に使用することができるか、又は、予め水で希釈したあとで使用することができる。例えば、濃厚剤(concentrate)又は水で希釈することによって濃厚剤から得ることができる調製物は、穀類、例えば、コムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク及びライコムギなどの種子を粉衣するのに使用することが可能であり、並びに、さらに、トウモロコシ、イネ、ナタネ、エンドウマメ、インゲンマメ、ワタ、ヒマワリ、ダイズ及びビートの種子を粉衣するのに使用することも可能であり、又は、広い範囲のさまざまな野菜の種子を粉衣するのに使用することが可能である。本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又はそれらの希釈された使用形態は、トランスジェニック植物の種子を粉衣するのにも使用することが可能である。

【0234】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤又はその種子粉衣剤から水を添加することによって調製された使用形態を用いて種子を処理する場合、種子粉衣のために慣習的に使用可能な全ての混合装置が有用である。具体的には、種子粉衣における手順は、種子を混合機(これは、バッチ式又は連続的に作動される)の中に入れること、所望される特定量の種子粉衣剤を、そのまま添加するか又は予め水で希釈したあとで添加すること、及び、該剤が当該種子の表面に均質に分配されるまで全てを混合させることである。適切な場合には、続いて乾燥工程を行う。

【0235】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣剤の施用量は、比較的広い範囲内で変えることができる。それは、当該剤中の式(I)で表される化合物の特定の含有量及び当該種子に左右される。式(I)で表される化合物の施用量は、一般に、種子1kg当たり0.001~50gであり、好ましくは、種子1kg当たり0.01~15gである。

【0236】

動物衛生

動物衛生の分野、即ち、獣医学の分野においては、式(I)で表される化合物は、動物寄生生物に対して、特に、外部寄生生物又は内部寄生生物に対して、活性を示す。用語「内部寄生生物」は、特に、蠕虫類及び原生動物(例えば、コクシジウム)を包含する。外部寄生生物は、典型的には、及び、好ましくは、節足動物、特に、昆虫類又はダニ類であ

10

20

30

40

50



る。

【0237】

獣医学の分野において、温血動物に対する毒性が好ましい程度である式(I)で表される化合物は、動物育種及び畜産業において、家畜動物、育種用動物、動物園の動物、研究室の動物、実験動物及び家庭内動物(domestic animal)において発生する寄生生物を防除するのに適している。それらは、該寄生生物の全ての発育段階又は特定の発育段階に対して活性を示す。

【0238】

農業用家畜としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ヒツジ、ヤギ、ウマ、ロバ、ラクダ、スイギュウ、ウサギ、トナカイ、ダマジカ、並びに、特に、ウシ及びブタ；又は、家禽類、例えば、シチメンチョウ、アヒル、ガチョウ、及び、特に、ニワトリ；又は、魚類若しくは甲殻類の動物、例えば、水産養殖における魚類若しくは甲殻類の動物；又は、場合により、昆虫類、例えば、ミツバチ類。

10

【0239】

家庭内動物としては、例えば、以下のものを挙げることができる：哺乳動物、例えば、ハムスター、テンジクネズミ、ラット、マウス、チンチラ、フェレット、及び、特に、イヌ、ネコ；籠の鳥；爬虫類；両生類、又は、水槽の魚。

【0240】

特定の実施形態では、式(I)で表される化合物は、哺乳動物に対して投与される。

【0241】

特定の別の実施形態では、式(I)で表される化合物は、鳥類に対して、即ち、籠の鳥、又は、特に、家禽類に対して、投与される。

20

【0242】

動物寄生生物を防除するために式(I)で表される化合物を使用することによって、上記動物の病気、死亡事例を低減又は予防すること、及び、生産性(performance)(肉、ミルク、羊毛、皮革、卵、蜂蜜などの場合)の低下を低減又は予防することが意図され、その結果、より経済的で且つより容易な動物飼育が可能となり、及び、より良好な動物の健康状態が達成され得る。

【0243】

用語「防除する(control)」又は「防除する(controlling)」は、本明細書中で動物衛生の分野に関連して使用される場合、式(I)で表される化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がないレベルにまで低減させることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明中で使用される場合、式(I)で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すこと、その成長を阻害すること、又は、その増殖を阻害することにおいて有効であることを意味する。

30

【0244】

代表的な節足動物としては、限定するものではないが、以下のものを挙げることができる：

アノプルス目(Anoplurida)の、例えば、ハエマトピヌス属種(Haematopinus spp.)、リノグナツス属種(Linognathus spp.)、ペジクルス属種(Pediculus spp.)、プチルス属種(Phtirus spp.)、ソレノポテス属種(Solenopotes spp.)；

40

マロファギダ目(Mallophagida)並びにアムブリセリナ亜目(Amblycerina)及びイスクノセリナ亜目(Ichnocerina)の、例えば、ボビコラ属種(Bovicola spp.)、ダマリナ属種(Damalina spp.)、フェリコラ属種(Felicola spp.)；レピケントロン属種(Lepikentron spp.)、メノポン属種(Menopon spp.)、トリコデクテス属種(Trichodectes spp.)、トリメノポン属種(Trimenopon spp.)、トリノトン属種(Trinoton spp.)、ウエルネキエラ属

50

種 (*Werneckiella* spp.) ;

双翅目 (*Diptera*) 並びにネマトセリナ亜目 (*Nematocerina*) 及び  
 ブラキセリナ亜目 (*Brachycerina*) の、例えば、アエデス属種 (*Aedes*  
*spp.*)、アノフェレス属種 (*Anopheles* spp.)、アチロツス属種 (*A*  
*tylotus* spp.)、ブラウラ属種 (*Braula* spp.)、カリホラ属種  
 (*Calliphora* spp.)、クリソミア属種 (*Chrysomyia* sp  
 p.)、クリソプス属種 (*Chrysops* spp.)、クレキス属種 (*Culex*  
 spp.)、クリコイデス属種 (*Culicoides* spp.)、エウシムリウム属  
 種 (*Eusimulium* spp.)、ファンニア属種 (*Fannia* spp.)、  
 ガステロフィルス属種 (*Gasterophilus* spp.)、グロシナ属種 (*Gl*  
*ossina* spp.)、ハエマトビア属種 (*Haematobia* spp.)、ハ  
 エマトポタ属種 (*Haematopota* spp.)、ヒポボスカ属種 (*Hippob*  
*osca* spp.)、ヒボミトラ属種 (*Hybomitra* spp.)、ヒドロタエ  
 ア属種 (*Hydrotaea* spp.)、ヒポデルマ属種 (*Hypoderma* sp  
 p.)、リポプテナ属種 (*Lipoptena* spp.)、ルシリア属種 (*Lucil*  
*ia* spp.)、ルトゾミヤ属種 (*Lutzomyia* spp.)、メロファグス  
 属種 (*Melophagus* spp.)、モレリア属種 (*Morellia* spp.  
 )、ムスカ属種 (*Musca* spp.)、オダグミア属種 (*Odagmia* spp.  
 )、オエストルス属種 (*Oestrus* spp.)、フィリポミア属種 (*Phili*  
*pomyia* spp.)、フレボトムス属種 (*Phlebotomus* spp.)、  
 リノエストルス属種 (*Rhinoestrus* spp.)、サルコファガ属種 (*Sar*  
*cophaga* spp.)、シムリウム属種 (*Simulium* spp.)、ストモ  
 キス属種 (*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種 (*Tabanus* spp.)  
 、チブラ属種 (*Tipula* spp.)、ウィルヘルミア属種 (*Wilhelmia*  
 spp.)、ウォールファールチア属種 (*Wohlfahrtia* spp.) ;

ノミ目 (*Siphonapterida*) の、例えば、セラトフィルス属種 (*Cera*  
*tophyllus* spp.)、クテノセファリデス属種 (*Ctenocephali*  
*des* spp.)、プレキス属種 (*Pulex* spp.)、ツンガ属種 (*Tunga*  
 spp.)、キセノプシラ属種 (*Xenopsylla* spp.) ;

ヘテロプテリダ目 (*Heteropterida*) の、例えば、シメキス属種 (*Cim*  
*ex* spp.)、パンストロンギルス属種 (*Panstrongylus* spp.)  
 、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma*  
 spp.) ; 及び、ゴキブリ目 (*Blattarida*) の有害害虫及び衛生害虫。

#### 【0245】

さらに、節足動物の中で、限定するものではないが、例として以下のダニ類も挙げるこ  
 とができる :

ダニ亜綱 (*Acarina*) 及びメタスティグマ目 (*Metastig*  
*mata*) の、例えば、ヒメダニ科 (*argasidae*) の、例えば、アルガス属種 (*Argas*  
*spp.*)、オルニトドルス属種 (*Ornithodoros* spp.)  
 、オトビウス属種 (*Otobius* spp.)、マダニ科 (*Ixodidae*) の、例  
 えば、アンブリオンマ属種 (*Amblyomma* spp.)、デルマセントル属種 (*D*  
*ermacentor* spp.)、ハエマフィサリス属種 (*Haemaphysalis*  
 spp.)、ヒアロンマ属種 (*Hyalomma* spp.)、イクソデス属種 (*I*  
*xodes* spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (*Rhipiceph*  
*alus* (*Boophilus*) spp.)、リピセファルス属種 (*Rhipiceph*  
*alus* spp. (多宿主ダニの原属) ; メソスティグマ目 (*mesostigma*  
*ta*) の、例えば、デルマニスス属種 (*Dermanyssus* spp.)、オルニト  
 ニスス属種 (*Ornithonyssus* spp.)、プネウモニスス属種 (*Pneu*  
*monyssus* spp.)、ライリエチア属種 (*Raillietia* spp.)  
 、ステルノストマ属種 (*Sternostoma* spp.)、トロピラエラプス属種 (  
 50

Tropilaelaps spp.)、バロア属種 (Varroa spp.) ; アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、デモデクス属種 (Demodex spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、ネオトロムビクラ属種 (Neotrombicula spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.) ; 及び、アカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカルス属種 (Acarus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、シトジテス属種 (Cytodites spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、トリキサカルス属種 (Trixacarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)。【0246】

代表的な寄生性原生動物としては、限定するものではないが、以下のものを挙げることもできる :

鞭毛虫亜門 (Mastigophora) (鞭毛虫類 (Flagellata))、例えば :

メタモナーダ (Metamonada) : ヒゲハラムシ目 (Diplomonadida) の、例えば、ギアルジア属種 (Giardia spp.)、スピロヌクレウス属種 (Spiroucleus spp.) ;

バラバサラ (Parabasala) : トリコモナス目 (Trichomonadida) の、例えば、ヒストモナス属種 (Histomonas spp.)、ペントトリコモナス属種 (Pentatrachomonas spp.)、テトラトリコモナス属種 (Tetratrachomonas spp.)、トリコモナス属種 (Trichomonas spp.)、トリトリコモナス属種 (Tritrachimonas spp.) ;

ユーグレノゾア (Euglenozoa) : トリパノソーマ目 (Trypanosomatida) の、例えば、レイスマニア属種 (Leishmania spp.)、トリパノソーマ属種 (Trypanosoma spp.) ;

有毛根足虫亜門 (Sarcomasstigophora) (根足虫類 (Rhizopoda))、例えば、エントアメーバ科 (Entamoebidae)、例えば、エントモエバ属種 (Entamoeba spp.)、セントロアメーバ科 (Centramoebidae)、例えば、アカンタモエバ属種 (Acanthamoeba sp.)、ユーアメーバ科 (Euamoebidae)、例えば、ハルトマネラ属種 (Hartmannella sp.) ;

アルベオラータ (Alveolata)、例えば、アピコンプレックス門 (Apicomplexa) (孢子虫類 (Sporozoa))、例えば、クリプトスポリジウム属種 (Cryptosporidium spp.) ; エイメリア目 (Eimeriida) の、例えば、ベスノイチア属種 (Besnoitia spp.)、シストイソスポラ属種 (Cystoisospora spp.)、エイメリア属種 (Eimeria spp.)、ハモンジア属種 (Hammondia spp.)、イソスポラ属種 (Isospora spp.)、ネオスポラ属種 (Neospora spp.)、サルコシスチス属種 (Sarcocystis spp.)、トキシプラズマ属種 (Toxoplasma spp.) ; アデレイダ目 (Adelieida) の、例えば、ヘパトゾオン属

種 (*Hepatozoon* spp.)、クロシエラ属不 (*Klossiella* spp.) ; ハエモスポリダ目 (*Haemosporida*) の、例えば、レウコシトゾン属種 (*Leucocytozoon* spp.)、プラズモジウム属種 (*Plasmodium* spp.) ; ピロプラスミダ目 (*Piroplasmida*) の、例えば、バベシア属種 (*Babesia* spp.)、シリオホラ属種 (*Ciliophora* spp.)、エキノゾオン属種 (*Echinozoon* spp.)、テイレリア属種 (*Theileria* spp.) ; ベシプリフェリダ目 (*Vesibuliferida*) の、例えば、バランチジウム属種 (*Balantidium* spp.)、ブクストネラ属種 (*Buxtonella* spp.) ;

微孢子虫亜門 (*Microspora*)、例えば、エンセファリトゾオン属種 (*Enccephalitozoon* spp.)、エンテロシトゾオン属種 (*Enterocytozoon* spp.)、グロビジウム属種 (*Globidium* spp.)、ノセマ属種 (*Nosema* spp.)、及び、さらに、例えば、ミキソゾア属種 (*Myxozoa* spp.)。 10

【0247】

ヒト又は動物に対して病原性を示す蠕虫類としては、例えば、鉤頭動物門 (*acanthocephala*)、線形動物、舌形動物門 (*pentastoma*) 及び扁形動物門 (*platyhelmintha*) [例えば、単生類 (*monogenea*)、条虫類 (*cestodes*) 及び吸虫類 (*trematodes*)] などがある。

【0248】

代表的な蠕虫類としては、限定するものではないが、以下のものを挙げる事ができる :

単生綱 (*Monogenea*) : 例えば : ダクチロギルス属種 (*Dactylogyus* spp.)、ギロダクチルス属種 (*Gyrodactylus* spp.)、ミクロボトリウム属種 (*Microbothrium* spp.)、ポリストマ属種 (*Polystoma* spp.)、トログロセファルス属種 (*Troglocephalus* spp.) ;

条虫類 (*Cestodes*) : ギョウジョウチュウ目 (*Pseudophyllidea*) の、例えば : ボトリジウム属種 (*Bothridium* spp.)、ジフィロボトリウム属種 (*Diphyllobothrium* spp.)、ジフロゴノポルス属種 (*Diplogonoporus* spp.)、イクチオボトリウム属種 (*Ichthyobothrium* spp.)、リグラ属種 (*Ligula* spp.)、シストセファルス属種 (*Schistocephalus* spp.)、スピロメトラ属種 (*Spirometra* spp.) ; 30

エンヨウジョウチュウ目 (*Cyclophyllyida*) の、例えば : アンジラ属種 (*Andyra* spp.)、アノプロセファラ属種 (*Anoplocephala* spp.)、アビテリナ属種 (*Avitellina* spp.)、ベルチエラ属種 (*Bertiella* spp.)、シトタエニア属種 (*Cittotaenia* spp.)、ダバイネア属種 (*Davainea* spp.)、ジオルキス属種 (*Diorchis* spp.)、ジプロピリジウム属種 (*Diplopylidium* spp.)、ジピリジウム属種 (*Dipylidium* spp.)、エキノコックス属種 (*Echinococcus* spp.)、エキノコチレ属種 (*Echinocotyle* spp.)、エキノレピス属種 (*Echinolepis* spp.)、ヒダチゲラ属種 (*Hydatigera* spp.)、ヒメノレピス属種 (*Hymenolepis* spp.)、ジョイエウキシエラ属種 (*Joyeuxiella* spp.)、メソセストイデス属種 (*Mesocestoides* spp.)、モニエジア属種 (*Moniezia* spp.)、パラノプロセファラ属種 (*Paranoplocephala* spp.)、ライリエチナ属種 (*Raillietina* spp.)、スチレシア属種 (*Stilesia* spp.)、タエニア属種 (*Taenia* spp.)、チサニエジア属種 (*Thysaniezia* spp.)、チサノソマ属種 (*Thysanosoma* spp.) ; 40 50

吸虫類 (Trematodes) : 二生亜綱 (Digenea) の、例えば： アウストロビルハルジア属種 (Austrobilharzia spp.)、ブラキライマ属種 (Brachylaima spp.)、カリコホロン属種 (Calicophoron spp.)、カタトロピス属種 (Catatropis spp.)、クロノルキス属種 (Clonorchis spp.)、コリリクム属種 (Collyriclum spp.)、コチロホロン属種 (Cotylophoron spp.)、シクロコエルム属種 (Cyclocoelum spp.)、ジクロコエリウム属種 (Dicrocoelium spp.)、ジプロストムム属種 (Diplostomum spp.)、エキノカスムス属種 (Echinochasmus spp.)、エキノパリフィウム属種 (Echinoparyphium spp.)、エキノストマ属種 (Echinostoma spp.)、エウリトレマ属種 (Eurytrema spp.)、ファシオラ属種 (Fasciola spp.)、ファシオロイデス属種 (Fasciolides spp.)、ファシオロプシス属種 (Fasciolopsis spp.)、フィスコエデリウス属種 (Fischöderius spp.)、ガストロチラクス属種 (Gastrothylacus spp.)、ギガントビルハルジア属種 (Gigantobilharzia spp.)、ギガントコチレ属種 (Gigantocotyle spp.)、ヘテロフィエス属種 (Heterophyes spp.)、ヒポデラエウム属種 (Hypoderaeum spp.)、レウコクロリジウム属種 (Leucochloridium spp.)、メタゴニムス属種 (Metagonimus spp.)、メトルキス属種 (Metorchis spp.)、ナノフィエツス属種 (Nanophyetus spp.)、ノトコチルス属種 (Notocotylus spp.)、オピストルキス属種 (Opisthorchis spp.)、オルニトビルハルジア属種 (Ornithobilharzia spp.)、パラゴニムス属種 (Paragonimus spp.)、パラムフィストムム属種 (Paramphistomum spp.)、ブラギオルキス属種 (Plagiorchis spp.)、ポストジプロストムム属種 (Posthodiplostomum spp.)、プロストゴニムス属種 (Prosthogonimus spp.)、シストソマ属種 (Schistosoma spp.)、トリコビルハルジア属種 (Trichobilharzia spp.)、トログロトレマ属種 (Troglootrema spp.)、チフロコエルム属種 (Typhlocoelum spp.) ;

線虫類 (Nematodes) : ベンチュウ目 (Trichinellida) の、例えば： カピラリア属種 (Capillaria spp.)、エウコレウス属種 (Eucoleus spp.)、パラカピラリア属種 (Paracapillaria spp.)、トリキネラ属種 (Trichinella spp.)、トリコモソイデス属種 (Trichomosoides spp.)、トリクリス属種 (Trichuris spp.) ;

クキセンチュウ目 (Tylenchida) の、例えば： ミクロネマ属種 (Micronema spp.)、パラストロンギロイデス属種 (Parastrongyloides spp.)、ストロンギロイデス属種 (Strongyloides spp.) ;

カンセンチュウ目 (Rhabditina) の、例えば： アエルロストロンギルス属種 (Aelurostrongylus spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、アンシロストマ属種 (Ancylostoma spp.)、アンギオストロンギルス属種 (Angiostrongylus spp.)、ブロンコネマ属種 (Bronchonema spp.)、ブノストムム属種 (Bunostomum spp.)、カベルチア属種 (Chabertia spp.)、コオペリア属種 (Cooperia spp.)、コオペリオイデス属種 (Cooperioides spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、シアトストムム属種 (Cyathostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyclococercus spp.)、シクロドントストムム属種 (Cyclodontostomum

spp.)、シクロコセルクス属種 (*Cylicocyclus* spp.)、シリコス  
 テファヌス属種 (*Cylicostephanus* spp.)、シリンドロファリンキ  
 ス属種 (*Cylindropharynx* spp.)、シストカウルス属種 (*Cysto*  
*caulus* spp.)、ジクチオカウルス属種 (*Dictyocaulus* sp  
 p.)、エラホストロンギルス属種 (*Elaphostrongylus* spp.)、  
 フィラロイデス属種 (*Filaroides* spp.)、グロボセファルス属種 (*Gl*  
*obocephalus* spp.)、グラフィジウム属種 (*Graphidium* s  
 pp.)、ギアロセファルス属種 (*Gyalocephalus* spp.)、ハエモン  
 クス属種 (*Haemonchus* spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (*Heligm*  
*osomoides* spp.)、ヒオストロンギルス属種 (*Hyostrongylu*  
*s* spp.)、マルシャラギア属種 (*Marshallagia* spp.)、メタス  
 トロンギルス属種 (*Metastrongylus* spp.)、ムエレリウス属種 (*M*  
*uellerius* spp.)、ネカトル属種 (*Necator* spp.)、ネマト  
 ジルス属種 (*Nematodirus* spp.)、ネオストロンギルス属種 (*Neos*  
*trongylus* spp.)、ニッポストロンギルス属種 (*Nippostrong*  
*ylus* spp.)、オベリスコイデス属種 (*Obeliscoides* spp.)  
 、オエソファゴドンツス属種 (*Oesophagodontus* spp.)、オエソフ  
 ザゴストムム属種 (*Oesophagostomum* spp.)、オルラヌス属種 (*O*  
*llulanus* spp.)；オルニトストロンギルス属種 (*Ornithostro*  
*ngylus* spp.)、オスレルス属種 (*Oslerus* spp.)、オステルタ  
 ギア属種 (*Ostertagia* spp.)、パラコオペリア属種 (*Paracoop*  
*eria* spp.)、パラクレノソマ属種 (*Paracrenosoma* spp.)  
 、パラフィラロイデス属種 (*Parafilaroides* spp.)、パレラホスト  
 ロンギルス属種 (*Parelaphostrongylus* spp.)、プネウモカウ  
 ルス属種 (*Pneumocaulus* spp.)、プネウモストロンギルス属種 (*Pn*  
*eumostrongylus* spp.)、ポテリオストムム属種 (*Poterios*  
*tomum* spp.)、プロトストロンギルス属種 (*Protostrongylus*  
*spp.*)、スピコカウルス属種 (*Spicocaulus* spp.)、ステファヌル  
 ス属種 (*Stephanurus* spp.)、ストロンギルス属種 (*Strongyl*  
*us* spp.)、シンガムス属種 (*Syngamus* spp.)、テラドルサギア属  
 種 (*Teladorsagia* spp.)、トリコネマ属種 (*Trichonema*  
 spp.)、トリコストロンギルス属種 (*Trichostrongylus* spp.  
 )、トリオドントホルス属種 (*Triodontophorus* spp.)、トログロ  
 ストロンギルス属種 (*Trogloststrongylus* spp.)、ウンシナリア属  
 種 (*Uncinaria* spp.)；  
 センビセンチュウ目 (*Spirurida*) の、例えば： アカントケイロネマ属種 (*A*  
*canthocheilonema* spp.)、アニサキス属種 (*Anisakis*  
 spp.)、アスカリジア属種 (*Ascaridia* spp.)；アスカリス属種 (*A*  
*scaris* spp.)、アスカロプス属種 (*Ascarops* spp.)、アスピ  
 クルリス属種 (*Aspiculuris* spp.)、バイリサスカリス属種 (*Bayl*  
*isascaris* spp.)、ブルギア属種 (*Brugia* spp.)、セルコピ  
 チフィラリア属種 (*Cercopithifilaria* spp.)、クラシカウダ属  
 種 (*Crassicauda* spp.)、ジペタロネマ属種 (*Dipetalonem*  
*a* spp.)、ジロフィラリア属種 (*Dirofilaria* spp.)、ドラクン  
 クルス属種 (*Dracunculus* spp.)；ドラスキア属種 (*Draschia*  
 spp.)、エンテロビウス属種 (*Enterobius* spp.)、フィラリア属種  
 (*Filaria* spp.)、グナトストマ属種 (*Gnathostoma* spp.  
 )、ゴンギロネマ属種 (*Gongylonema* spp.)、ハプロネマ属種 (*Hab*  
*ronema* spp.)、ヘテラキス属種 (*Heterakis* spp.)；リトモ  
 ソイデス属種 (*Litomosoides* spp.)、ロア属種 (*Loa* spp.)

10

20

30

40

50

、オンコセルカ属種 (*Onchocerca* spp.)、オキシウリス属種 (*Oxyuris* spp.)、パラプロネマ属種 (*Parabronema* spp.)、パラフィラリア属種 (*Parafilaria* spp.)、パラスカリス属種 (*Parascaris* spp.)、パスルルス属種 (*Passalurus* spp.)、フィサロプテラ属種 (*Physaloptera* spp.)、プロブストマイリア属種 (*Probstmayria* spp.)、プセウドフィラリア属種 (*Pseudofilaria* spp.)、セタリア属種 (*Setaria* spp.)、スクジュラビネマ属種 (*Skjrabinema* spp.)、スピロセルカ属種 (*Spirocerca* spp.)、ステファノフィラリア属種 (*Stephanofilaria* spp.)、ストロンギルリス (*Strongyluris* spp.)、シファシア属種 (*Syphacia* spp.)、テラジア属種 (*Thelazia* spp.)、トキサスカリス属種 (*Toxascaris* spp.)、トキソカラ属種 (*Toxocara* spp.)、ウケレリア属種 (*Wuchereria* spp.) ;

鉤頭動物門 (*Acantoccephala*) : ダイコウトウチュウ目 (*Oligacanthorhynchida*) の、例えば： マクラカントリンクス属種 (*Macracanthorhynchus* spp.)、プロステノルキス属種 (*Prosthenorchis* spp.) ; サジョウコウトウチュウ目 (*Moniliformida*) の、例えば： モニリホルミス属種 (*Moniliformis* spp.) ;

ポリモルフス目 (*Polymorphida*) の、例えば： フィリコリス属種 (*Filicollis* spp.) ; コウトウチュウ目 (*Echinorhynchida*) の、例えば、アカントセファルス属種 (*Acanthocephalus* spp.)、エキノリンクス属種 (*Echinorhynchus* spp.)、レプトリンコイデス属種 (*Leptorhynchoides* spp.) ;

舌形動物門 (*Pentastoma*) : ポロケファルス目 (*Porocephalida*) の、例えば、リングアツラ属種 (*Linguatula* spp.)。

#### 【0249】

獣医学の分野において、及び、動物飼育において、式 (I) で表される化合物の投与は、当技術分野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸的に、非経口的に、経皮的に又は経鼻的に実施する。投与は、予防的に、感染後防御的に (*methaphylactically*) 又は治療的に実施することができる。

#### 【0250】

かくして、本発明の1実施形態は、薬物として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

#### 【0251】

別の態様は、坑内部寄生生物剤 (*antiendoparasitica agent*) として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

#### 【0252】

別の特定の態様は、抗蠕虫剤 (*anthelmintic agent*) として使用するための、さらに特定のには、殺線虫剤、殺扁形動物剤 (*platyhelminthi-40*  
*cidal agent*)、殺鉤頭動物剤 (*acanthocephalida agent*) 又は殺舌形動物剤 (*pentastomida agent*) として使用するための、式 (I) で表される化合物に関する。

#### 【0253】

別の特定の態様は、坑原生動物剤 (*antiprotozoal agent*) として使用するための式 (I) で表される化合物に関する。

#### 【0254】

別の態様は、坑外部寄生生物剤 (*antiektoparasitica agent*) として使用するための、特に、殺節足動物剤 (*arthropodida agent*) として使用するための、さらに特定のには、殺虫剤又は殺ダニ剤として使用す 50

るための、式 ( I ) で表される化合物に関する。

【 0 2 5 5 】

本発明のさらなる態様は、有効量の式 ( I ) で表される少なくとも 1 種類の化合物及び以下のもののうちの少なくとも 1 種類を含んでいる獣医学的製剤である： 薬学的に許容され得る賦形剤 (例えば、固体希釈剤又は液体希釈剤)、薬学的に許容され得る補助剤 (例えば、界面活性剤)、特に、獣医学的製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、及び/又は、獣医学的製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤。

【 0 2 5 6 】

本発明の関連する態様は、本明細書中に記載されている獣医学的製剤を調製する方法であり、ここで、該方法は、式 ( I ) で表される少なくとも 1 種類の化合物を、薬学的に許容され得る賦形剤及び/又は補助剤 (特に、獣医学的製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る賦形剤、及び/又は、獣医学的製剤において慣習的に使用される薬学的に許容され得る補助剤) と混合させる段階を含んでいる。

【 0 2 5 7 】

本発明の別の特定の態様は、上記態様による殺外部寄生生物薬製剤 ( e c t o p a r a s i t i c i d a l f o r m u l a t i o n s ) 及び殺内部寄生生物薬製剤 ( e n d o p a r a s i t i c i d a l f o r m u l a t i o n s ) の群から選択される獣医学的製剤、さらに特定のには、駆虫薬製剤、抗原生動物薬製剤 ( a n t i p r o t o z o a l f o r m u l a t i o n s ) 及び殺節足動物薬製剤 ( a r t h r o p o d i c i d a l f o r m u l a t i o n s ) の群から選択される獣医学的製剤、一層さらに特定のには、殺線虫薬製剤、殺扁形動物薬製剤 ( p l a t y h e l m i n t h i c i d a l f o r m u l a t i o n s ) 、殺鉤頭動物薬製剤 ( a c a n t h o c e p h a l i c i d a l f o r m u l a t i o n s ) 、殺舌形動物薬製剤 ( p e n t a s t o m i c i d a l f o r m u l a t i o n s ) 、殺虫薬製剤及び殺ダニ薬製剤の群から選択される獣医学的製剤、並びに、それらを調製する方法である。

【 0 2 5 8 】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、本明細書中で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物による感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物 (特に、非ヒト動物) に有効量の式 ( I ) で表される化合物を施用することによる。

【 0 2 5 9 】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、本明細書中で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物による感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物 (特に、非ヒト動物) に本明細書中で定義されている獣医学的製剤を施用することによる。

【 0 2 6 0 】

別の態様は、動物 (特に、非ヒト動物) における寄生生物感染症、特に、本明細書中で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の群から選択される寄生生物による感染症の治療における、式 ( I ) で表される化合物の使用に関する。

【 0 2 6 1 】

動物衛生又は獣医学の分野に関連して、用語「処置 ( t r e a t m e n t ) 」は、予防的処置、感染後防御的 ( m e t a p h y l a c t i c ) 処置又は治療的処置を包含する。

【 0 2 6 2 】

特定の実施形態においては、獣医学の分野に対して、式 ( I ) で表される少なくとも 1 種類の化合物と別の活性成分 (特に、殺内部寄生生物薬及び殺外部寄生生物薬) の混合物が提供される。

【 0 2 6 3 】

動物衛生の分野においては、「混合物」は、2種類の (又は、それより多い) 異なる活性成分が共有の製剤に製剤され、それによって一緒に施用されることを意味するのみでは

10

20

30

40

50



なく、それぞれの活性化合物に対して独立した製剤を含んでいる製品も意味する。従って、3種類以上の活性化合物を施用する場合、全ての活性化合物を共有の製剤に製剤することができるか、又は、全ての活性化合物を別々の製剤に製剤することが可能である；同様に、活性化合物のうちの一部と一緒に製剤し且つ活性化合物のうちの一部を別々に製剤するという混合形態も可能である。別々の製剤では、当該複数の活性化合物を別々に施用することが可能であるか、又は、連続して施用することが可能である。

【0264】

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性化合物は、既知であり、そして、例えば、「Pesticide Manual」（上記を参照されたい）に記載されているか、又は、インターネットで検索することができる（例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」）。

10

【0265】

混合相手剤として該殺外部寄生生物薬の群から選択される代表的な活性成分としては、限定するものではないが、上記において詳細に記載されている殺虫剤及び殺ダニ剤などを挙げる事ができる。使用することが可能なさらなる活性成分について、現在の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいた上記分類に従って、以下に記載する：（1）アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害薬；（2）GABA制御塩化物チャンネル遮断薬；（3）ナトリウムチャンネルモジュレーター；（4）ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）競合的モジュレーター；（5）ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリックモジュレーター；（6）グルタミン酸制御塩化物チャンネル（GluCl）アロステリックモジュレーター；（7）幼若ホルモン模倣物質；（8）種々の特定されていない（多部位）阻害薬；（9）弦音器官のモジュレーター；（10）ダニ成長阻害薬；（12）ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター；（13）プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤；（14）ニコチン作動性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬；（15）キチン生合成の阻害薬（タイプ0）；（16）キチン生合成の阻害薬（タイプ1）；（17）脱皮ディスラプター（特に、双翅目（即ち、双翅類）に対して）；（18）エクジソン受容体作動薬；（19）オクトパミン受容体作動薬；（21）ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬；（25）ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬；（20）ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬；（22）電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬；（23）アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬；（28）リアノジン受容体モジュレーター；（30）GABA制御塩化物チャンネルアロステリックモジュレーター。

20

30

【0266】

作用機序が知られていないか又は特定されていない活性化合物、例えば、フェントリファニル、フェノキサクリム、シクロブレン、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシプルレ、フルテンジン、プロモプロピレート、氷晶石（cryolite）；

【0267】

40

別のクラスの化合物：

ブタカルブ、ジメチラン、クロエトカルブ、ホスホカルブ、ピリミホス（-エチル）、パラチオン（-エチル）、メタクリホス、o-サリチル酸イソプロピル、トリクロルホン、スルプロホス、プロパホス、セブホス、ピリダチオン、プロトエート、ジクロフェンチオン、ジメトン-S-メチルスルホン、イサゾホス、シアノフェンホス、ジアリホス、カルボフェノチオン、アウトチオホス、アロムフェンピンホス（-メチル）、アジンホス（-エチル）、クロルピリホス（-エチル）、ホスメチラン、ヨードフェンホス、ジオキサベンゾホス、ホルモチオン、ホノホス、フルピラゾホス、フェンスルホチオン、エトリムホス；

有機塩素化合物、例えば、カンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル；

50

フェニルピラゾール系、例えば、アセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、バニリプロール、シサプロニル；

イソオキサゾリン系、例えば、アフォキサネル、フルララネル、ロチラネル、サロラネル；

ピラゾリル - アリールアミド系、例えば、ニコフルプロール、チゴラネル；

ピレスロイド系、例えば、(シス -、トランス -)メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルプロシトリン、フブフェンプロックス、フェンフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、RU15525、テラレトリン、シス - レスメトリン、ヘプタフルトリン、ピオエタノメトリン、ピオベルメトリン、フェンピリトリン、シス - シベルメトリン、シス - ベルメトリン、クロシトリン、シハロトリン(ラムダ -)、クロバポルトリン、又は、ハロゲン化炭素水素化合物(HCHs)；

10

ネオニコチノイド系、例えば、ニチアジン；

ジクロロメゾチアズ(dichloromezotiaz)、トリフルメゾピリム；

大環状ラクトン系、例えば、ネマデクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、モキシデクチン、セラメクチン、エプリノメクチン、ドラメクチン、エマメクチン安息香酸塩；ミルベマイシンオキシム；

トリブレン、エポフェノナン、ジオフェノラン；

生物学的薬剤、ホルモン類、又は、フェロモン類、例えば、天然産物類、例えば、ツリンギエンシン(thuringiensin)、コドレモン、又は、ニーム成分；

ジニトロフェノール系、例えば、ジノカップ、ジノブトン、ビナパクリル；

20

ベンゾイル尿素系、例えば、フルアズロン、ペンフルロン；

アミジン誘導体、例えば、クロロメブホルム(chlormebulfom)、シミアゾール、デミジトラズ；

蜜蜂巣箱ミツバチヘギイタダニ殺ダニ剤(beehive varroa acaricides)、例えば、有機酸、例えば、ギ酸、シュウ酸。

#### 【0268】

混合相手剤として該殺内部寄生生物薬の群から選択される代表的な活性成分としては、限定するものではないが、駆虫活性化合物及び抗原動物活性化合物などを挙げることができる。

#### 【0269】

30

該駆虫活性化合物としては、限定するものではないが、以下の殺線虫活性化合物、殺吸虫活性化合物及び/又は殺糸虫活性化合物などを挙げることができる；

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：エプリノメクチン、アバメクチン、ネマデクチン、モキシデクチン、ドラメクチン、セラメクチン、レピメクチン、ラチデクチン、ミルベメクチン、イベルメクチン、エマメクチン、ミルベマイシン；

ベンゾイミダゾール類及びプロベンゾイミダゾール類のクラスの、例えば：オキシベンダゾール(oxibendazole)、メベンダゾール、トリクラベンダゾール(triclabendazole)、チオファネート(thiophanate)、パルベンダゾール(parbendazole)、オキシフェンダゾール(oxfendazole)、ネトビミン(netobimin)、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール(thiabendazole)、シクロベンダゾール、カムベンダゾール、アルベンダゾール - スルホキシド、アルベンダゾール、フルベンダゾール；

40

デブシペプチド類のクラスの、好ましくは、環状デブシペプチド類のクラスの、特に、24員の環状デブシペプチド類のクラスの、例えば：エモデブシド(emodepside)、PF1022A；

テトラヒドロピリミジン類のクラスの、例えば：モランテル、ピランテル、オキサントール；

イミダゾチアゾール類のクラスの、例えば：ブタミソール、レバミソール、テトラミソール；

アミノフェニルアミジン類のクラスの、例えば：アミダンテル、デアシル化アミダンテ

50

ル ( d A M D )、トリベンジミジン；

アミノアセトニトリル類のクラスの、例えば：モネパンテル ( m o n e p a n t e l )

；

パラヘルクアミド類のクラスの、例えば：パラヘルクアミド、デルクアンテル；

サリチルアニリド類のクラスの、例えば：トリプロムサラン、プロモキサニド、プロチアニド、クリオキサニド、クロサンテル、ニクロサミド、オキシクロザニド、ラフォキサニド；

置換フェノール類のクラスの、例えば：ニトロキシニル、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン ( m e n i c l o p h o l a n )

10

有機リン酸エステル類のクラスの、例えば：トリクロルホン、ナフタロホス ( n a p h t h a l o f o s )、ジクロルボス / D D V P、クルホメート、クマホス、ハロキソン；

ピペラジノン類 / キノリン類のクラスの、例えば：プラジクアンテル ( p r a z i q u a n t e l )、エプシプランテル；

ピペラジン類のクラスの、例えば：ピペラジン、ヒドロキシジン；

テトラサイクリン類のクラスの、例えば：テトラサイクリン、クロロテトラサイクリン、ドキシサイクリン、オキシテトラサイクリン、ロリテトラサイクリン；

さまざまな別のクラスの、例えば：ブナミジン、ニリダゾール、レソランテル、オムファロチン、オルチプラズ、ニトロスカネート、ニトロキシニル、オキサムニキン、ミラサン ( m i r a s a n )、ミラシル ( m i r a c i l )、ルカントン、ヒカントン、ヘトリン ( h e t o l i n )、エメチン、ジエチルカルバマジン、ジクロロフェン、ジアンフェネチド、クロナゼパム、ベフェニウム、アモスカネート ( a m o s c a n a t e )、クロルスロン。

20

#### 【 0 2 7 0 】

坑原生動物活性化合物としては、限定するものではないが、以下の活性化合物を挙げることができる：

トリアジン類のクラスの、例えば：ジクラズリル、ポナズリル、レトラズリル、トルトラズリル；

ポリエーテルイオノホア類のクラスの、例えば：モネンシン、サリノマイシン、マデュラマイシン、ナラシン；

30

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン；

キノロン類のクラスの、例えば：エンロフロキサシン、プラドフロキサシン；

キニン類のクラスの、例えば：クロロキン；

ピリミジン類のクラスの、例えば：ピリメタミン；

スルホンアミド類のクラスの、例えば：スルファキノキサリン、トリメトプリム、スルファクロジン；

チアミン類のクラスの、例えば：アンプロリウム；

リンコサミド類のクラスの、例えば：クリンダマイシン；

カルバニリド類のクラスの、例えば：イミドカルブ；

ニトロフラン類のクラスの、例えば：ニフルチモクス；

40

キナゾリノンアルカロイド類のクラスの、例えば：ハロフギノン；

さまざまな別のクラスの、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン；

ワクチン又は微生物の抗原のクラスの、例えば：バベシア・カニス・ロッシ ( B a b e s i a c a n i s r o s s i )、エイメリア・テネラ ( E i m e r i a t e n e l l a )、エイメリア・プラエコクス ( E i m e r i a p r a e c o x )、エイメリア・ネカトリキス ( E i m e r i a n e c a t r i x )、エイメリア・ミチス ( E i m e r i a m i t i s )、エイメリア・マキシマ ( E i m e r i a m a x i m a )、エイメリア・ブルネッチ ( E i m e r i a b r u n e t t i )、エイメリア・アセルプリナ ( E i m e r i a a c e r v u l i n a )、バベシア・カニス・ボゲリ ( B a b e s i a c a n i s v o g e l i )、レイシュマニア・インファンツム ( L e i s h m a n i a

50

*infantum*)、バベシア・カニス・カニス (*Babesia canis canis*)、ジクチオカウルス・ビビパルス (*Dictyocaulus viviparus*)。

【0271】

名前が挙げられている全ての混合相手剤は、それらの官能基によって可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することができる。

【0272】

媒介動物の防除

式 (I) で表される化合物は、媒介動物 (*vector*) の防除において使用することも可能である。本発明の目的に関して、媒介動物は、病原体 (例えば、ウイルス類、蠕虫類 (*worms*)、単細胞生物及び細菌類) を病原体保有宿主 (植物、動物、ヒトなど) から宿主まで運ぶことが可能な節足動物 (特に、昆虫又はクモ形類動物) である。該病原体は、宿主に機械的に運ばれ得る (例えば、非刺咬性ハエによるトラコーマ)、又は、宿主体内への注入によって運ばれ得る (例えば、蚊によるマラリア原虫)。

【0273】

媒介動物の例及び媒介動物によって運ばれる疾患又は病原体は、以下のとおりである：

(1) 蚊類

- ・ ハマダラカ (*Anopheles*) : マラリア、フィラリア症；
- ・ アカイエカ (*Culex*) : 日本脳炎、別のウイルス性疾患、フィラリア症、別の蠕虫類の運搬；

- ・ ヤブカ (*Aedes*) : 黄熱病、デング熱、別のウイルス性疾患、フィラリア症；
- ・ ブユ (*Simuliidae*) : 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)) の運搬；
- ・ チョウバエ (*Psychodidae*) : リーシュマニア症の伝染；

(2) シラミ類 : 皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類 : 伝染病、発疹熱、条虫；

(4) ハエ類 : 睡眠病 (トリパノソーマ病) ; コレラ、別の細菌性疾患；

(5) ダニ類 : ダニ症 (*acariosis*)、流行性発疹チフス、リケッチア痘瘡、野兔病、セントルイス脳炎、ダニ媒介脳炎 (TBE)、クリミア・コンゴ出血熱、ボレリア症 (*borreliosis*)；

(6) マダニ類 : ボレリア症 (*borellioses*)、例えば、ライム病ボレリア (*Borrelia burgdorferi sensu lato*)、ダットン回帰熱ボレリア (*Borrelia duttoni*)、ダニ媒介脳炎、Q熱 (*Coxiella burnetii*)、バベシア症 (*babesioses*) (*Babesia canis canis*)、エーリキア症 (*ehrlichiosis*)。

【0274】

本発明の意味において、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類又はアザミウマ類などである。植物ウイルスを運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類及び線虫類である。

【0275】

本発明の意味において、媒介動物のさらなる例は、病原体を動物及び/又はヒトに運ぶことが可能な昆虫類及びクモ形類動物、例えば、蚊類 [特に、ヤブカ属 (*Aedes*) の蚊、ハマダラカ属 (*Anopheles*) の蚊、例えば、ガンビエハマダラカ (*A. gambiæ*)、アノフェレス・アラビエンシス (*A. arabiensis*)、アノフェレス・フネスツス (*A. funestus*)、アノフェレス・ジルス (*A. dirus*) (マラリア)、及び、アカイエカ属 (*Culex*) の蚊]、チョウバエ (*psychodids*)、例えば、サシチョウバエ (*Phlebotomus*)、ルツオミヤ (*Lutzomyia*)、シラミ類、ノミ類、ハエ類、ダニ類及びマダニ類である。

【0276】

10

20

30

40

50

式 ( I ) で表される化合物が抵抗性を打破する ( r e s i s t a n c e - b r e a k i n g ) 場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【 0 2 7 7 】

式 ( I ) で表される化合物は、疾患の予防及び / 又は媒介動物によって運ばれる病原体の予防において使用するのに適している。かくして、本発明のさらなる態様は、例えば、農業において、園芸において、庭園やレジャー施設において、及び、さらに、材料物質や貯蔵生産物の保護において、媒介動物を防除するための式 ( I ) で表される化合物の使用である。

【 0 2 7 8 】

#### 工業材料の保護

式 ( I ) で表される化合物は、昆虫類 [ 例えば、コウチュウ目 ( C o l e o p t e r a ) 、ハチ目 ( H y m e n o p t e r a ) 、シロアリ目 ( I s o p t e r a ) 、チョウ目 ( L e p i d o p t e r a ) 、チャタテムシ目 ( P s o c o p t e r a ) 及びシミ目 ( Z y g e n t o m a ) の昆虫類] による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【 0 2 7 9 】

本発明に関連して、工業材料は、非生物材料、例えば、好ましくは、プラスチック、接着剤、サイズ、紙及び厚紙、皮革、木材、加工木材製品及び塗料などを意味するものと理解される。本発明は、木材を保護するために使用するのが特に好ましい。

【 0 2 8 0 】

さらなる実施形態では、式 ( I ) で表される化合物は、少なくとも 1 種類のさらなる殺虫剤及び / 又は少なくとも 1 種類の殺菌剤と一緒に使用する。

【 0 2 8 1 】

さらなる実施形態では、式 ( I ) で表される化合物は、即時使用可能な ( r e a d y - t o - u s e ) 殺有害生物剤として存在している。即ち、それらは、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することができる。適切なさらなる殺虫剤又は殺菌剤は、特に、上記で挙げられているものである。

【 0 2 8 2 】

驚くべきことに、式 ( I ) で表される化合物は、海水又は淡海水と接触するもの、特に、船体、スクリーン、網、建造物、係船設備及び信号システムなどを、付着物から保護するために使用することができるということも分かった。同様に、式 ( I ) で表される化合物は、単独で、又は、別の活性化化合物と組合せて、防汚剤として使用することができる。

【 0 2 8 3 】

#### 衛生分野における害虫の防除

式 ( I ) で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。特に、本発明は、家庭内分野において、衛生分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間 ( 例えば、住居、工場の通路、オフィス、車両の客室、畜産業 ) において遭遇する昆虫類、クモ形類動物、マダニ類及びダニ類を防除するために、施用することができる。害虫を防除するために、式 ( I ) で表される化合物は、単独で使用するか、又は、別の活性化化合物及び / 又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式 ( I ) で表される化合物は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

【 0 2 8 4 】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱 ( A r a c h n i d a ) のサソリ目 ( S c o r p i o n e s ) 、クモ目 ( A r a n e a e ) 及びザトウムシ目 ( O p i l i o n e s ) の害虫、ムカデ綱 ( C h i l o p o d a ) 及びヤスデ綱 ( D i p l o p o d a ) の害虫、昆虫綱 ( I n s e c t a ) のゴキブリ目 ( B l a t t o d e a ) 、コウチュウ目 ( C o l e o p t e r a ) 、ハサミムシ目 ( D e r m a p t e r a ) 、ハエ目 ( D i p t e r a ) 、カメムシ亜目 ( H e t e r o p t e r a ) 、ハチ目 ( H y m e n o p t e r a ) 、シロアリ目 ( I s o p t e r a ) 、チョウ目 ( L e p i d o p t e r a ) 、シラミ目 ( P h t h

10

20

30

40

50

iraptera)、チャタテムシ目(Psocoptera)、バッタ目(Saltatoria 又は Orthoptera)、ノミ目(Siphonaptera)及びシミ目(Zygentoma)の害虫、並びに、軟甲綱(Malacostraca)のワラジムシ目(Isopoda)の害虫などをあげることができる。

【0285】

それらは、例えば、エアロゾル、非加圧スプレー製品、例えば、ポンプスプレー及び噴霧スプレー、自動霧化システム(automatic fogging system)、噴霧器(fogger)、泡、ゲル、セルロース製又はプラスチック製のエバポレーター錠剤を有するエバポレーター製品、液体エバポレーター、ゲル及び膜エバポレーター、プロペラ駆動エバポレーター、エネルギーフリー型蒸発システム又は受動型蒸発システム、防虫紙(moth papers)、防虫バッグ(moth bags)及び防虫ゲル(moth gels)において使用するか、又は、粒剤若しくは粉剤として、ばらまき用の餌に入れて使用するか、又は、ベイトステーションで使用する。

10

【0286】

20

30

40

50

## 【表 1】

## 略語及び記号

AcOH	酢酸	
aq.	水性	
BINAP	2,2'-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-бинаフチル	
br.	広幅線	
Cs <sub>2</sub> CO <sub>3</sub>	炭酸セシウム	
d	二重線	10
dppf	1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン	
DCC	N,N'-ジシクロヘキシルカルボジイミド	
DCM	ジクロロメタン	
DIPEA	ジイソプロピルエチルアミン	
DIAD	ジイソプロピルアゾジカルボキシレート	
DMA	N,N-ジメチルアセトアミド	
DMF	N,N-ジメチルホルムアミド	
DMSO	ジメチルスルホキシド	
ee	エナンチオマー過剰率	20
eq.	当量	
ES	エレクトロスプレーイオン化	
EtOAc	酢酸エチル	
HATU	1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム-3-オキシドヘキサフルオロホスフェート	
H <sub>2</sub> O	水	
HOBt	1-ヒドロキシベンゾトリアゾール水和物	
HPLC	高性能液体クロマトグラフィー	
<i>i</i> PrOH	イソプロパノール	
<i>J</i>	結合定数	30
LCMS	液体クロマトグラフィー-質量分析	
<i>m/z</i>	質量電荷比	
M	モル濃度	
m	多重線	
MeCN	アセトニトリル	
MeOH	メタノール	
MTBE	<i>tert</i> -ブチルメチルエーテル	
Na <sub>2</sub> SO <sub>4</sub>	硫酸ナトリウム	
NH <sub>4</sub> Cl	塩化アンモニウム	40

NMR	核磁気共鳴	
q	四重線	
r. t.	室温	
R <sub>t</sub>	保持時間	
s	一重線	
sat.	飽和	10
SnCl <sub>2</sub>	塩化スズ (II)	
T	温度	
TMP	2,2,6,6-テトラメチルピペリジン	
t	三重線	
T3P®	プロピルホスホン酸無水物	
THF	テトラヒドロフラン	
wt.	重量	20
XantPHOS	4,5-ビス(ジフェニルホスフィノ)-9,9-ジメチルキサンテン (CAS RN 161265-03-8)	
δ	化学シフト	
λ	波長	

## 【 0 2 8 7 】

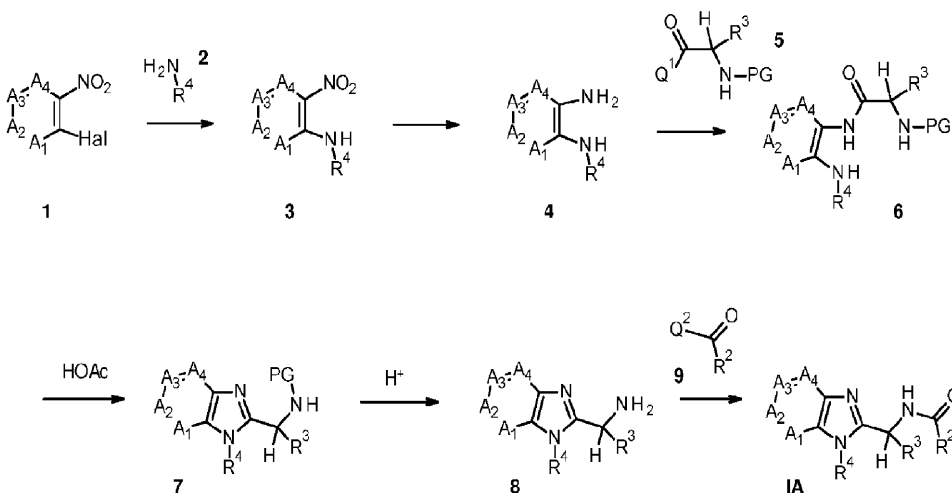
調製方法及び中間体の説明

式 ( I ) で表される化合物は、下記スキーム 1 において例証されているようにして調製することが可能であり、ここで、X は、O であり、R<sup>1</sup> は、H であり、及び、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、A<sup>4</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> は、先に定義されているとおりであり、PG は、アミノ保護基であり、Hal は、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、及び、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup> は、ヒドロキシ又は塩素である。

## 【 0 2 8 8 】

スキーム 1

## 【 化 1 8 】



40

50



## 【0289】

スキーム1に示されているように、該ヘテロ環アミン基の導入は、アセトニトリル、DMF、ジオキサン又はTHFなどの種々の溶媒の中で、 $Cs_2CO_3$ 又はピリジンなどの塩基の存在下、ニトロアジン(1)のハロゲン(2)をヘテロ環アミン(3)で芳香族求核置換することによって実施することができる。あるいは、該ヘテロ環アミンは、種々のパラジウム触媒及び適切な配位子を使用するBuchwald反応条件、例えば、US2010/29638A1又はWO2012/41476A1に記載されているBuchwald反応条件によって、導入することができる。次の反応において、該ニトロ基の還元は、当技術分野で既知の方法に従い、同様に水素/Pd-C、SnCl<sub>2</sub>二水和物又は鉄/NH<sub>4</sub>Clを使用する種々の還元方法によって、達成することが可能である。得られたアミン誘導体(4)は、HATU/DIPEAなどの慣習的なカップリング試薬を使用することによって、又は、最初にアミノ酸(5  $Q^1 = OH$ )を例えばクロロホルミエートとN-メチルモルホリンを用いて対応する反応性混合酸無水物に変換させることによって、Bocで保護されたアミノ酸又はそれぞれの酸塩化物(5  $Q^1 = OH$ 又はCl)とさらに反応させて、対応するアミド(6)が得られる。中間体(6)は、酸性条件下、高温で(例えば、酢酸中で沸騰させて)環化させて、環状イミダゾール中間体(7)が得られる。出発物質としてエナンチオ純粋なアミノ酸を使用する場合、その環化中に部分的にラセミ化が起こり得る。該Boc保護基は、酸性条件下(例えば、ジオキサン又はトリフルオロ酢酸の中のHCl)で除去して、環状イミダゾールアルキルアミン又はそれぞれの塩(8)を得ることができる。最後に、中間体(8)は、置換安息香酸又は対応する酸塩化物とさらに反応させて、最終生成物IAが得られる。

## 【0290】

$Q^2 = OH$ ：式(8)で表されるイミダゾール化合物を式(9)( $Q^2 = OH$ )で表されるカルボン酸と反応させて、式IAで表される化合物が形成される。例えば、適切な溶媒(例えば、酢酸エチル又はDMF)の中の式(8)で表されるイミダゾールと式(9)( $Q^2 = OH$ )で表されるカルボン酸と適切なカップリング試薬(例えば、T3P(登録商標)、HATU又はDCC/HOBt)と適切な塩基(例えば、トリエチルアミン又はDIPEA)の混合物を約0~100の範囲内の温度で混合させて、式IAで表される化合物が得られる。この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

## 【0291】

$Q^2 = Cl$ ：式(8)で表されるイミダゾール化合物を式(9)( $Q^2 = Cl$ )で表されるカルボン酸塩化物と反応させて、式IAで表される化合物が形成される。例えば、適切な溶媒(例えば、ジクロロメタン又はTHF)の中の式(8)で表されるイミダゾールと式(9)( $Q^2 = Cl$ )で表されるカルボン酸塩化物と適切な塩基(例えば、トリエチルアミン又はDIPEA)の混合物を約0~100の範囲内の温度で混合させて、式IAで表される化合物が得られる。この化合物は、次いで、単離することができ、そして、必要に応じて、クロマトグラフィーなどの当技術分野でよく知られている技術を用いて精製することができる。

## 【0292】

式(I)(式中、 $X = S$ )で表されるチオアミドは、例えばWO2005009435に記載されているように、式(IA)で表される化合物を沸騰トルエン中でローソン試薬で処理することによって、得ることができる。

## 【0293】

式(9)( $Q^2 = OH$ )で表されるカルボン酸及び式(9)( $Q^2 = Cl$ )で表されるカルボン酸塩化物は、市販されているか、又は、当業者に知られている方法で合成することができる。

## 【0294】

より具体的には、アミン中間体INT-1の合成について、スキーム1aに記載する。

## 【0295】

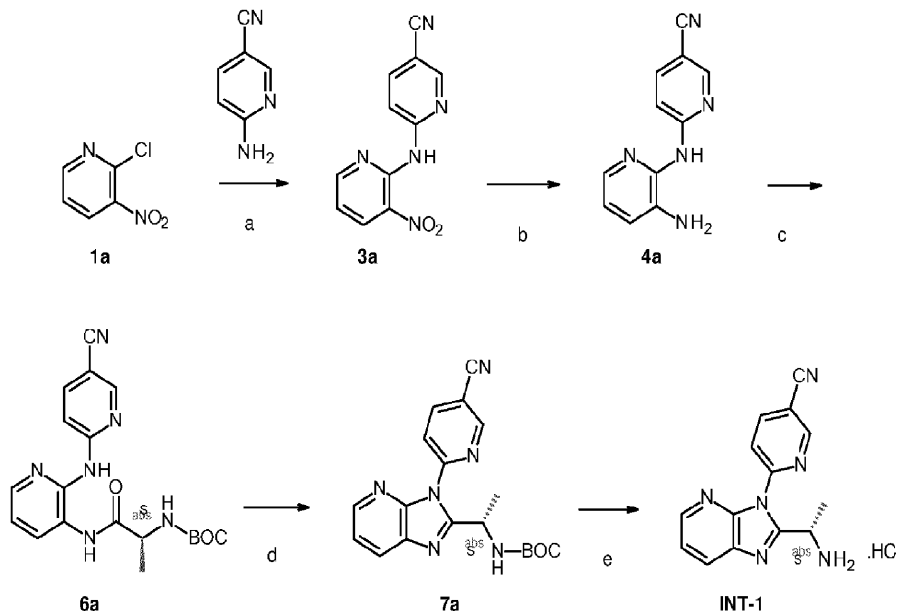
スキーム1aに示されているように、出発物質(1A)を、塩基としての $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ の存在下、DMA中80℃で、6-アミノピリジン-3-カルボニトリルと反応させる。そのニトロ基は、次の段階で、 $\text{SnCl}_2$ 二水和物を使用して還元する。アミン(4a)と(S)-Boc-Alaからのアミドの形成は、カップリング試薬としてHATUを使用し、及び、塩基としてDIPEAを使用して、実施する。得られたアミド(6a)を酸性条件下で環化させて、Bocで保護されたアミン中間体(7a)が得られ、次いで、ジオキサン中の4N HClを用いて室温で脱保護して、アミン塩酸塩(INT-1)が得られ、これをさらに誘導体化する。部分的にラセミ化されている場合、当技術分野で知られているキラル分離法を適用して、6a、7a又はINT-1の純粋な(S)-エナンチオマーを単離する。

10

## 【0296】

## スキーム1a

## 【化19】



20

30

## 【0297】

a.  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ 、DMA；80℃、16 h； b.  $\text{SnCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ 、EtOAc、70℃、1時間； c. (S)-Boc-Ala、HATU、DIPEA、DMF、室温、16時間； d. AcOH/ジオキサン、100℃、4日間； e. ジオキサン中4N HCl、室温。

## 【0298】

式(I)で表される化合物は、下記スキーム2において例証されているようにして調製することが可能であり、ここで、Xは、Oであり、 $\text{R}^1$ は、Hであり、及び、 $\text{A}^1$ 、 $\text{A}^2$ 、 $\text{A}^3$ 、 $\text{A}^4$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$ は、先に定義されているとおりであり、PGは、アミノ保護基であり、Halは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、及び、 $\text{Q}^1$ 、 $\text{Q}^2$ は、ヒドロキシ又は塩素である。

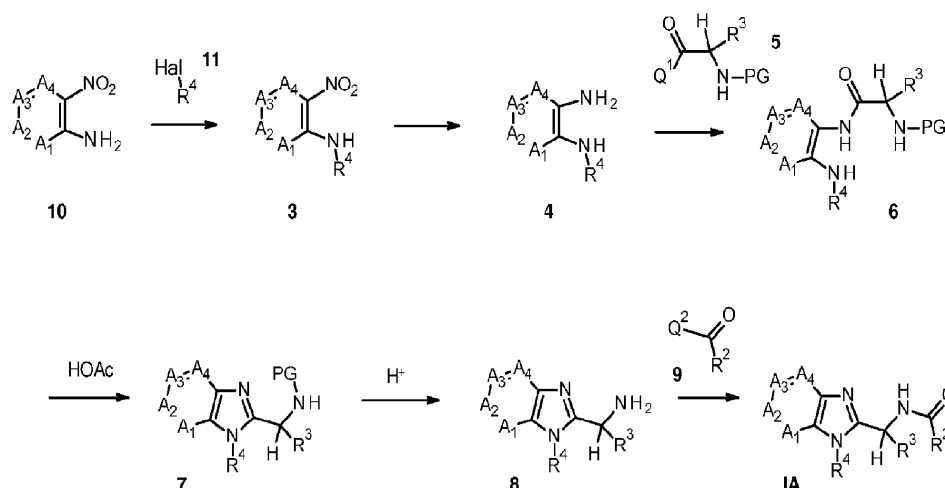
40

## 【0299】

## スキーム2

50

## 【化20】



10

## 【0300】

スキーム2に示されているように、該ヘテロ環アミン基の導入は、アセトニトリル、DMF、ジオキサン又はTHFなどの種々の溶媒の中で、Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>又はピリジンなどの塩基の存在下、ヘテロ環ハロゲン化物(11)のハロゲンをアミノ-ニトロ-アジン(10)で芳香族求核置換することによって実施することができる。あるいは、該ヘテロ環アミンは、種々のパラジウム触媒及び適切な配位子を使用するBuchwald反応条件、例えば、US2010/29638A1又はWO2012/41476A1に記載されているBuchwald反応条件によって、導入することができる。式(IA)で表される化合物へのその後の変換は、スキーム1において既に記載したようにして、実施することができる。

20

## 【0301】

場合により、さらなる誘導体化が可能であり得る。例えば、R<sup>4</sup>におけるメチルエステル官能基又はエチルエステル官能基は、当業者に知られている方法によって、アミド-CO<sub>2</sub>NR<sup>41</sup>R<sup>42</sup>に変換させることが可能であり、ここで、R<sup>41</sup>及びR<sup>42</sup>は、先に定義されているとおりである。

30

## 【実施例】

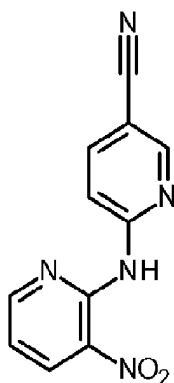
## 【0302】

中間体

6-[2-[(1S)-1-アミノエチル]イミダゾ[4,5-b]ピリジン-3-イル]ピリジン-3-カルボニトリル 塩酸塩(INT-1)

段階1: 6-[(3-ニトロピリジン-2-イル)アミノ]ニコチロニトリルの合成

## 【化21】



40

## 【0303】

50

6 - アミノピリジン - 3 - カルボニトリル ( 7 . 1 1 g 、 5 9 . 6 7 m m o l ) と  $C s_2 C O_3$  ( 3 5 . 3 5 g 、 1 0 8 . 4 9 m m o l ) を 1 5 0 m L の D M A に溶解させた溶液を攪拌しながら、それに、2 - クロロ - 3 - ニトロピリジン ( 8 . 6 0 g 、 5 4 . 2 4 m m o l ) を 8 0 m L の D M A に溶解させた溶液を滴下して加え、その反応混合物を 8 0 で一晩攪拌した。その混合物を室温まで冷却した。その反応物を、室温で、氷水でクエンチした。得られた混合物を E t O A c で数回抽出した。その有機層を合して  $H_2O$  で洗浄し、無水  $N a_2 S O_4$  で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / E t O A c ( 2 : 1 ) で溶離 ) で精製して、所望の生成物 ( 5 . 6 0 g 、 3 5 . 7 % ) が得られた。

$^1H$ -NMR ( 4 0 0 . 2 M H z ,  $d_6$ -DMSO, ピークリスト): = 10.6624 ( 9.4 ); 8.7054 ( 7.9 ); 8.7011 ( 16.0 ); 8.6938 ( 15.8 ); 8.6896 ( 8.9 ); 8.6107 ( 7.8 ); 8.6065 ( 7.6 ); 8.5900 ( 8.3 ); 8.5858 ( 7.6 ); 8.5785 ( 0.5 ); 8.5558 ( 0.3 ); 8.2566 ( 6.1 ); 8.2509 ( 5.9 ); 8.2430 ( 0.4 ); 8.2346 ( 9.9 ); 8.2289 ( 9.8 ); 8.1653 ( 12.2 ); 8.1447 ( 6.8 ); 8.1432 ( 7.5 ); 7.3306 ( 8.8 ); 7.3190 ( 8.5 ); 7.3099 ( 8.4 ); 7.2983 ( 8.4 ); 5.7578 ( 0.7 ); 4.0562 ( 1.1 ); 4.0384 ( 3.2 ); 4.0206 ( 3.3 ); 4.0028 ( 1.1 ); 3.3300 ( 57.6 ); 2.6775 ( 0.4 ); 2.6729 ( 0.6 ); 2.6684 ( 0.4 ); 2.5265 ( 1.4 ); 2.5218 ( 2.0 ); 2.5130 ( 28.0 ); 2.5085 ( 59.2 ); 2.5040 ( 79.6 ); 2.4995 ( 56.6 ); 2.4950 ( 26.3 ); 2.3354 ( 0.4 ); 2.3308 ( 0.5 ); 2.3263 ( 0.4 ); 1.9900 ( 14.4 ); 1.3971 ( 3.5 ); 1.1935 ( 3.8 ); 1.1757 ( 7.7 ); 1.1579 ( 3.7 ); -0.0002 ( 4.5 )

10

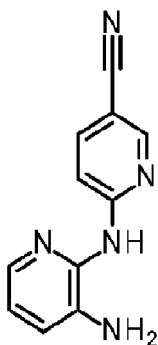
20

ESI 質量 [ m / z ] : 241.9 [ M + H ] <sup>+</sup>

【 0 3 0 4 】

段階 2 : 6 - [ ( 3 - アミノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチノニトリル

【 化 2 2 】



30

【 0 3 0 5 】

6 - [ ( 3 - ニトロピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチノニトリル ( 1 . 2 5 g 、 5 . 1 9 m m o l ) を 2 0 m L の酢酸エチルに溶解させた溶液を攪拌しながら、それに、塩化スズ二水和物 ( 5 . 8 6 g 、 2 5 . 9 0 m m o l ) を添加し、その反応混合物を 7 0 で 1 時間攪拌した。その混合物を室温まで冷却した時、その反応物を水でクエンチし、炭酸ナトリウムの水溶液を用いて塩基性にして p H 9 - 1 0 とした。その混合物を酢酸エチルで数回抽出した。その有機層を合してを無水  $N a_2 S O_4$  で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した ( 1 . 0 g 、 7 2 . 7 % 純度、収率 : 6 6 % ) 。

40

$^1H$ -NMR ( 4 0 0 . 2 M H z ,  $d_6$ -DMSO, ピークリスト): = 9.2833 ( 0.4 ); 9.2385 ( 1.2 ); 9.0450 ( 0.6 ); 8.6368 ( 0.3 ); 8.6270 ( 1.1 ); 8.6221 ( 1.2 ); 8.6090 ( 0.7 ); 8.6016 ( 8.4 ); 8.5999 ( 9.5 ); 8.5960 ( 9.7 ); 8.5941 ( 9.4 ); 8.5820 ( 0.3 ); 8.5689 ( 0.4 ); 8.3828 ( 0.7 ); 8.1775 ( 0.5 ); 8.1430 ( 0.7 ); 8.1367 ( 0.8 ); 8.1333 ( 0.6 ); 8.1252 ( 0.4 ); 8.0504 ( 0.4 ); 8.0447 ( 0.5 ); 8.0280 ( 0.7 ); 8.0223 ( 0.8 ); 8.0149 ( 0.3 ); 7.9948 ( 7.2 ); 7.9889 ( 7.2 ); 7.9724 ( 9.3 ); 7.9

50

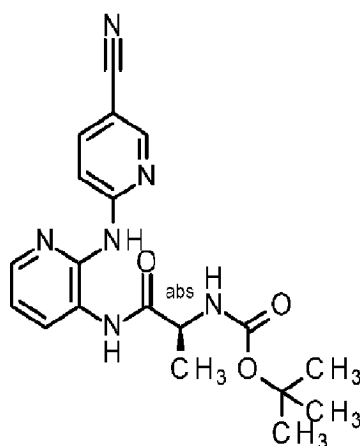
665 (9.5); 7.9304 (0.7); 7.9081 (0.6); 7.8491 (12.1); 7.8268 (8.7); 7.6360 (7.7); 7.6323 (8.5); 7.6244 (7.9); 7.6206 (8.4); 7.4959 (0.3); 7.4761 (0.4); 7.2761 (0.6); 7.2722 (0.6); 7.2637 (0.6); 7.2598 (0.6); 7.2342 (0.4); 7.2128 (0.4); 7.0990 (0.4); 7.0762 (7.6); 7.0723 (8.4); 7.0567 (9.6); 7.0528 (9.9); 6.9059 (8.3); 6.8942 (7.9); 6.8864 (6.8); 6.8747 (6.4); 6.6969 (0.5); 6.6930 (0.5); 6.6783 (0.6); 6.6744 (0.6); 6.3806 (0.6); 6.3682 (0.6); 6.3621 (0.6); 6.3496 (0.5); 5.3611 (1.1); 5.3242 (16.0); 5.2441 (0.6); 4.6521 (0.4); 4.0575 (0.6); 4.0397 (1.7); 4.0219 (1.7); 4.0042 (0.6); 3.3470 (14.4); 2.5301 (0.4); 2.5255 (0.6); 2.5165 (7.0); 2.5122 (15.4); 2.5077 (21.3); 2.5033 (15.9); 1.9920 (7.4); 1.3021 (0.4); 1.2595 (0.6); 1.2280 (1.2); 1.1942 (2.5); 1.1764 (4.4); 1.1586 (2.2); -0.0002 (5.4)

ESI 質量 [m/z]: 212.2 [M + H]<sup>+</sup>

【0306】

段階3: tert-ブチル [(2S)-1-(2-(5-シアノピリジン-2-イル)アミノ)ピリジン-3-イル]アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル]カルバメート

【化23】



20

30

【0307】

3 mLのDMFの中の(2S)-2-[(tert-ブトキシカルボニル)アミノ]プロパン酸(806.20 mg、4.26 mmol)とN,N-ジイソプロピルエチルアミン(2.17 mL、12.78 mmol)とHATU(1.94 g、5.11 mmol)の混合物を室温で10分間攪拌し、次いで、6-[(3-アミノピリジン-2-イル)アミノ]ニコチノニトリル(900.0 mg、4.26 mmol)を添加し、その反応物を室温で一晩攪拌した。その混合物を分取HPLCで直接精製して、所望の生成物(1.15 g、65%)が得られた。

40

<sup>1</sup>H-NMR (400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO, ピークリスト): =9.8273 (1.1); 9.4949 (0.8); 8.6284 (2.1); 8.6263 (2.1); 8.1999 (1.2); 8.1886 (1.3); 8.0893 (0.9); 8.0676 (1.1); 7.9605 (1.1); 7.9408 (1.2); 7.8617 (0.8); 7.8398 (0.7); 7.2510 (0.7); 7.2371 (0.7); 7.1922 (0.7); 7.1797 (0.8); 7.1746 (0.8); 7.1610 (0.6); 5.7590 (2.2); 4.1516 (0.5); 4.1352 (0.7); 4.1183 (0.5); 3.6981 (0.6); 2.5057 (34.9); 2.5027 (35.1); 1.3945 (0.9); 1.3699 (16.0); 1.3281 (0.7); 1.2840 (3.8); 1.2664 (3.7); 0.0024 (5.8); -0.0002 (6.5)

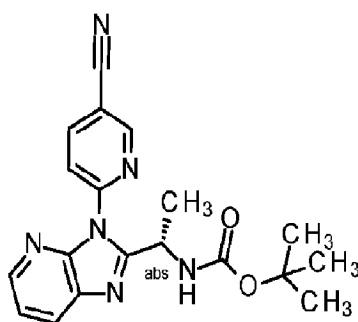
ESI 質量 [m/z]: 383.5 [M + H]<sup>+</sup>

【0308】

段階4: tert-ブチル [(1S)-1-[3-(5-シアノピリジン-2-イル]

50

)- 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル } カルバメート  
 【化 2 4】



10

## 【0309】

ジオキサン ( 150 . 00 mL ) の中の tert - ブチル [ ( 2 S ) - 1 - ( { 2 - [ ( 5 - シアノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピリジン - 3 - イル } アミノ ) - 1 - オキソプロパン - 2 - イル ] カルバメート ( 10 . 00 g 、 26 . 11 mmol ) の混合物を攪拌しながら、それに、AcOH ( 40 . 00 mL ) を添加し、その混合物を 100 で 4 日間攪拌した。その混合物を飽和 NaHCO<sub>3</sub> ( 水性 ) を用いて塩基性にして pH 8 とした。得られた混合物を EtOAc で数回抽出し、その有機層を合してブラインで洗浄し、無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( 石油エーテル / EtOAc ( 3 : 1 ) で溶離 ) で精製し、次いで、prep - HPLC で精製して、両方のエナンチオマーの混合物が得られた。この部分的なラセミ化合物を prep - SFC で精製して、tert - ブチル { ( 1 S ) - 1 - [ 3 - ( 5 - シアノピリジン - 2 - イル ) - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル } カルバメート ( 1 . 59 g 、 4 . 37 mmol 、 16 . 71 % ) が得られた。

20

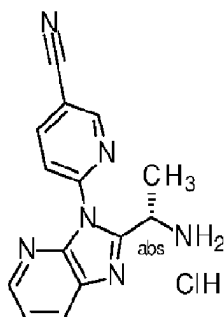
ESI 質量 [ m/z ] : 365.2 [ M + H ]<sup>+</sup>

## 【0310】

段階 5 : 6 - [ 2 - [ ( 1 S ) - 1 - アミノエチル ] イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩 ( INT - 1 )

30

## 【化 2 5】



40

## 【0311】

tert - ブチル N - [ ( 1 S ) - 1 - [ 3 - ( 5 - シアノ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル ] カルバメート ( 200 mg 、 0 . 54 mmol ) を 4 mL のジオキサンに溶解させ、ジオキサン中の 4 M HCl ( 1 . 37 mL ) を添加した。その反応混合物を室温で一晩攪拌した。溶媒を蒸発させ、残った残渣は、そのまま次の段階で使用した。

ESI 質量 [ m/z ] : 265.2 [ amine + H ]<sup>+</sup>

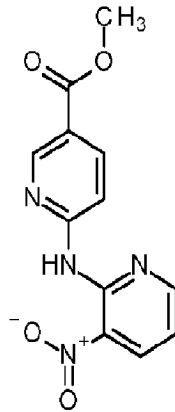
50

## 【 0 3 1 2 】

メチル 6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ニコチネート 塩酸塩 ( INT - 5 )

段階 1 : メチル 6 - [ ( 3 - ニトロピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチネート

## 【 化 2 6 】



10

## 【 0 3 1 3 】

5.1 g ( 33.3 mmol ) のメチル 6 - アミノニコチネートと 20.5 g ( 62.8 mmol ) の炭酸セシウムを 80 mL のアセトニトリルに溶解させた溶液に 4.1 g ( 26.1 mmol ) の 2 - クロロ - 3 - ニトロピリジン を滴下して加え、その混合物を 80 で一晩攪拌した。室温まで冷却した後、その混合物を氷水で処理し、酢酸エチルで数回抽出した。その有機層を合して水で洗浄し、無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で脱水し、濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / 酢酸エチルで溶離 ) で精製して、780 mg ( 10.2% ) の標題化合物が得られた。

20

<sup>1</sup>H-NMR ( 400.2 MHz, CD<sub>3</sub>CN, ピークリスト): =10.5963 ( 0.8 ); 8.8964 ( 2.0 ); 8.8913 ( 2.1 ); 8.6382 ( 1.7 ); 8.6297 ( 3.8 ); 8.6074 ( 3.2 ); 8.3169 ( 1.4 ); 8.3113 ( 1.4 ); 8.2948 ( 1.2 ); 8.2892 ( 1.2 ); 7.1545 ( 1.4 ); 7.1430 ( 1.4 ); 7.1338 ( 1.4 ); 7.1222 ( 1.4 ); 3.8870 ( 16.0 ); 2.1768 ( 32.9 ); 2.1643 ( 0.5 ); 1.9547 ( 2.2 ); 1.9487 ( 4.3 ); 1.9426 ( 6.2 ); 1.9365 ( 4.3 ); 1.9304 ( 2.2 ); -0.0002 ( 2.8 )

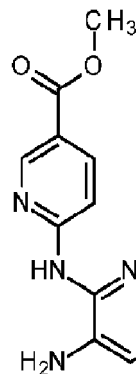
30

ESI 質量 [ m/z ] : 275.3 [ M+H ]<sup>+</sup>

## 【 0 3 1 4 】

段階 2 : メチル 6 - [ ( 3 - アミノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチネート

## 【 化 2 7 】



40

## 【 0 3 1 5 】

50

728.0 mg (2.66 mmol) のメチル 6 - [ ( 3 - ニトロピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチネートを 13 mL の酢酸エチルに溶解させ、次いで、3.0 g (13.3 mmol) の塩化スズ二水和物を添加し、その反応混合物を 70 で 1.5 時間撹拌した。室温まで冷却した後、その混合物を酢酸エチルで希釈し、飽和  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  (水性) を用いて塩基性にして pH 9 - 10 とした。その水相を酢酸エチルで数回抽出し、その有機層を合してブラインで洗浄し、無水  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮し、その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した (645 mg、94% 収率)。

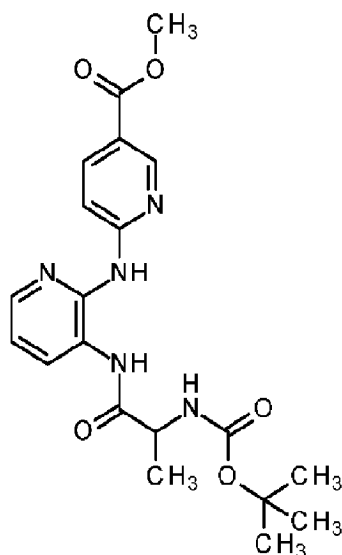
$^1\text{H-NMR}$  (400.2 MHz,  $d_6$ -DMSO, ピークリスト): =9.0965 (3.0); 8.7376 (2.6); 8.7332 (2.4); 8.7318 (2.7); 8.1034 (1.4); 8.0976 (1.4); 8.0810 (1.8); 8.0752 (1.8); 7.9141 (3.0); 7.8918 (2.4); 7.6317 (1.9); 7.6294 (1.8); 7.6200 (1.9); 7.6176 (1.8); 7.0557 (1.7); 7.0534 (1.7); 7.0363 (2.1); 7.0339 (2.0); 6.8727 (1.7); 6.8609 (1.7); 6.8533 (1.4); 6.8416 (1.4); 5.3151 (4.0); 4.0378 (0.4); 4.0201 (0.4); 3.8258 (16.0); 3.3346 (10.2); 2.5039 (14.4); 2.5003 (11.0); 1.9899 (1.7); 1.1933 (0.4); 1.1920 (0.5); 1.1754 (0.9); 1.1742 (0.9); 1.1577 (0.4); 1.1564 (0.4); -0.0002 (5.8); -0.0015 (5.7)

ESI 質量 [m/z]: 245.1 [M+H]<sup>+</sup>

【0316】

段階 3 : メチル 6 - [ ( 3 - { [ N - ( tert - ブトキシカルボニル ) アラニル ] アミノ } ピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチネート

【化 28】



【0317】

0.33 g (1.74 mmol) の N - ( tert - ブトキシカルボニル ) アラニン を 17 mL のジクロロメタンに溶解させた溶液に、0.92 mL (5.23 mmol) の N , N - ジイソプロピルエチルアミン (DIPEA、ヒューニッヒ塩基) 及び 0.80 g (2.1 mmol) の [ O - ( 7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル ) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート ] (HATU) を添加し、その混合物を室温で 10 分間撹拌した。次いで、0.64 g (2.62 mmol) のメチル 6 - [ ( 3 - アミノピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチネートを添加し、その反応混合物を室温で一晩撹拌した。その反応混合物をジクロロメタンで希釈し、5% リン酸二水素ナトリウム (水性) で洗浄し、ジクロロメタンで数回抽出した。その有機層を合して飽和  $\text{NaHCO}_3$  (水性) 及びブラインで洗浄し、無水  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で脱水し、濾過した。その濾液を減圧下で濃縮した。次いで、その反応混合物を分取 HPLC (水 / アセトニ



トリルで溶離)で直接精製して、497mg(62.0%)の標題化合物が得られた。

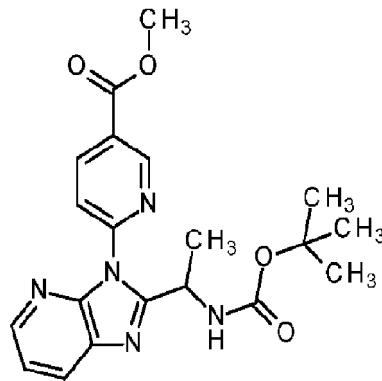
<sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO, ピークリスト): =8.7905 (1.4); 8.7856 (1.4); 8.1732 (1.0); 8.1686 (1.1); 8.1515 (0.9); 8.1465 (0.9); 8.0346 (0.6); 7.8287 (0.5); 7.0894 (0.4); 7.0726 (0.5); 7.0608 (0.4); 5.8359 (0.3); 4.1648 (0.5); 4.1481 (0.7); 4.1308 (0.5); 4.0679 (0.9); 4.0501 (0.9); 3.8569 (15.4); 2.1828 (2.7); 1.9728 (4.0); 1.9657 (0.4); 1.9538 (4.1); 1.9476 (7.9); 1.9415 (11.4); 1.9353 (7.8); 1.9292 (4.0); 1.4053 (16.0); 1.3747 (5.8); 1.3567 (5.6); 1.2215 (1.0); 1.2038 (2.0); 1.1859 (1.0); -0.0002 (2.4)

ESI 質量 [m/z]: 416.3 [M+H]<sup>+</sup>

【0318】

段階5: メチル 6 - ( 2 - { 1 - [ ( tert - ブトキシカルボニル ) アミノ ] エチル } - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ) ニコチネート

【化29】



【0319】

490.0mg(1.18mmol)のメチル 6 - [ ( 3 - { [ N - ( tert - ブトキシカルボニル ) アラニル ] アミノ } ピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ニコチネートを8mLのジオキサに溶解させた溶液に0.7mL(11.8mmol)の酢酸を添加し、その反応混合物を100で一晚攪拌した。室温まで冷却した後、その混合物を酢酸エチルで稀釈し、水で洗浄し、飽和NaHCO<sub>3</sub>(水性)を用いて塩基性にしてpH8とした。その有機層をブラインで洗浄し、無水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮し、その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した(450mg、93%収率)。

<sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, CD<sub>3</sub>CN, ピークリスト): =9.1696 (1.2); 9.1645 (1.2); 8.5775 (1.0); 8.5718 (1.0); 8.5565 (1.1); 8.5507 (1.1); 8.3537 (0.9); 8.3503 (1.0); 8.3417 (1.0); 8.3383 (1.0); 8.0907 (1.2); 8.0871 (1.2); 8.0803 (0.6); 8.0706 (1.3); 8.0671 (1.2); 8.0597 (0.5); 7.3741 (1.0); 7.3620 (1.0); 7.3541 (0.9); 7.3421 (0.9); 4.0677 (0.4); 4.0499 (0.4); 3.9547 (11.7); 3.8410 (0.8); 3.6005 (16.0); 2.1979 (1.1); 2.1832 (75.4); 1.9725 (1.7); 1.9658 (0.4); 1.9538 (6.8); 1.9476 (13.1); 1.9414 (18.6); 1.9352 (12.5); 1.9291 (6.3); 1.5206 (1.4); 1.5038 (1.3); 1.2917 (5.9); 1.2216 (0.6); 1.2039 (1.0); 1.1860 (0.6); -0.0002 (4.3)

ESI 質量 [m/z]: 398.5 [M+H]<sup>+</sup>

【0320】

段階6: メチル 6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ニコチネート 塩酸塩 ( INT - 4 )

10

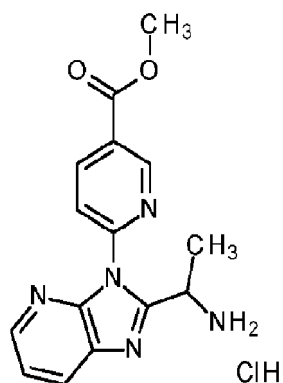
20

30

40

50

## 【化 3 0】



10

## 【0321】

409 mg (1.02 mmol) のメチル 6 - ( 2 - { 1 - [ ( tert - ブトキシカルボニル ) アミノ ] エチル } - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ) ニコチネートを 21 mL のジオキサソランに溶解させた溶液に、5.15 mL (20.5 mmol) のジオキサソラン中 4 N HCl を添加した。その反応混合物を室温で 3 日間攪拌した。溶媒を蒸発させ、残った残渣は、そのまま次の段階で使用した ( 420 mg、100% 収率 )。

20

$^1\text{H-NMR}$  (400.2 MHz,  $d_6$ -DMSO, ピークリスト):  $\delta$  = 9.1796 (0.8); 9.1741 (0.8); 8.7544 (0.6); 8.7433 (0.6); 8.7018 (0.6); 8.6959 (0.6); 8.6804 (0.7); 8.6746 (0.7); 8.5325 (0.6); 8.5289 (0.7); 8.5205 (0.7); 8.5169 (0.7); 8.4530 (0.9); 8.4318 (0.8); 8.3304 (0.7); 8.3268 (0.7); 8.3103 (0.8); 8.3067 (0.7); 7.5540 (0.6); 7.5421 (0.6); 7.5339 (0.6); 7.5219 (0.6); 3.9584 (5.6); 3.8563 (0.7); 3.7551 (0.4); 3.7107 (0.3); 3.7004 (0.4); 3.6803 (0.5); 3.6707 (0.5); 3.6663 (0.5); 3.6560 (0.5); 3.6503 (0.5); 3.6113 (0.4); 3.5988 (0.4); 3.5820 (0.4); 3.5682 (16.0); 2.5259 (0.8); 2.5211 (1.0); 2.5122 (14.7); 2.5078 (31.5); 2.5033 (42.5); 2.4988 (30.6); 2.4944 (14.6); 1.9097 (0.4); 1.6162 (2.1); 1.5994 (2.1); 1.2341 (0.6); -0.0002 (10.6); -0.0085 (0.3)

30

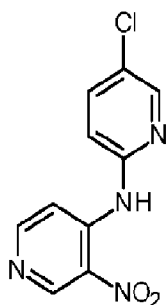
ESI 質量 [m/z]: 298.4 [M+H-HCl]<sup>+</sup>

## 【0322】

1 - [ 1 - ( 5 - クロロ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - c ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン 塩酸塩 ( INT - 7 )

段階 1 : 5 - クロロ - N - ( 3 - ニトロ - 4 - ピリジル ) ピリジン - 2 - アミン

## 【化 3 1】



40

## 【0323】

5 - クロロ - 2 - フルオロピリジン ( 2.27 g、17.3 mmol ) と  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$  ( 9.37 g、28.8 mmol ) を 30 mL の DMA に溶解させた溶液を攪拌しながら

50

、それに、80 で、3 - ニトロピリジン - 4 - アミン ( 2 . 0 0 g 、 1 4 . 4 m m o l ) を 3 0 m L の D M A に溶解させた溶液を滴下して加え、その反応混合物を 8 0 で一晩攪拌した。その混合物を室温まで冷却した。その反応物を、室温で、氷水でクエンチした。得られた混合物を E t O A c で数回抽出した。その有機層を合して H<sub>2</sub>O で洗浄し、無水 N a<sub>2</sub> S O<sub>4</sub> で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した ( 3 . 6 0 g 、 8 8 . 3 % 収率 ) 。

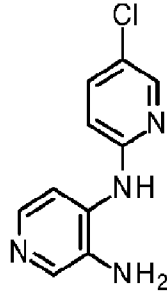
ESI 質量 [m/z]: 251.2 [M +H]<sup>+</sup>

【 0 3 2 4 】

段階 2 : N - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) ピリジン - 3 , 4 - ジアミン

【 化 3 2 】

10



20

【 0 3 2 5 】

5 - クロロ - N - ( 3 - ニトロ - 4 - ピリジル ) ピリジン - 2 - アミン ( 3 . 6 0 g 、 1 4 . 3 m m o l ) を 7 2 m L の酢酸エチルに溶解させた溶液を攪拌しながら、それに、塩化スズ二水和物 ( 1 6 . 2 g 、 7 1 . 7 m m o l ) を添加し、その反応混合物を 7 0 で 1 時間攪拌した。その混合物が室温まで冷却した時、その反応物を水でクエンチし、炭酸ナトリウムの水溶液を用いて塩基性にして p H 9 - 1 0 とした。その混合物を酢酸エチルで数回抽出した。その有機層を合して無水 N a<sub>2</sub> S O<sub>4</sub> で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した ( 2 . 5 1 g 、 6 9 . 8 % 収率 ) 。

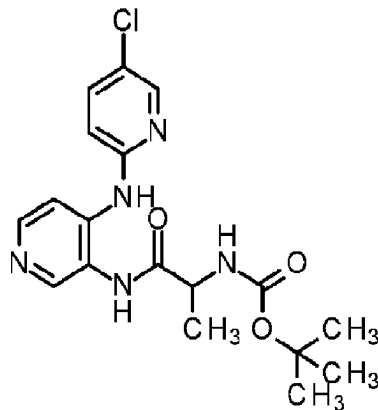
ESI 質量 [m/z]: 221.2 [M +H]<sup>+</sup>

30

【 0 3 2 6 】

段階 3 : t e r t - ブチル [ 1 - ( { 4 - [ ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピリジン - 3 - イル } アミノ ) - 1 - オキソプロパン - 2 - イル ] カルバメート

【 化 3 3 】



40

【 0 3 2 7 】

3 0 m L の D M F の中の N - ( t e r t - ブトキシカルボニル ) アラニン ( 2 . 5 8 g 、 1 3 . 7 m m o l ) と N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( 5 . 9 4 m L 、 3 4 . 1

50

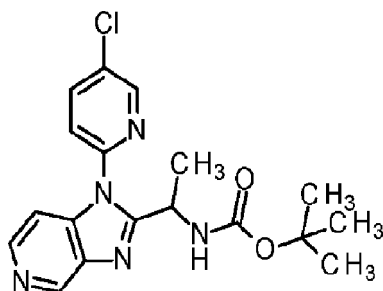
mmol)とHATU(5.19g、13.7mmol)の混合物を室温で10分間攪拌し、次いで、N<sup>4</sup>-(5-クロロピリジン-2-イル)ピリジン-3,4-ジアミン(2.51g、11.4mmol)を添加し、その反応物を室温で一晩攪拌した。飽和NaHCO<sub>3</sub>(水性)を添加し、その沈澱物を濾過によって除去した。その濾液をEtOAc(3×100mL)で抽出し、その有機層を合してNa<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>を添加することで脱水し、濾過し、減圧下で蒸発させた。その粗製生成物を分取HPLC(水/アセトニトリルで溶離)で直接精製して、所望の生成物(472mg、10.5%収率)が得られた。

ESI 質量 [m/z]: 392.4 [M + H]<sup>+</sup>

【0328】

段階4: tert-ブチル {1-[1-(5-クロロピリジン-2-イル)-1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]エチル}カルバメート 10

【化34】



20

【0329】

ジオキサン(20.00mL)の中のtert-ブチル[1-({4-[(5-クロロピリジン-2-イル)アミノ]ピリジン-3-イル}アミノ)-1-オキソプロパン-2-イル]カルバメート(815mg、2.08mmol)の混合物を攪拌しながら、それに、AcOH(2.38mL)を添加し、その混合物を100で22時間攪拌した。さらにジオキサン(10.00mL)及びAcOH(2.38mL)を添加し、その混合物を100で44時間攪拌した。その混合物を飽和NaHCO<sub>3</sub>(水性)を用いて塩基性にしてpH8とした。得られた混合物をEtOAcで数回抽出し、その有機層を合してブラインで洗浄し、無水Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣を分取HPLC(水/アセトニトリルで溶離)で精製して、446mg(46.5%収率)の標題化合物が得られた。

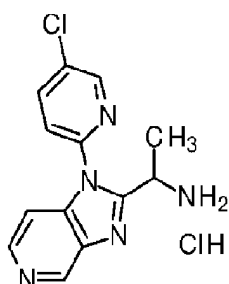
30

ESI 質量 [m/z]: 374.4 [M + H]<sup>+</sup>

【0330】

段階5: 1-[1-(5-クロロ-2-ピリジル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]エタンアミン 塩酸塩(INT-7)

【化35】



40

【0331】

tert-ブチル {1-[1-(5-クロロピリジン-2-イル)-1H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-2-イル]エチル}カルバメート(446mg、1.19mmol) 50

o 1) を 8 mL のジオキサンに溶解させ、ジオキサン中 4 M HCl (5.97 mL) を添加した。その反応混合物を室温で一晩攪拌した。その沈澱物を濾過によって集め (240 mg)、そして、それ以上精製することなく次の段階で使用した。

ESI 質量 [m/z]: 274.3 [amine +H]<sup>+</sup>

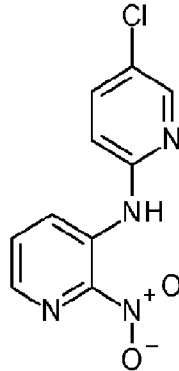
<sup>1</sup>H-NMR: NMR ピークリスト (表 2) を参照されたい。

【0332】

1 - [ 1 - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エタンアミン トリフルオロアセテート ( INT - 8 )

段階 1 : 5 - クロロ - N - ( 2 - ニトロピリジン - 3 - イル ) ピリジン - 2 - アミン  
【化 3 6】

10



20

【0333】

12.5 g (95.0 mmol) の 5 - クロロ - 2 - フルオロピリジン及び 56.3 g (172.8 mmol) の炭酸セシウムを 100 mL の DMA に懸濁させ、その反応混合物を 80 で攪拌した。次いで、100 mL の DMA に溶解させた 12.0 g (86.4 mmol) の 2 - ニトロピリジン - 3 - アミンを滴下して加え、その混合物を 80 で一晩攪拌した。室温まで冷却した後、その混合物を氷水で処理し、酢酸エチルで数回抽出した。その有機層を合して水で洗浄し、無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で脱水し、濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シクロヘキサン / EtOAc で溶離) で精製して、13.83 g (72.2%) の標題化合物が得られた。

30

<sup>1</sup>H-NMR (400.2 MHz, d6-DMSO, ピークリスト): =9.6748 (13.6); 8.4673 (9.4); 8.4637 (10.7); 8.4464 (10.4); 8.4428 (11.1); 8.3187 (0.3); 8.1982 (11.6); 8.1945 (12.3); 8.1874 (12.9); 8.1837 (12.3); 8.1273 (13.6); 8.1207 (13.9); 7.8018 (12.2); 7.7951 (11.6); 7.7797 (12.9); 7.7731 (12.8); 7.7646 (11.2); 7.7538 (10.5); 7.7438 (10.5); 7.7330 (10.1); 7.0951 (16.0); 7.0841 (0.4); 7.0730 (15.0); 3.3849 (0.4); 3.3524 (223.7); 3.3306 (1.0); 2.6774 (0.7); 2.6729 (1.0); 2.6684 (0.7); 2.6640 (0.3); 2.5264 (2.2); 2.5217 (3.4); 2.5129 (53.2); 2.5085 (115.2); 2.5039 (156.8); 2.4994 (111.7); 2.4949 (51.7); 2.3397 (0.3); 2.3354 (0.7); 2.3308 (1.0); 2.3263 (0.7); 2.3218 (0.3); 2.0769 (0.4); -0.0002 (0.6)

40

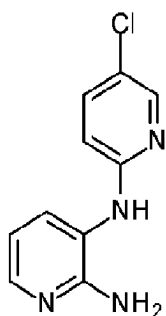
ESI 質量 [m/z]: 251.1 [M+H]<sup>+</sup>

【0334】

段階 2 : N<sup>3</sup> - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) ピリジン - 2 , 3 - ジアミン

50

## 【化 3 7】



10

## 【0335】

10.7 g (42.8 mmol) の 5 - クロロ - N - ( 2 - ニトロピリジン - 3 - イル ) ピリジン - 2 - アミンを 200 mL の酢酸エチルに溶解させ、次いで、48.3 g (214.1 mmol) の塩化スズ二水和物を添加し、その反応混合物を 70 で 1 時間攪拌した。室温まで冷却した後、その混合物を水で処理し、飽和  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  (水性) を用いて塩基性にして pH 9 - 10 とした。得られた混合物を EtOAc で数回抽出し、無水  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  で脱水した。濾過後、その濾液を減圧下で濃縮し、その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した (6.13 g、65% 収率)。

20

$^1\text{H-NMR}$  (400.2 MHz,  $\text{d}_6\text{-DMSO}$ , ピークリスト):  $\delta$  = 8.1607 (7.2); 8.0648 (7.2); 8.0583 (7.3); 7.7234 (16.0); 7.7149 (3.7); 7.7107 (7.2); 7.7046 (6.3); 7.7009 (3.1); 7.6080 (5.4); 7.6013 (5.2); 7.5857 (5.7); 7.5790 (5.5); 6.7264 (7.9); 6.7041 (7.6); 6.5794 (5.1); 6.5664 (4.5); 6.5610 (4.7); 6.5480 (4.9); 5.7173 (8.1); 3.3361 (16.7); 2.6718 (0.4); 2.5254 (1.0); 2.5117 (21.7); 2.5074 (45.4); 2.5029 (60.6); 2.4984 (43.0); 2.4940 (19.9); 2.3296 (0.4); 1.9896 (0.8); 1.1748 (0.4); 0.0079 (1.6); -0.0002 (49.2); -0.0085 (1.6)

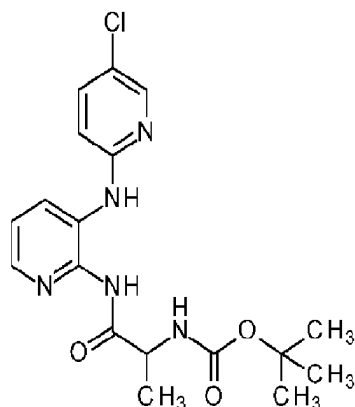
ESI 質量 [m/z]: 221.1 [M+H]<sup>+</sup>

## 【0336】

段階 3 : tert - ブチル [ 1 - ( { 3 - [ ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピリジン - 2 - イル } アミノ ) - 1 - オキソプロパン - 2 - イル ] カルバメート

30

## 【化 3 8】



40

## 【0337】

30 mL のジクロロメタンに溶解させた 2.68 g (14.2 mmol) の N - ( tert - ブトキシカルボニル ) アラニンと 7.2 mL (42.5 mmol) の N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( DIPEA 、 ヒューニツヒ塩基 ) と 6.45 g ( 17.0 m

50

mol) の [ O - ( 7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル ) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート ] ( H A T U ) を室温で 10 分間攪拌した。次いで、 3 . 12 g ( 14 . 18 mmol ) の N<sup>3</sup> - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) ピリジン - 2 , 3 - ジアミンを添加し、その反応混合物を室温で一晩攪拌した。さらに 3 mL のジメチルホルムアミドを添加した後、その混合物を室温でさらに 4 時間攪拌した。最後に、 1 . 34 g ( 7 . 08 mmol ) の N - ( tert - ブトキシカルボニル ) アラニンと 3 . 22 g ( 8 . 5 mmol ) の H A T U と 3 . 1 mL の D I P E A をジクロロメタンに溶解させて予め 10 分間攪拌した溶液を添加し、その混合物を室温で一晩攪拌した。その反応混合物を水で処理し、ジクロロメタンで数回抽出した。その有機層を合

10

して無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で脱水し、濾過した。その濾液を減圧下で濃縮した。その残渣を最初にシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( シクロヘキサン / EtOAc で溶離 ) で精製し、次いで、 prep - HPLC で精製して、 978 . 0 mg ( 17 . 0 % ) の標題化合物が得られた。

<sup>1</sup>H-NMR ( 400.2 MHz, d6-DMSO, ピークリスト): =10.2788 (1.0); 8.4417 (0.8); 8.4227 (0.8); 8.1456 (1.3); 8.1397 (1.4); 8.0827 (0.9); 8.0743 (0.9); 8.0333 (1.2); 7.6869 (0.9); 7.6804 (0.9); 7.6647 (1.0); 7.6582 (1.0); 7.3070 (1.3); 7.2954 (1.3); 7.2866 (1.4); 7.2750 (1.9); 7.2621 (0.7); 6.9163 (1.0); 6.8941 (1.0); 4.1486 (0.4); 4.1317 (0.6); 4.1154 (0.4); 3.3175 (15.4); 2.5239 (0.4); 2.5192 (0.7); 2.5106 (9.7); 2.5061 (20.5); 2.5015 (27.5); 2.4969 (19.2); 2.4924 (8.8); 1.3919 (16.0); 1.2698 (3.5); 1.2521 (3.4); -0.0002 (4.4)

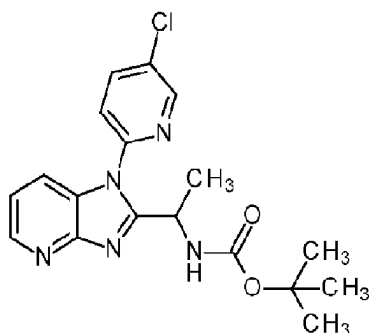
20

ESI 質量 [m/z]: 392.1 [M+H]<sup>+</sup>

【 0 3 3 8 】

段階 4 : tert - ブチル { 1 - [ 1 - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) - 1 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル } カルバメート

【 化 3 9 】



30

【 0 3 3 9 】

739 g ( 1 . 88 mmol ) の tert - ブチル [ 1 - ( { 3 - [ ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) アミノ ] ピリジン - 2 - イル } アミノ ) - 1 - オキソプロパン - 2 - イル ] カルバメートをジオキサソランに溶解させた溶液に 1 mL の酢酸を添加し、その反応混合物を 100 で 2 日間攪拌した。その混合物を減圧下で蒸発させた後、その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用した ( 702 mg、76% 収率、76.5% 純度 )。

40

<sup>1</sup>H-NMR ( 400.2 MHz, d6-DMSO, ピークリスト): =12.0060 (0.4); 8.7398 (1.3); 8.7341 (1.3); 8.4797 (1.4); 8.4761 (1.6); 8.4679 (1.5); 8.4643 (1.6); 8.2799 (0.8); 8.2737 (0.8); 8.2582 (0.9); 8.2525 (0.8); 8.2456 (0.6); 7.8147 (1.0); 7.8049 (1.6); 7.7967 (1.1); 7.7838 (1.4); 7.3692 (0.7); 7.3488 (0.8); 7.3113 (1.2); 7.2994 (1.2); 7.2911 (1.2); 7.2792 (1.1); 5.2270 (0.5); 5.2204 (0.4); 5.2018 (0.6); 5.1837 (0.4); 4.9090 (1.1); 4.8

50

399 (0.4); 4.3289 (0.8); 4.3252 (0.4); 4.0010 (0.7); 3.8322 (0.4); 3.8024 (0.5); 3.6092 (0.7); 3.6014 (1.1); 3.5951 (0.6); 3.5900 (0.5); 3.5834 (0.4); 3.5727 (0.5); 3.5669 (0.7); 3.5568 (0.5); 3.5508 (0.6); 3.5460 (0.5); 3.5296 (0.7); 3.5213 (0.8); 3.4993 (0.6); 3.4939 (0.9); 3.4317 (0.3); 3.4276 (0.4); 3.4045 (0.4); 3.3090 (3.6); 3.1705 (0.5); 3.1541 (0.5); 3.1427 (0.4); 3.1261 (0.4); 2.9943 (1.0); 2.8135 (0.5); 2.6908 (2.8); 2.5195 (0.4); 2.5108 (7.7); 2.5064 (16.8); 2.5019 (23.4); 2.4974 (17.2); 2.4931 (8.5); 2.0819 (0.3); 2.0512 (0.6); 1.5027 (2.9); 1.4857 (2.8); 1.3748 (0.6); 1.3654 (2.2); 1.3279 (0.8); 1.2527 (16.0); 1.1257 (0.7); 1.1088 (0.6); 1.0466 (0.8); 1.0314 (0.8); -0.0002 (1.8)

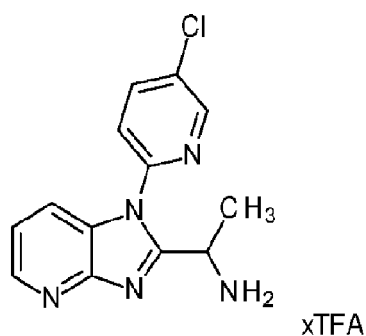
ESI 質量 [m/z]: 374.1 [M+H]<sup>+</sup>

10

【0340】

段階5: 1 - [1 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル] エタンアミン トリフルオロアセテート (INT - 8)

【化40】



20

【0341】

700 mg の tert - ブチル { 1 - [ 1 - ( 5 - クロロピリジン - 2 - イル ) - 1H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル } カルバメートを 25 mL のジオキサンに溶解させた溶液に、2.88 mL (37.4 mmol) の TFA を添加した。その反応混合物を、3 時間、室温で一晩攪拌した。溶媒を蒸発させ、残った残渣は、そのまま次の段階で使用した (735 mg、100% 収率)。

30

<sup>1</sup>H-NMR (600.1 MHz, d6-DMSO, ピークリスト): =8.8227 (1.9); 8.8220 (1.9); 8.8184 (2.0); 8.8176 (1.9); 8.7373 (1.4); 8.7313 (1.4); 8.6617 (0.1); 8.6299 (0.1); 8.6251 (0.1); 8.5961 (1.6); 8.5937 (1.7); 8.5883 (1.8); 8.5858 (1.7); 8.4440 (0.1); 8.3713 (1.7); 8.3669 (1.6); 8.3570 (1.8); 8.3526 (1.7); 8.3167 (0.2); 8.2605 (0.2); 8.2498 (0.2); 8.2288 (0.1); 8.2119 (0.1); 8.1415 (0.2); 8.1378 (0.4); 8.1266 (0.2); 8.1222 (0.1); 8.0741 (1.6); 8.0716 (1.7); 8.0604 (1.8); 8.0579 (1.8); 7.9260 (2.2); 7.9252 (2.1); 7.9117 (2.1); 7.9109 (2.0); 7.7110 (0.1); 7.7065 (0.1); 7.6963 (0.1); 7.6917 (0.1); 7.4599 (1.6); 7.4520 (1.6); 7.4462 (1.6); 7.4383 (1.6); 4.9961 (0.2); 4.9873 (0.4); 4.9778 (0.5); 4.9671 (0.4); 4.9570 (0.2); 4.7158 (1.1); 4.5296 (0.1); 4.5224 (0.1); 4.5145 (0.1); 4.3305 (0.1); 4.0693 (0.2); 3.7756 (0.2); 3.7713 (0.1); 3.7681 (0.2); 3.7650 (0.1); 3.7606 (0.1); 3.7139 (0.7); 3.6822 (0.1); 3.6743 (0.1); 3.6664 (0.1); 3.5698 (16.0); 3.3937 (0.1); 3.0159 (1.1); 2.8890 (1.0); 2.6922 (4.5); 2.6205 (0.2); 2.6174 (0.3); 2.6144 (0.2); 2.5564 (0.1); 2.5471 (0.2); 2.5378 (0.2); 2.5264 (0.7); 2.5233 (0.8); 2.5202 (0.8); 2.5115 (14.5); 2.5085 (32.2); 2.5054 (45.2); 2.5023 (32.4); 2.4993 (14.8); 2.3924 (0.2); 2.3893 (0.3); 2.3862 (0.2); 1.9102 (0.3); 1.5564 (5.1); 1.5450 (5.1); 1.

40

50



5359 (0.5); 1.4161 (0.3); 1.4045 (0.3); 1.3942 (0.2); 1.3822 (0.2); 1.3577 (0.3); 1.3088 (0.5); 1.2973 (0.5); 1.2365 (0.4); 1.1125 (0.2); 1.0446 (0.2); 1.0345 (0.2); 0.0968 (0.3); 0.0054 (2.1); -0.0001 (72.5); -0.0057 (2.3); -0.1003 (0.3)

ESI 質量 [m/z]: 274.3 [M +H-TFA]<sup>+</sup>

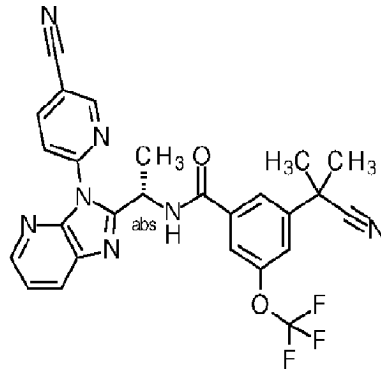
【0342】

実施例

N - [ ( 1 S ) - 1 - [ 3 - ( 5 - シアノ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル ] - 3 - メチルスルホニル - 5 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンズアミド ( 実施例 I - 1 )

10

【化41】



20

【0343】

35.5 mg (0.13 mmol) の 3 - ( 1 - シアノ - 1 - メチル - エチル ) - 5 - ( トリフルオロメトキシ ) 安息香酸を 1 mL の N , N - ジメチルホルムアミド ( DMF ) に溶解させた溶液に、0.06 mL (0.33 mmol) の N , N - ジイソプロピルエチルアミン ( DIPEA ; ヒューニツヒ塩基 ) 及び 86.3 mg (0.22 mmol) の [ O - ( 7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル ) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート ] ( HATU ) を添加した。その混合物を室温で 10 分間攪拌した。次いで、39.1 mg (0.13 mmol) の 6 - [ 2 - [ ( 1 S ) - 1 - アミノエチル ] イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ピリジン - 3 - カルボニトリル 塩酸塩を添加し、その反応混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、その反応混合物を分取 HPLC ( 水 / アセトニトリルで溶離 ) で直接精製して、29.1 mg ( 41.4 % 収率 ) の 標 題 化 合 物 が 得 ら れ た。

30

ESI 質量 [m/z]: 520.2 [M+H]<sup>+</sup>

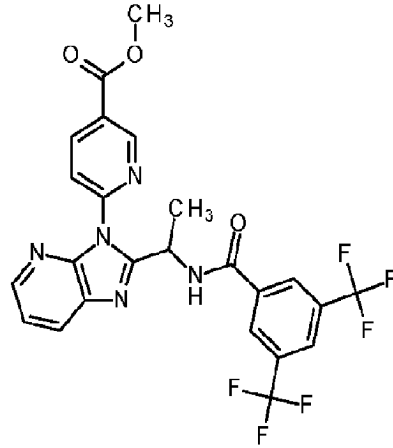
<sup>1</sup>H - NMR : NMR ピークリスト ( 表 1 ) を 参 照 さ れ たい。

【0344】

メチル 6 - ( 2 - { 1 - [ 3 , 5 - ビス ( トリフルオロメチル ) ベンズアミド ] エチル } - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ) ニコチネート ( 実施例 I - 22 )

40

## 【化 4 2】



10

## 【0345】

485.0 mg (1.45 mmol) のメチル 6 - [ 2 - ( 1 - アミノエチル ) - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ] ニコチネート 塩酸塩を 10 mL のジクロロメタンに溶解させた溶液に 0.61 mL (4.36 mmol) のトリエチルアミンを添加し、その混合物を室温で 30 分間攪拌し、続いて、予め 2 mL のジクロロメタンに溶解させた 442.0 mg (1.60 mmol) の 3,5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンゾイルクロリドを添加した。その反応混合物を室温で一晩攪拌した。その混合物を 5 % リン酸二水素ナトリウム (水性) で洗浄し、ジクロロメタンで数回抽出した。その有機層を合して無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> で脱水し、濾過した。その濾液を減圧下で濃縮した。その粗製物質を 6 mL のアセトニトリルに懸濁させ、対応する沈澱物を濾過して乾燥させ、一方、その濾液を、次いで、分取 HPLC (水 / アセトニトリルで溶離) で精製して、288 mg (36.0%) の標題化合物が得られた。

20

ESI 質量 [m/z]: 538.2 [M+H]<sup>+</sup>

<sup>1</sup>H - NMR : NMR ピークリスト (表 1) を参照されたい。

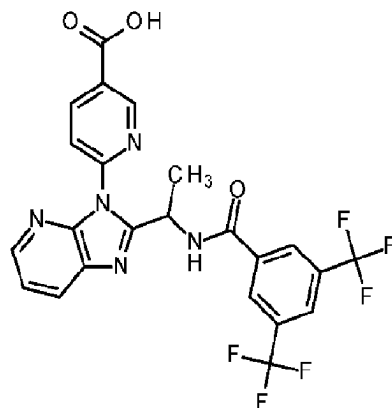
30

## 【0346】

6 - ( 2 - { 1 - [ 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミド ] エチル } - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ) - N , N - ジメチルニコチンアミド (実施例 I - 26)

段階 1 : 6 - ( 2 - { 1 - [ 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミド ] エチル } - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ) ニコチン酸

## 【化 4 3】



40

50

## 【0347】

270 mg (0.50 mmol) のメチル 6 - ( 2 - { 1 - [ 3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド]エチル} - 3H - イミダゾ[4,5-b]ピリジン - 3 - イル)ニコチネート(実施例 I - 22 から)を THF / 水(6 mL / 0.6 mL)の混合物に溶解させた溶液に 42 mg (1.0 mmol) の水酸化リチウムを添加し、その混合物を室温で一晩攪拌した。その混合物を酢酸エチルで稀釈し、HCl 10%を用いて酸性にした。その水相を分離し、酢酸エチルで数回抽出した。その有機層を合して無水 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で脱水し、濾過後、その濾液を減圧下で濃縮した。その粗製物質は、それ以上精製することなく次の段階で使用して、260 mg (82.0%) の標題化合物が得られた。

10

<sup>1</sup>H-NMR (400.2 MHz, CD<sub>3</sub>CN, ピークリスト): =9.1430 (4.6); 9.1376 (4.8); 8.8535 (0.4); 8.6401 (0.9); 8.5111 (3.1); 8.5054 (3.0); 8.4903 (4.0); 8.4844 (3.4); 8.4396 (0.5); 8.4351 (0.5); 8.4076 (3.3); 8.4045 (3.4); 8.3955 (3.4); 8.3927 (3.5); 8.2350 (1.1); 8.1991 (10.3); 8.1806 (0.7); 8.1666 (0.4); 8.1485 (0.4); 8.1406 (3.3); 8.1374 (3.3); 8.1205 (8.0); 8.0573 (5.6); 8.0364 (5.8); 8.0222 (1.3); 7.9346 (0.7); 7.5910 (0.4); 7.4266 (3.1); 7.4145 (3.1); 7.4065 (3.0); 7.3944 (2.9); 6.9744 (0.8); 6.0060 (0.6); 5.9886 (2.3); 5.9706 (3.4); 5.9526 (2.3); 5.9355 (0.5); 4.0862 (0.5); 4.0679 (1.5); 4.0502 (1.5); 4.0319 (0.5); 3.9236 (0.4); 3.1779 (0.3); 2.9701 (0.3); 2.9638 (0.3); 2.9029 (0.4); 2.8856 (0.4); 2.8600 (0.4); 2.8542 (0.4); 2.8504 (0.4); 2.8003 (0.5); 2.7166 (0.7); 2.6825 (0.8); 2.6260 (1.0); 2.5965 (1.2); 2.5664 (1.4); 2.5415 (1.6); 2.4809 (3.2); 2.4762 (4.2); 2.4717 (5.0); 2.4670 (4.4); 2.4629 (3.7); 2.2422 (43.0); 2.1221 (8.4); 2.1150 (8.3); 2.1089 (8.3); 2.1027 (7.3); 2.0964 (6.3); 2.0526 (4.0); 1.9994 (2.3); 1.9933 (2.2); 1.9728 (8.9); 1.9657 (7.3); 1.9538 (124.1); 1.9477 (207.5); 1.9415 (297.5); 1.9354 (205.2); 1.9292 (106.5); 1.8818 (1.4); 1.8742 (1.4); 1.8369 (1.0); 1.8190 (1.0); 1.8022 (1.1); 1.7826 (1.6); 1.7762 (2.2); 1.7648 (16.0); 1.7476 (15.0); 1.6748 (1.7); 1.6569 (1.6); 1.6204 (0.5); 1.6009 (0.6); 1.5826 (0.6); 1.5701 (0.5); 1.5591 (0.8); 1.5408 (0.8); 1.5038 (1.1); 1.4860 (1.1); 1.4495 (0.4); 1.4322 (0.4); 1.3869 (11.4); 1.3552 (0.5); 1.3402 (1.0); 1.3156 (1.0); 1.2851 (1.8); 1.2699 (5.2); 1.2405 (1.0); 1.2218 (2.4); 1.2164 (2.4); 1.2039 (4.3); 1.2001 (3.4); 1.1863 (2.1); 1.1637 (0.4); 1.1463 (0.4); 1.0830 (0.5); 1.0607 (0.6); 0.8980 (0.5); 0.8818 (1.1); 0.8590 (1.1); 0.8415 (0.8); 0.1462 (1.2); 0.0080 (7.3); -0.0002 (234.6); -0.0078 (9.7); -0.0411 (0.4); -0.1497 (1.1)

20

30

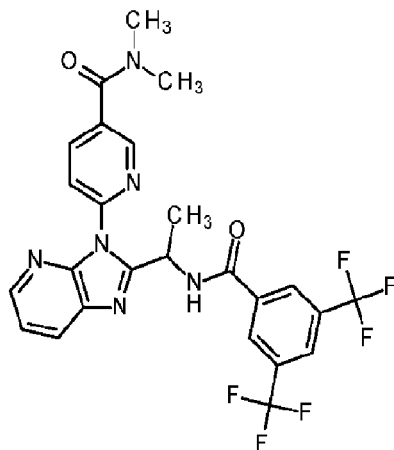
ESI 質量 [m/z]: 524.3 [M+H]<sup>+</sup>

## 【0348】

段階 2 : 6 - ( 2 - { 1 - [ 3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド]エチル} - 3H - イミダゾ[4,5-b]ピリジン - 3 - イル) - N , N - ジメチルニコチンアミド(実施例 I - 26)

40

## 【化 4 4】



10

## 【0349】

60 mg (0.11 mmol) の 6 - ( 2 - { 1 - [ 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミド ] エチル } - 3 H - イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 3 - イル ) ニコチン酸を 2.0 mL のジクロロメタンに溶解させた溶液に、0.06 mL (0.32 mmol) の N, N - ジイソプロピルエチルアミン (DIPEA、ヒューニッヒ塩基) 及び 52.0 mg (0.14 mmol) の [ O - ( 7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル ) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート ] (HATU) を添加し、その混合物を室温で 30 分間攪拌した。次いで、1 mL のジクロロメタンに予め溶解させた 0.086 mL (0.17 mmol) のジメチルアミン (THF 中の 2 M 溶液) を添加し、その反応混合物を室温で一晩攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させた後、その粗製物質を分取 HPLC (水 / アセトニトリルで溶離) で直接精製して、40 mg (64.0%) の標題化合物が得られた。

20

ESI 質量 [m/z]: 551.2 [M+H]<sup>+</sup>

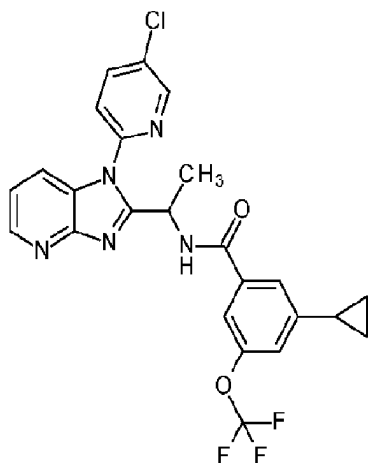
<sup>1</sup>H - NMR : NMR ピークリスト (表 1) を参照されたい。

## 【0350】

N - [ 1 - [ 1 - ( 5 - クロロ - 2 - ピリジル ) イミダゾ [ 4 , 5 - b ] ピリジン - 2 - イル ] エチル ] - 3 - シクロプロピル - 5 - ( トリフルオロメトキシ ) ベンズアミド ( 実施例 I - 33 )

30

## 【化 4 5】



40

## 【0351】

67.0 mg (0.27 mmol) の 3 - シクロプロピル - 5 - ( トリフルオロメトキシ

50

シ) 安息香酸を 2 mL の N, N - ジメチルホルムアミドに溶解させた溶液に、0.12 mL (0.70 mmol) の N, N - ジイソプロピルエチルアミン (DIPEA、ヒューニツヒ塩基) 及び 180.0 mg (0.47 mmol) の [O - (7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート] (HATU) を添加し、その混合物を室温で 10 分間攪拌した。次いで、104.7 mg (0.27 mmol) の 1 - [1 - (5 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1H - イミダゾ [4, 5 - b] ピリジン - 2 - イル] エタンアミン トリフルオロアセテートを添加し、その反応混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、その反応混合物を分取 HPLC (水 / アセトニトリルで溶離) で直接精製した。得られた生成物を DCM に溶解させ、塩基性カートリッジで濾過した。その濾液を減圧下で蒸発させて、53 mg (38.0%) の標題化合物が得られた。

10

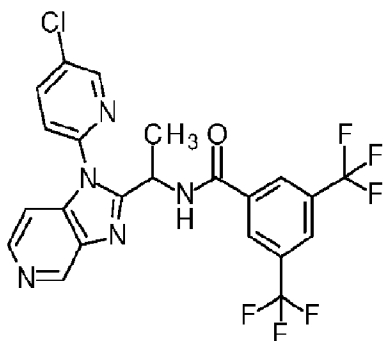
ESI 質量 [m/z]: 502.2 [M+H]<sup>+</sup>

<sup>1</sup>H - NMR: NMR ピークリスト (表 1) を参照されたい。

【0352】

N - [1 - [1 - (5 - クロロ - 2 - ピリジル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] エチル] - 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミド (実施例 I - 39)

【化 46】



20

【0353】

50.0 mg (0.194 mmol) の 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) 安息香酸を 2 mL の N, N - ジメチルホルムアミド (DMF) に溶解させた溶液に、0.05 mL (0.27 mmol) の N, N - ジイソプロピルエチルアミン (DIPEA; ヒューニツヒ塩基) 及び 88.4 mg (0.23 mmol) の [O - (7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート] (HATU) を添加した。その混合物を室温で 30 分間攪拌した。次いで、79.5 mg (0.29 mmol) の rac - 1 - [1 - (5 - クロロ - 2 - ピリジル) イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 2 - イル] エタンアミン 塩酸塩 (INT - 7) を添加し、その反応混合物を室温で一晩攪拌した。別の、1 mL の N, N - ジメチルホルムアミド (DMF) の中の 50.0 mg (0.194 mmol) の 3, 5 - ビス (トリフルオロメチル) 安息香酸を、0.05 mL (0.27 mmol) の N, N - ジイソプロピルエチルアミン (DIPEA; ヒューニツヒ塩基) 及び 88.4 mg (0.23 mmol) の [O - (7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート] (HATU) と混合させ、室温で 30 分間攪拌し、先の反応混合物に添加した。その混合物を室温で 3 日間攪拌した。次いで、その反応混合物を分取 HPLC (水 / アセトニトリルで溶離) で直接精製して、6.8 mg (6.1% 収率) の標題化合物が得られた。

30

40

ESI 質量 [m/z]: 514.3 [M+H]<sup>+</sup>

<sup>1</sup>H - NMR: NMR ピークリスト (表 1) を参照されたい。

【0354】

50

## 分析方法

以下に記載されている分析方法は、それぞれの分析的測定の手順がそれぞれの箇所で個別に説明されている場合を除き、本文書全体における全ての情報を示している。

### 【0355】

#### 質量分析

酸性クロマトグラフィー条件下での LC - MS による  $[M + H]^+$  又は  $M^-$  の測定は、溶離液として、1 リットルのアセトニトリル当たり 1 mL のギ酸及び 1 リットルのミリポア水当たり 0.9 mL のギ酸を用いて実施した。カラム「Zorbax Eclipse Plus C18 50 mm x 2.1 mm」を使用した。カラムオープンの温度は、55 であった。

10

### 【0356】

#### 機器：

LC - MS 3：SQD 2 質量分析計と Sample Manager オートサンプラーが付いている Waters UPLC。直線勾配：0.0 1.70 分 10% アセトニトリル 95% アセトニトリル、1.70 2.40 分 一定 95% アセトニトリル、流量：0.85 mL / 分。

### 【0357】

LC - MS 6、及び、LC - MS 7：Agilent 1290 LC、Agilent MSD、HTS PAL オートサンプラー。直線勾配：0.0 1.80 分 10% アセトニトリル 95% アセトニトリル、1.80 2.50 分、一定 95% アセトニトリル、流量：1.0 mL / 分。

20

### 【0358】

中性クロマトグラフィー条件下での LC - MS による  $[M + H]^+$  の測定は、溶離液として、アセトニトリル及びミリポア水 (79 mg / L の炭酸アンモニア含有) を使用して実施した。

### 【0359】

#### 機器：

LC - MS 4：QDA 質量分析計と FTN オートサンプラーが付いている Waters IClass Acquity (カラム：Waters Acquity 1.7  $\mu$ m 50 mm x 2.1 mm、オープン温度：45 )。直線勾配：0.0 2.10 分 10% アセトニトリル 95% アセトニトリル、2.10 3.00 分 一定 95% アセトニトリル、流量：0.7 mL / 分。

30

### 【0360】

LC - MS 8：QDA 質量分析計と FTN オートサンプラーが付いている Waters IClass Acquity (カラム：Waters Acquity 1.7  $\mu$ m 50 mm x 2.1 mm、オープン温度：45 )。直線勾配：0.0 2.10 分 10% アセトニトリル 95% アセトニトリル、2.10 3.00 分 一定 95% アセトニトリル、流量：0.7 mL / 分。

### 【0361】

保持時間インデックスは、全ての場合において、3 個 ~ 16 個の炭素を有する同族の 1 連の直鎖アルカン - 2 - オンに基づいて計算し、ここで、最初のアルカノンのインデックスを 300 に設定し、最後のアルカノンのインデックスを 1600 に設定し、そして、その間のインデックスは、対応するように、連続するアルカノンの値の間で線形補間を用いて計算した。

40

### 【0362】

#### NMR

$^1\text{H}$  - NMR データの測定は、1.7 mm TCI プロブヘッドを備えた「Bruker Avance III 400 MHz 分光計」を用いて、対照標準 (0.00 ppm) としてテトラメチルシランを使用して実施し、そして、その測定値は、通常、溶媒  $\text{CD}_3\text{CN}$ 、 $\text{CDCl}_3$  又は  $d_6$  - DMSO の中の溶液から記録した。あるいは、5 mm

50

C P N M P プローブヘッドを備えた「Bruker Avance III 600 MHz 機器」又は5 mm T C I プローブヘッドを備えた「Bruker Avance NEO 600 MHz 機器」を当該測定に使用した。一般に、当該測定は、プローブヘッド温度298 Kで実施した。別の測定温度は、明示されている。

【0363】

選択された実施例のNMRデータは、慣習的な形態(値、多重項分裂、水素原子の数)で記載されているか、又は、NMRピークリストとして記載されている。

【0364】

#### NMRピークリスト法

選択された実施例の $^1\text{H}$ -NMRデータは、 $^1\text{H}$ -NMRピークリストの形態で記載されている。各シグナルピークに対して、値(ppm)及び丸括弧内のシグナル強度が記載されている。値-シグナル強度数の対の間に、区切り記号としてセミコロンが記載されている。

【0365】

従って、1つの例のピークリストは、以下の形態をとる：

$\nu_1$  (強度 $\nu_1$ ) ;  $\nu_2$  (強度 $\nu_2$ ) ; . . . ;  $\nu_i$  (強度 $\nu_i$ ) ; . . . ;  $\nu_n$  (強度 $\nu_n$ ) 。

【0366】

先鋭なシグナルの強度は、 $^1\text{H}$ -NMRスペクトルの印刷された図におけるシグナルの高さ(cm)と相関し、シグナル強度の真の関係を示している。幅が広いシグナルからの数種類のピーク又は該シグナルの中央、及び、当該スペクトルの中の最も強いシグナルと比較したそれらの相対的強度が、示され得る。

【0367】

$^1\text{H}$ スペクトルに関する化学シフトを較正するために、テトラメチルシランを使用するか、又は、当該サンプルがテトラメチルシランを含んでいない場合には、その溶媒の化学シフトを使用する。従って、 $^1\text{H}$ -NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0368】

$^1\text{H}$ -NMRピークのリストは、古典的な $^1\text{H}$ -NMRのプリントと等価であり、通常、 $^1\text{H}$ -NMRの古典的な解釈でも記載される全てのピークを含んでいる。

【0369】

さらに、それらは、古典的な $^1\text{H}$ -NMRのプリントのように、溶媒のシグナル、当該化合物の立体異性体(これも、場合により、本発明の対象の一部である)のシグナル及び/又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

【0370】

$^1\text{H}$ -NMRの溶媒のシグナル、テトラメチルシランのシグナル及び対応する溶媒中の水のシグナルは、極めて高い強度値を有しているため、相対的強度の較正から除外される。

【0371】

平均して、本発明による化合物の立体異性体のピーク及び/又は不純物のピークは、通常、本発明の化合物(例えば、90%を超える純度を有する本発明の化合物)のピークよりも低い強度を有している。

【0372】

そのような立体異性体及び/又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、当該対応するピークは、「副産物の指紋(side-products-fingerprints)」によって、当該調製方法の再現性を確認するのに役立つ。

【0373】

目標化合物のピークを既知方法(MestreC、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用)で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを割り当てることができる。この割り当ては、 $^1\text{H}$ -NMRの古典的な解釈における通常のピークピッキングに類似しているであろう。

10

20

30

40

50

## 【0374】

使用した溶媒は、パラメーター「溶媒」、分光器周波数「観測周波数」及び分光器タイプ「分光器/データシステム」を使用して、JCAMPファイルから抽出することができる。

## 【0375】

$^{13}\text{C}$ -NMRデータは、 $^1\text{H}$ -NMRデータと同様に、広帯域デカップリングされた $^{13}\text{C}$ -NMRスペクトルからのピークリストとして示される。 $^{13}\text{C}$ -NMRの溶媒シグナル及びテトラメチルシランは、これらのシグナルが非常に高い強度を有し得るため、相対強度の校正から除外される。

## 【0376】

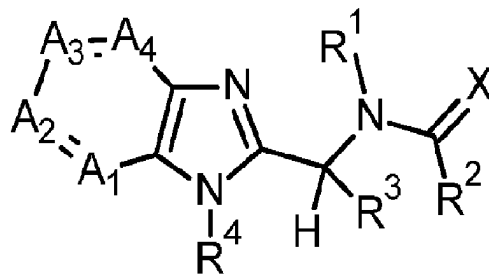
ピークリストによるNMRデータの記載に関するさらなる詳細は、「Research Disclosure Database Number 564025」の刊行物「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」の中に開示されている。

## 【0377】

下記表1に記載されている本発明の化合物は、同様に、上記で記載されている調製実施例に準じて又は該調製実施例と同様にして得られる、式(I)〔式中、 $\text{R}^1$ は水素であり、及び、 $\text{X}$ は酸素である〕で表される好ましい化合物である。

## 【0378】

## 【化47】



(I)

## 【0379】

10

20

30

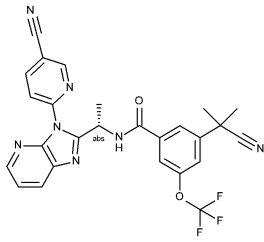
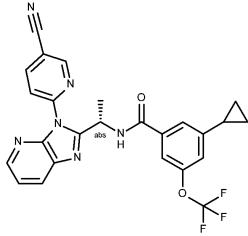
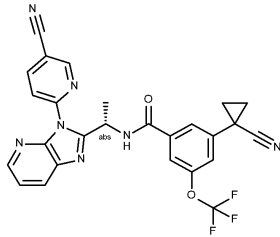
40

50



【表 2】

表 1

実施例	構造 <sup>1)</sup>	NMR ピークリスト <sup>2)</sup>	ESI 質量 (m/z) <sup>3)</sup>
I-1		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.2021 (0.9); 9.1837 (0.9); 9.0596 (1.4); 9.0556 (1.4); 9.0540 (1.4); 8.5575 (1.1); 8.5518 (1.0); 8.5364 (1.2); 8.5307 (1.2); 8.3980 (1.0); 8.3944 (1.2); 8.3860 (1.1); 8.3824 (1.2); 8.2440 (1.1); 8.2405 (1.1); 8.2240 (1.2); 8.2204 (1.1); 8.1271 (1.6); 8.1060 (1.4); 7.8347 (1.0); 7.8310 (1.8); 7.8274 (1.2); 7.6461 (1.2); 7.5876 (1.2); 7.4634 (1.1); 7.4514 (1.0); 7.4434 (1.0); 7.4314 (1.1); 5.8701 (0.6); 5.8525 (0.9); 5.8348 (0.6); 3.3452 (13.2); 2.5272 (0.4); 2.5226 (0.6); 2.5137 (8.1); 2.5093 (17.3); 2.5048 (23.4); 2.5003 (16.9); 2.4959 (8.0); 2.0783 (1.5); 1.7467 (1.1); 1.7201 (3.6); 1.7098 (16.0); 1.7034 (4.5); -0.0002 (3.7)	520.2
I-2		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.0557 (7.1); 9.0516 (6.7); 9.0502 (6.5); 9.0243 (4.3); 9.0059 (4.3); 8.5604 (5.2); 8.5547 (4.9); 8.5393 (5.6); 8.5336 (5.4); 8.3888 (5.0); 8.3853 (5.4); 8.3768 (5.4); 8.3733 (5.3); 8.2321 (5.2); 8.2286 (5.1); 8.2121 (5.8); 8.2085 (5.2); 8.1150 (7.2); 8.0939 (6.6); 7.4555 (5.1); 7.4435 (4.9); 7.4355 (4.8); 7.4235 (4.8); 7.3075 (9.2); 7.3037 (9.6); 7.2546 (5.9); 5.8553 (0.6); 5.8380 (2.8); 5.8204 (4.2); 5.8027 (2.8); 5.7855 (0.6); 3.3319 (95.5); 2.6767 (0.8); 2.6721 (1.1); 2.6676 (0.8); 2.5254 (3.5); 2.5118 (68.2); 2.5076 (134.6); 2.5032 (174.2); 2.4987 (122.4); 2.4944 (56.2); 2.3344 (0.8); 2.3300 (1.1); 2.3256 (0.8); 2.0767 (0.9); 2.0365 (0.8); 2.0240 (1.7); 2.0155 (1.9); 2.0032 (3.4); 1.9907 (2.0); 1.9823 (1.8); 1.9696 (0.9); 1.6958 (16.0); 1.6786 (15.8); 1.0356 (2.0); 1.0245 (5.8); 1.0189 (6.1); 1.0084 (3.2); 1.0036 (5.8); 0.9981 (5.8); 0.9878 (2.2); 0.7627 (2.4); 0.7519 (6.9); 0.7469 (6.6); 0.7397 (6.3); 0.7347 (7.1); 0.7232 (1.9); 0.1458 (0.9); 0.0078 (7.8); -0.0002 (199.0); -0.0085 (6.2); -0.1497 (0.9)	493.5
I-3		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.1845 (4.6); 9.1659 (4.7); 9.0615 (7.3); 9.0576 (7.1); 9.0560 (7.3); 8.5657 (4.8); 8.5601 (4.8); 8.5446 (5.2); 8.5390 (5.4); 8.3954 (4.5); 8.3922 (5.8); 8.3834 (4.9); 8.3802 (5.9); 8.3186 (0.4); 8.2394 (4.8); 8.2361 (5.8); 8.2195 (5.3); 8.2161 (6.0); 8.1296 (7.6); 8.1085 (7.1); 7.6224 (8.9); 7.5245 (6.5); 7.4608 (4.8); 7.4484 (8.5); 7.4411 (10.5); 7.4288 (4.7); 5.8730 (0.6); 5.8560 (2.7); 5.8383 (4.3); 5.8207 (2.8); 5.8036 (0.6); 3.3310 (188.4); 3.3075 (0.4); 2.6758 (1.3); 2.6717 (1.9); 2.6676 (1.5); 2.5249 (4.4); 2.5070 (216.7); 2.5027 (298.2); 2.4986 (230.6); 2.4608 (0.4); 2.3339 (1.4); 2.3296 (1.9); 2.3254 (1.5); 2.0761 (6.6); 1.8582 (0.3); 1.8396 (2.8); 1.8306 (7.8); 1.8240 (8.8); 1.8140 (3.8); 1.7976 (0.5); 1.7851 (0.4); 1.7081 (16.0); 1.6910 (16.0); 1.6673 (0.7); 1.6391 (1.0); 1.6333 (0.7); 1.6205 (6.8); 1.6151 (4.6); 1.6093 (7.0); 1.5995 (5.0); 1.5960 (4.8); 1.5853 (0.6); 1.5770 (0.8); 1.2318 (0.4); 1.2229 (0.4); 1.2171 (0.3); 1.2058	518.4

10

20

30

40

		(0.3); 0.1458 (1.2); 0.0179 (0.3); 0.0078 (8.2); -0.0002 (261.2); -0.0082 (10.2); -0.1498 (1.2)	
I-4		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.4356 (4.3); 9.4171 (4.5); 9.0896 (6.6); 9.0881 (7.1); 9.0841 (7.2); 9.0824 (6.8); 8.5834 (5.6); 8.5777 (5.4); 8.5623 (6.2); 8.5566 (6.2); 8.4015 (5.4); 8.3979 (5.8); 8.3895 (5.6); 8.3860 (5.8); 8.3182 (1.4); 8.2797 (5.6); 8.2762 (10.0); 8.2727 (5.9); 8.2403 (5.5); 8.2367 (5.7); 8.2203 (6.2); 8.2167 (5.9); 8.1650 (7.3); 8.1635 (7.5); 8.1439 (6.7); 8.1423 (6.8); 8.0588 (6.0); 7.9932 (0.4); 7.9501 (6.0); 7.4634 (5.5); 7.4514 (5.4); 7.4434 (5.2); 7.4314 (5.4); 5.9003 (0.6); 5.8827 (2.8); 5.8651 (4.4); 5.8473 (2.8); 5.8301 (0.6); 3.4040 (0.3); 3.3732 (2.8); 3.3645 (0.9); 3.3368 (62.9); 3.3303 (610.6); 3.2997 (0.6); 3.2843 (0.3); 2.6758 (3.9); 2.6713 (5.5); 2.6668 (4.1); 2.6622 (1.9); 2.6191 (0.4); 2.6140 (0.4); 2.5248 (13.3); 2.5201 (19.4); 2.5112 (303.9); 2.5069 (643.6); 2.5023 (863.6); 2.4978 (616.5); 2.4934 (289.2); 2.4318 (0.5); 2.4106 (0.4); 2.3337 (3.8); 2.3291 (5.4); 2.3247 (3.8); 2.3202 (1.8); 1.7181 (16.0); 1.7009 (16.0); 1.2477 (1.8); 1.2346 (2.3); 1.2184 (1.6); 0.1460 (4.1); 0.0411 (0.4); 0.0380 (0.4); 0.0339 (0.5); 0.0292 (0.6); 0.0213 (0.8); 0.0165 (1.1); 0.0080 (30.9); -0.0002 (1009.5); -0.0085 (32.7); -0.0279 (0.8); -0.0316 (0.7); -0.0365 (0.4); -0.0432 (0.4); -0.0681 (0.5); -0.1495 (4.2)	531.0
I-5		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.3635 (4.4); 9.3454 (4.5); 9.0988 (7.0); 9.0933 (7.0); 8.7591 (0.3); 8.7519 (0.3); 8.5978 (5.0); 8.5921 (4.8); 8.5766 (5.4); 8.5710 (5.4); 8.3992 (4.7); 8.3958 (5.4); 8.3872 (5.1); 8.3838 (5.4); 8.3186 (0.7); 8.2984 (0.5); 8.2373 (5.0); 8.2339 (5.3); 8.2174 (5.5); 8.2139 (5.4); 8.1806 (0.4); 8.1673 (7.9); 8.1558 (4.8); 8.1522 (10.1); 8.1479 (11.6); 8.1293 (5.5); 8.1249 (9.2); 8.1207 (5.0); 8.0713 (0.4); 8.0402 (5.7); 8.0360 (8.8); 8.0320 (5.4); 7.9088 (0.5); 7.8858 (0.4); 7.4609 (5.0); 7.4489 (4.8); 7.4408 (4.8); 7.4288 (4.8); 5.8843 (0.6); 5.8674 (2.8); 5.8498 (4.4); 5.8322 (2.8); 5.8150 (0.6); 5.7587 (11.8); 3.3954 (0.4); 3.3667 (0.5); 3.3494 (2.1); 3.3307 (323.5); 3.3073 (46.4); 2.6759 (2.2); 2.6714 (3.1); 2.6670 (2.3); 2.5614 (0.4); 2.5565 (0.5); 2.5248 (7.9); 2.5200 (11.3); 2.5110 (173.1); 2.5069 (368.0); 2.5024 (499.5); 2.4980 (365.3); 2.4680 (1.0); 2.4636 (0.9); 2.3336 (2.3); 2.3293 (3.2); 2.3249 (2.4); 1.7042 (16.0); 1.6870 (15.9); 1.3510 (0.6); 1.2965 (0.3); 1.2579 (0.7); 1.2436 (2.6); 1.2290 (3.2); 1.2125 (1.4); 1.1929 (0.6); 1.1882 (0.6); 1.1199 (0.3); 0.8525 (0.4); 0.1459 (2.7); 0.0272 (0.4); 0.0079 (17.6); -0.0002 (581.2); -0.0082 (22.2); -0.0207 (0.9); -0.0257 (0.6); -0.0293 (0.4); -0.0352 (0.4); -0.0382 (0.5); -0.1496 (2.7)	481.0

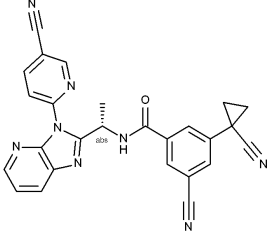
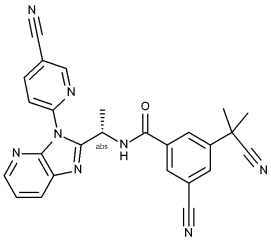
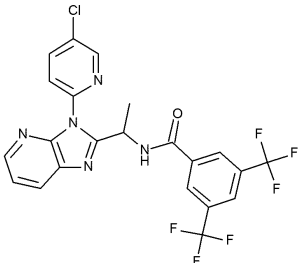
10

20

30

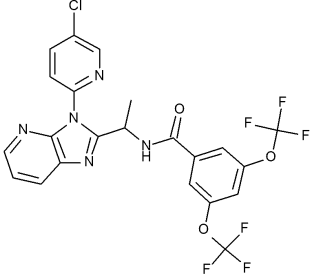
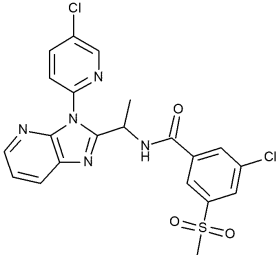
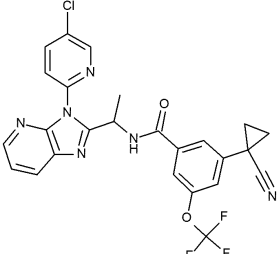
40

50

I-6		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.2286 (3.9); 9.2103 (4.0); 9.0862 (6.7); 9.0821 (6.2); 9.0805 (6.6); 8.5882 (5.0); 8.5825 (4.9); 8.5671 (5.5); 8.5614 (5.5); 8.3991 (4.9); 8.3955 (5.5); 8.3872 (5.4); 8.3835 (5.5); 8.2377 (5.0); 8.2341 (5.2); 8.2177 (5.6); 8.2141 (5.4); 8.1628 (6.8); 8.1615 (7.2); 8.1417 (6.2); 8.1403 (6.8); 8.0493 (5.1); 8.0458 (9.7); 8.0422 (5.8); 7.9280 (4.7); 7.9236 (8.9); 7.9194 (5.8); 7.8910 (6.0); 7.8869 (8.3); 7.8829 (4.8); 7.4614 (5.2); 7.4493 (5.0); 7.4413 (5.0); 7.4293 (5.1); 5.8777 (0.6); 5.8607 (2.7); 5.8431 (4.2); 5.8254 (2.8); 5.8078 (0.6); 3.3316 (84.3); 2.6771 (0.6); 2.6725 (0.8); 2.6680 (0.6); 2.5260 (1.8); 2.5212 (3.0); 2.5125 (44.3); 2.5081 (93.3); 2.5036 (125.3); 2.4990 (88.6); 2.4945 (40.9); 2.4736 (0.5); 2.4688 (0.3); 2.3349 (0.6); 2.3304 (0.8); 2.3259 (0.6); 2.0769 (0.9); 1.8620 (0.4); 1.8466 (2.0); 1.8342 (6.7); 1.8272 (8.3); 1.8236 (6.3); 1.8158 (2.6); 1.8002 (0.7); 1.7886 (0.4); 1.7043 (15.5); 1.6871 (16.0); 1.6624 (6.5); 1.6588 (4.4); 1.6526 (4.2); 1.6499 (4.2); 1.6389 (5.4); 1.6259 (0.8); 1.6176 (0.8); 1.2441 (1.3); 0.0080 (1.2); -0.0002 (37.4); -0.0085 (1.1)	459.2	10
I-7		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ = 8.9623 (2.3); 8.9574 (2.4); 8.5790 (2.2); 8.5577 (2.6); 8.4432 (1.6); 8.4399 (1.8); 8.4312 (1.8); 8.4279 (1.9); 8.2885 (1.9); 8.2828 (1.9); 8.2672 (1.6); 8.2615 (1.7); 8.2005 (1.7); 8.1963 (3.1); 8.1920 (2.0); 8.1259 (1.6); 8.1226 (1.8); 8.1060 (1.8); 8.1025 (1.8); 8.0757 (2.2); 8.0723 (3.6); 8.0688 (2.0); 7.9174 (2.8); 7.7894 (1.0); 7.7707 (1.0); 7.4083 (1.8); 7.3962 (1.7); 7.3883 (1.7); 7.3762 (1.6); 7.2654 (18.6); 6.2133 (1.0); 6.1951 (1.5); 6.1778 (1.0); 2.0111 (3.4); 1.7828 (15.6); 1.7754 (16.0); 1.7649 (8.0); 1.7480 (7.4); 1.6837 (9.8); 0.0080 (0.8); -0.0002 (27.2)	461.3	20
I-8		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.4137 (4.0); 9.3953 (4.1); 8.6180 (7.2); 8.6116 (7.3); 8.3615 (4.7); 8.3580 (5.4); 8.3496 (5.0); 8.3461 (5.2); 8.3174 (1.3); 8.3006 (6.4); 8.2804 (15.1); 8.2178 (4.9); 8.2143 (5.1); 8.1978 (5.4); 8.1943 (5.2); 8.1464 (4.7); 8.1398 (4.5); 8.1250 (5.4); 8.1183 (5.3); 7.8430 (8.1); 7.8216 (7.1); 7.4260 (5.0); 7.4140 (4.9); 7.4059 (4.7); 7.3940 (4.7); 5.8044 (0.6); 5.7874 (2.7); 5.7699 (4.2); 5.7522 (2.8); 5.7348 (0.6); 3.9018 (2.3); 3.4680 (0.4); 3.4354 (0.4); 3.4140 (0.5); 3.4016 (0.8); 3.3938 (0.7); 3.3867 (0.9); 3.3564 (2.2); 3.3310 (1284.4); 3.3095 (3.9); 3.2887 (0.4); 3.2822 (0.8); 2.6755 (4.2); 2.6712 (5.6); 2.6668 (4.2); 2.6459 (0.4); 2.6070 (0.4); 2.5705 (0.9); 2.5661 (0.9); 2.5605 (1.0); 2.5246 (12.7); 2.5198 (19.4); 2.5109 (297.7); 2.5067 (628.4); 2.5023 (850.2); 2.4978 (615.3); 2.4597 (0.7); 2.3335 (3.7); 2.3291 (5.3); 2.3246 (3.8); 1.7093 (16.0); 1.6920 (16.0); 1.2342 (0.3); 0.1459 (1.5); 0.0079 (10.4); -0.0002 (333.6); -0.0084 (11.2); -0.0223 (0.7); -0.1498 (1.4)	514.3	30

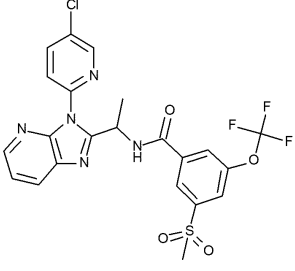
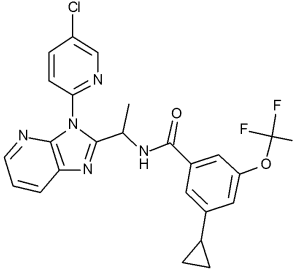
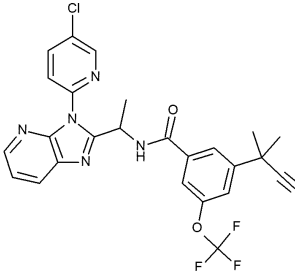
40

50

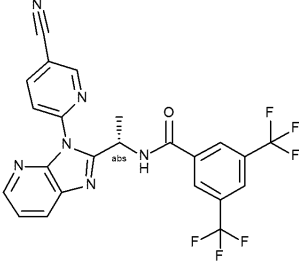
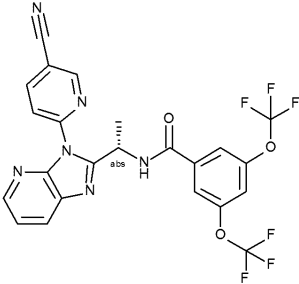
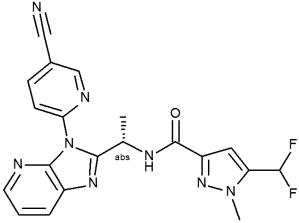
I-9		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.2496 (4.1); 9.2311 (4.2); 8.6140 (6.9); 8.6080 (7.1); 8.3609 (4.7); 8.3574 (5.4); 8.3489 (5.1); 8.3454 (5.3); 8.3184 (0.4); 8.2146 (4.8); 8.2111 (5.0); 8.1947 (5.4); 8.1911 (5.1); 8.1497 (4.7); 8.1431 (4.5); 8.1283 (5.3); 8.1216 (5.3); 7.8615 (1.5); 7.8447 (8.2); 7.8231 (7.1); 7.7253 (5.0); 7.7047 (13.3); 7.4248 (5.0); 7.4128 (4.8); 7.4048 (4.8); 7.3928 (4.8); 5.7744 (0.6); 5.7572 (2.8); 5.7395 (4.2); 5.7217 (2.8); 5.7046 (0.6); 3.3297 (133.5); 2.6764 (1.2); 2.6720 (1.6); 2.6675 (1.2); 2.5254 (4.0); 2.5206 (5.9); 2.5118 (86.6); 2.5075 (183.5); 2.5030 (247.6); 2.4985 (178.0); 2.4942 (84.1); 2.3387 (0.6); 2.3343 (1.2); 2.3298 (1.6); 2.3253 (1.2); 1.6885 (16.0); 1.6713 (15.9); 0.0080 (1.2); -0.0002 (37.7); -0.0084 (1.2)	546.1	10
I-10		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.3289 (4.4); 9.3104 (4.4); 8.6669 (0.3); 8.6556 (7.3); 8.6492 (7.4); 8.3615 (4.8); 8.3580 (5.6); 8.3496 (5.2); 8.3461 (5.6); 8.2216 (0.3); 8.2119 (5.1); 8.2085 (5.4); 8.1924 (9.8); 8.1880 (7.0); 8.1868 (7.0); 8.1714 (5.8); 8.1647 (6.4); 8.1616 (5.7); 8.1577 (10.1); 8.1541 (6.8); 8.1264 (5.4); 8.1219 (9.0); 8.1177 (5.2); 8.0256 (5.6); 8.0213 (8.7); 8.0172 (5.5); 7.8679 (8.3); 7.8464 (7.3); 7.4232 (5.3); 7.4112 (5.1); 7.4032 (4.9); 7.3912 (4.9); 5.7750 (0.6); 5.7577 (2.8); 5.7399 (4.3); 5.7222 (2.8); 5.7049 (0.6); 3.3305 (107.4); 3.3056 (46.1); 2.6767 (0.6); 2.6720 (0.8); 2.6676 (0.6); 2.5254 (2.1); 2.5119 (43.8); 2.5076 (92.1); 2.5031 (124.3); 2.4987 (91.1); 2.4945 (44.5); 2.3346 (0.6); 2.3300 (0.8); 2.3256 (0.6); 2.0764 (1.9); 1.6855 (16.0); 1.6683 (15.9); 1.6264 (0.6); 1.6092 (0.6); 1.2295 (0.4); 0.0078 (0.7); -0.0002 (18.8); -0.0084 (0.6)	490.1	20
I-11		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.1514 (4.3); 9.1326 (4.4); 8.6197 (7.4); 8.6132 (7.7); 8.3586 (4.7); 8.3551 (5.4); 8.3467 (5.2); 8.3432 (5.4); 8.3182 (0.4); 8.2132 (5.0); 8.2097 (5.2); 8.1932 (5.6); 8.1897 (5.4); 8.1559 (4.9); 8.1493 (4.7); 8.1345 (5.6); 8.1279 (5.5); 7.8403 (8.5); 7.8189 (7.5); 7.6211 (4.8); 7.6177 (8.7); 7.6142 (5.9); 7.5328 (5.9); 7.4417 (6.2); 7.4233 (5.2); 7.4113 (5.0); 7.4033 (4.9); 7.3913 (4.9); 5.7708 (0.6); 5.7535 (2.7); 5.7357 (4.2); 5.7179 (2.8); 5.7005 (0.6); 3.3298 (152.4); 2.6763 (1.0); 2.6718 (1.4); 2.6674 (1.0); 2.5252 (3.5); 2.5204 (5.0); 2.5116 (74.1); 2.5073 (158.1); 2.5028 (214.5); 2.4984 (155.0); 2.4941 (74.2); 2.3340 (1.0); 2.3297 (1.4); 2.3251 (1.0); 2.0761 (2.3); 1.8605 (0.4); 1.8441 (3.6); 1.8335 (6.9); 1.8270 (8.7); 1.8227 (4.7); 1.8175 (4.4); 1.8012 (0.4); 1.7874 (0.4); 1.6889 (16.0); 1.6717 (16.0); 1.6419 (0.5); 1.6359 (0.9); 1.6304 (0.6); 1.6182 (6.3); 1.6118 (4.4); 1.6067 (7.0); 1.5974 (4.3); 1.5929 (4.2); 1.5833 (0.6); 1.5755 (0.7); 1.2484 (0.4); 0.0078 (0.5); -0.0002 (17.1); -0.0083 (0.6)	527.4	30

40

50

I-12		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.4034 (4.3); 9.3848 (4.4); 8.6428 (7.3); 8.6368 (7.4); 8.3641 (4.9); 8.3606 (5.6); 8.3522 (5.4); 8.3486 (5.6); 8.3176 (0.5); 8.2876 (5.3); 8.2842 (9.8); 8.2808 (6.0); 8.2148 (5.1); 8.2113 (5.3); 8.1948 (5.6); 8.1913 (5.5); 8.1760 (5.0); 8.1694 (4.8); 8.1546 (5.7); 8.1480 (5.6); 8.0565 (5.9); 7.9464 (6.0); 7.8676 (8.3); 7.8460 (7.2); 7.4261 (5.2); 7.4141 (5.0); 7.4061 (5.0); 7.3941 (5.0); 5.7901 (0.6); 5.7730 (2.8); 5.7553 (4.2); 5.7375 (2.8); 5.7203 (0.6); 3.3737 (0.4); 3.3346 (58.0); 3.3299 (270.6); 2.6761 (1.3); 2.6716 (1.8); 2.6671 (1.3); 2.5524 (0.3); 2.5250 (4.4); 2.5203 (6.4); 2.5114 (97.1); 2.5071 (208.3); 2.5026 (282.9); 2.4981 (204.0); 2.4938 (97.0); 2.3340 (1.3); 2.3295 (1.8); 2.3249 (1.3); 2.0757 (2.8); 1.6977 (16.0); 1.6805 (16.0); 0.0079 (1.3); -0.0002 (45.8); -0.0085 (1.5)	540.1	10
I-13		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 8.9973 (4.3); 8.9786 (4.4); 8.6172 (6.9); 8.6110 (7.0); 8.3513 (4.6); 8.3478 (5.3); 8.3393 (5.0); 8.3359 (5.3); 8.3181 (0.5); 8.2033 (4.8); 8.1998 (5.0); 8.1833 (5.3); 8.1799 (5.2); 8.1546 (4.6); 8.1480 (4.5); 8.1332 (5.2); 8.1266 (5.2); 7.8289 (7.9); 7.8075 (7.0); 7.4171 (4.9); 7.4051 (4.7); 7.3971 (4.7); 7.3851 (4.6); 7.3243 (5.8); 7.3032 (8.4); 7.2518 (5.9); 5.7503 (0.6); 5.7329 (2.7); 5.7151 (4.1); 5.6973 (2.7); 5.6801 (0.6); 3.3290 (149.6); 2.6760 (1.2); 2.6716 (1.6); 2.6672 (1.2); 2.5249 (4.0); 2.5201 (6.0); 2.5111 (87.0); 2.5070 (183.4); 2.5026 (247.4); 2.4982 (179.9); 2.3338 (1.2); 2.3294 (1.6); 2.3250 (1.2); 2.0377 (0.7); 2.0250 (1.6); 2.0165 (1.8); 2.0042 (3.3); 1.9917 (2.0); 1.9833 (1.7); 1.9706 (0.9); 1.6746 (16.0); 1.6574 (15.9); 1.0356 (1.9); 1.0245 (5.4); 1.0191 (6.0); 1.0086 (3.0); 1.0037 (5.5); 0.9982 (5.8); 0.9879 (2.2); 0.7660 (2.3); 0.7553 (6.6); 0.7505 (6.7); 0.7432 (6.1); 0.7381 (7.0); 0.7267 (1.9); 0.0079 (1.1); -0.0002 (36.0); -0.0084 (1.2)	502.2	20
I-14		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.1704 (1.0); 9.1517 (1.0); 8.6165 (1.7); 8.6101 (1.7); 8.3590 (1.1); 8.3555 (1.2); 8.3470 (1.2); 8.3435 (1.2); 8.2145 (1.1); 8.2110 (1.1); 8.1945 (1.2); 8.1910 (1.2); 8.1456 (1.1); 8.1390 (1.0); 8.1242 (1.2); 8.1177 (1.2); 7.8391 (2.0); 7.8273 (2.0); 7.8237 (1.3); 7.8178 (1.8); 7.6380 (1.4); 7.5950 (1.3); 7.4242 (1.1); 7.4122 (1.1); 7.4041 (1.1); 7.3922 (1.1); 5.7645 (0.6); 5.7468 (0.9); 5.7288 (0.6); 3.3291 (158.8); 2.6757 (0.7); 2.6711 (1.0); 2.6667 (0.8); 2.5245 (2.6); 2.5197 (3.7); 2.5109 (54.5); 2.5066 (115.7); 2.5021 (156.6); 2.4977 (112.3); 2.4933 (53.0); 2.3334 (0.7); 2.3289 (1.0); 2.3245 (0.8); 1.7374 (0.7); 1.7089 (16.0); 1.6972 (3.9); 1.6800 (3.6); 0.1458 (0.7); 0.0079 (4.9); -0.0002 (158.6); -0.0084 (5.3); -0.1496 (0.7)	529.2	30

40

I-15		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.4531 (4.1); 9.4349 (4.2); 9.0790 (6.9); 9.0734 (6.9); 8.5677 (4.6); 8.5620 (4.6); 8.5466 (5.0); 8.5409 (5.1); 8.4008 (4.6); 8.3974 (5.4); 8.3889 (4.9); 8.3854 (5.4); 8.3188 (0.4); 8.3029 (6.7); 8.2879 (15.7); 8.2428 (4.7); 8.2395 (5.1); 8.2229 (5.2); 8.2194 (5.2); 8.1458 (7.5); 8.1247 (6.8); 7.4641 (4.8); 7.4521 (4.6); 7.4441 (4.6); 7.4321 (4.6); 5.9083 (0.6); 5.8913 (2.8); 5.8736 (4.3); 5.8561 (2.8); 5.8386 (0.6); 3.3362 (150.2); 2.6778 (0.6); 2.6734 (0.9); 2.6689 (0.7); 2.5266 (2.3); 2.5128 (46.4); 2.5087 (97.5); 2.5043 (132.1); 2.4999 (96.9); 2.3355 (0.6); 2.3311 (0.8); 2.3269 (0.6); 2.0775 (0.5); 1.7308 (16.0); 1.7136 (15.9); -0.0002 (1.0)	505.2
I-16		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.2805 (4.2); 9.2622 (4.3); 9.0630 (6.9); 9.0575 (6.8); 8.5638 (5.0); 8.5581 (4.8); 8.5426 (5.4); 8.5370 (5.5); 8.3988 (4.7); 8.3953 (5.5); 8.3868 (5.2); 8.3833 (5.5); 8.3185 (0.4); 8.2411 (5.0); 8.2376 (5.3); 8.2211 (5.5); 8.2175 (5.4); 8.1399 (7.4); 8.1188 (6.8); 7.7307 (5.2); 7.7026 (13.1); 7.4628 (5.1); 7.4508 (4.9); 7.4428 (4.9); 7.4308 (4.9); 5.8801 (0.6); 5.8630 (2.8); 5.8454 (4.3); 5.8278 (2.8); 5.8104 (0.6); 3.3330 (246.1); 2.6772 (0.9); 2.6727 (1.2); 2.6683 (0.9); 2.5260 (2.9); 2.5213 (4.3); 2.5124 (63.4); 2.5081 (135.4); 2.5037 (184.2); 2.4992 (133.5); 2.4950 (63.9); 2.3349 (0.8); 2.3304 (1.1); 2.3260 (0.8); 1.7084 (16.0); 1.6912 (15.9); -0.0002 (1.2)	537.2
I-17		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.1038 (2.8); 9.0997 (2.8); 8.7771 (0.3); 8.7738 (0.3); 8.7627 (0.3); 8.6297 (1.7); 8.6104 (1.8); 8.5986 (2.2); 8.5930 (2.1); 8.5775 (2.3); 8.5718 (2.2); 8.5323 (0.3); 8.5288 (0.3); 8.3861 (2.1); 8.3826 (2.3); 8.3741 (2.3); 8.3706 (2.2); 8.2227 (2.1); 8.2192 (2.1); 8.2028 (2.4); 8.1992 (2.1); 8.1675 (3.0); 8.1662 (3.0); 8.1463 (2.7); 8.1450 (2.7); 7.5378 (0.4); 7.5269 (0.3); 7.5168 (0.4); 7.5058 (0.3); 7.4516 (2.3); 7.4396 (2.1); 7.4317 (3.2); 7.4196 (2.0); 7.3180 (0.6); 7.2983 (2.9); 7.1650 (1.4); 6.9982 (0.6); 6.8572 (3.9); 5.8263 (1.2); 5.8083 (1.7); 5.7902 (1.2); 3.9791 (2.9); 3.9437 (16.0); 3.3342 (47.6); 2.6767 (0.4); 2.6721 (0.5); 2.6675 (0.4); 2.5252 (1.8); 2.5118 (31.1); 2.5076 (61.4); 2.5031 (79.7); 2.4986 (56.6); 2.4943 (26.8); 2.3345 (0.4); 2.3299 (0.5); 2.3254 (0.4); 1.6178 (7.0); 1.6007 (7.0); 0.0079 (1.1); -0.0002 (26.2); -0.0084 (1.0)	423.2

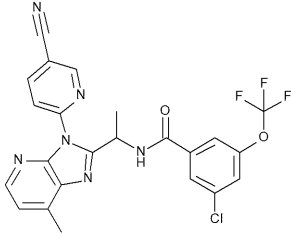
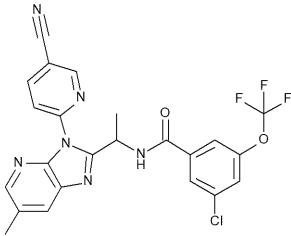
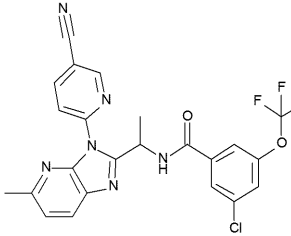
10

20

30

40

50

I-18		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.2311 (2.2); 9.2128 (2.2); 9.0676 (3.4); 9.0632 (3.6); 8.5647 (2.1); 8.5594 (2.1); 8.5436 (2.2); 8.5383 (2.3); 8.2444 (3.4); 8.2321 (3.6); 8.1369 (0.5); 8.1064 (3.4); 8.0853 (3.1); 7.7805 (4.3); 7.7558 (3.4); 7.5753 (3.5); 7.2803 (3.0); 7.2680 (2.9); 5.8449 (0.3); 5.8281 (1.3); 5.8108 (2.1); 5.7931 (1.4); 5.7758 (0.4); 3.6338 (0.6); 3.6236 (0.6); 3.6174 (0.8); 3.6073 (0.8); 3.6012 (0.7); 3.5910 (0.6); 3.5749 (0.3); 3.4016 (45.1); 3.1672 (0.3); 3.1491 (0.9); 3.1382 (1.0); 3.1308 (1.0); 3.1200 (0.9); 3.1021 (0.3); 2.6730 (0.7); 2.6344 (16.0); 2.5041 (95.3); 2.3310 (0.6); 2.2069 (0.6); 1.7122 (7.7); 1.6950 (7.7); 1.4995 (0.3); 1.2882 (6.2); 1.2713 (8.0); 1.2670 (8.4); 1.2584 (4.9); 1.2502 (6.8); 1.2401 (2.2); -0.0002 (8.4)	501.2
I-19		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.7377 (0.4); 9.2776 (0.5); 9.2251 (2.2); 9.2068 (2.2); 9.0639 (3.6); 9.0584 (3.5); 8.5720 (2.4); 8.5663 (2.3); 8.5509 (2.6); 8.5452 (2.6); 8.5020 (0.4); 8.4963 (0.4); 8.2403 (3.6); 8.2369 (3.8); 8.1496 (3.8); 8.1284 (3.5); 8.0489 (0.8); 8.0420 (0.7); 8.0337 (3.7); 8.0310 (3.8); 7.9710 (0.3); 7.8398 (0.4); 7.8050 (0.8); 7.7945 (2.5); 7.7904 (4.6); 7.7868 (3.4); 7.7575 (3.0); 7.7034 (0.4); 7.6814 (0.3); 7.5846 (3.2); 5.8698 (0.3); 5.8527 (1.4); 5.8352 (2.2); 5.8175 (1.5); 3.3709 (0.4); 3.3362 (117.2); 2.6776 (0.4); 2.6730 (0.5); 2.6689 (0.4); 2.5263 (1.7); 2.5126 (28.5); 2.5086 (57.8); 2.5041 (77.1); 2.4997 (56.5); 2.4526 (16.0); 2.3354 (0.4); 2.3310 (0.5); 2.3266 (0.4); 2.2852 (2.0); 2.1135 (0.8); 2.0769 (0.4); 2.0563 (0.7); 1.6841 (8.2); 1.6669 (8.2); 1.4413 (0.9); 1.4232 (0.9); -0.0002 (1.1)	501.2
I-20		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.1828 (4.3); 9.1642 (4.4); 9.0572 (6.7); 9.0521 (6.8); 8.5721 (4.7); 8.5665 (4.6); 8.5510 (5.1); 8.5453 (5.1); 8.3178 (0.5); 8.1205 (7.4); 8.0966 (10.2); 8.0758 (8.7); 8.0484 (0.4); 7.7766 (8.8); 7.7731 (6.9); 7.7551 (6.0); 7.5708 (6.3); 7.3062 (7.9); 7.2857 (7.5); 5.8332 (0.7); 5.8160 (2.7); 5.7983 (4.2); 5.7807 (2.8); 5.7583 (3.6); 3.3823 (0.4); 3.3317 (244.0); 2.8915 (1.0); 2.7319 (0.8); 2.6763 (1.1); 2.6721 (1.5); 2.6678 (1.2); 2.5480 (37.9); 2.5255 (4.2); 2.5075 (172.2); 2.5032 (231.4); 2.4989 (172.0); 2.4683 (1.3); 2.3343 (1.1); 2.3300 (1.5); 2.3257 (1.2); 1.6937 (0.5); 1.6703 (16.0); 1.6532 (15.9); 1.2328 (0.6); -0.0002 (1.2)	501.2

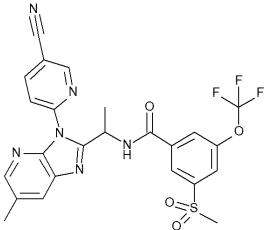
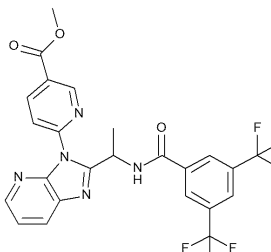
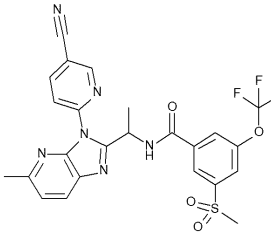
10

20

30

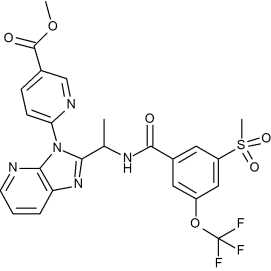
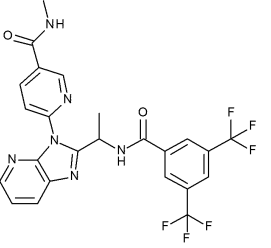
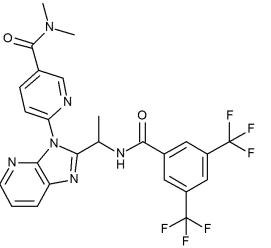
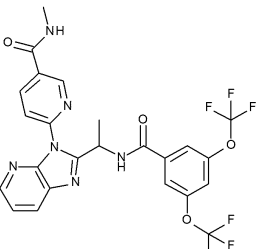
40

50

I-21		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.4423 (2.2); 9.4238 (2.2); 9.0762 (3.4); 9.0712 (3.8); 8.5748 (2.3); 8.5692 (2.4); 8.5537 (2.4); 8.5482 (2.6); 8.3174 (0.7); 8.2814 (5.0); 8.2427 (4.2); 8.1680 (3.9); 8.1468 (3.5); 8.0552 (3.5); 8.0343 (4.1); 7.9541 (3.6); 7.9248 (0.3); 5.9065 (0.4); 5.8887 (1.4); 5.8714 (2.2); 5.8542 (1.5); 5.8367 (0.4); 3.4125 (0.6); 3.3981 (0.7); 3.3828 (1.6); 3.3295 (357.4); 3.2989 (0.8); 3.2677 (0.4); 3.2536 (0.3); 2.6755 (2.0); 2.6712 (2.8); 2.6671 (2.3); 2.5808 (0.5); 2.5064 (318.7); 2.5023 (432.9); 2.4980 (345.4); 2.4533 (16.0); 2.3810 (0.5); 2.3328 (2.0); 2.3291 (2.8); 2.3249 (2.3); 1.7059 (8.0); 1.6887 (8.0); 1.2577 (0.4); 1.2345 (0.8); 1.1358 (0.4); 1.1221 (0.4); -0.0002 (1.3)	545.3	10
I-22		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, CD <sub>3</sub> CN) $\delta$ = 9.1139 (3.0); 8.4753 (1.5); 8.4711 (1.7); 8.4543 (1.7); 8.4500 (1.9); 8.3705 (2.1); 8.3587 (2.3); 8.1302 (7.3); 8.1090 (4.7); 8.0883 (2.3); 8.0544 (2.7); 8.0334 (2.4); 7.8368 (1.1); 7.8187 (1.1); 7.3890 (1.5); 7.3773 (1.6); 7.3694 (1.7); 7.3572 (1.5); 5.9895 (1.2); 5.9719 (1.8); 5.9541 (1.2); 3.9174 (16.0); 2.1674 (63.9); 2.1144 (0.6); 2.1085 (0.6); 1.9714 (1.4); 1.9643 (1.3); 1.9519 (18.6); 1.9460 (36.7); 1.9409 (52.1); 1.9350 (41.0); 1.9300 (24.0); 1.7694 (0.4); 1.7644 (0.3); 1.7390 (7.7); 1.7219 (7.8); 1.2682 (1.2); 1.2469 (0.6); 1.2220 (0.5); 1.2040 (0.7); 1.1849 (0.4); 0.8569 (0.3); -0.0002 (49.3); -0.0013 (48.9)	538.2	20
I-23		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) $\delta$ = 9.3962 (4.3); 9.3778 (4.4); 9.0677 (6.9); 9.0623 (7.2); 8.5715 (4.6); 8.5659 (4.6); 8.5504 (5.1); 8.5448 (5.2); 8.3171 (2.0); 8.2656 (9.8); 8.1376 (7.4); 8.1163 (6.9); 8.1000 (8.2); 8.0797 (8.8); 8.0520 (6.5); 7.9398 (6.5); 7.3108 (8.0); 7.2903 (7.7); 5.8674 (0.7); 5.8502 (2.8); 5.8328 (4.4); 5.8151 (2.8); 5.7978 (0.6); 5.7577 (0.3); 3.5066 (0.7); 3.4812 (0.4); 3.4313 (0.6); 3.4097 (1.0); 3.3889 (1.0); 3.3746 (1.6); 3.3301 (1361.4); 3.2962 (1.7); 3.2770 (1.1); 3.2685 (0.6); 3.2406 (0.5); 3.2023 (0.4); 3.1600 (0.4); 3.1406 (0.3); 3.1202 (0.4); 2.7289 (0.4); 2.6754 (5.8); 2.6710 (8.0); 2.6666 (6.2); 2.6031 (0.9); 2.5796 (1.6); 2.5504 (39.1); 2.5243 (20.5); 2.5064 (912.1); 2.5021 (1234.2); 2.4977 (927.7); 2.4543 (1.5); 2.3655 (0.5); 2.3332 (5.8); 2.3289 (7.8); 2.3245 (5.9); 2.2948 (0.4); 1.6927 (15.9); 1.6756 (16.0); 1.2581 (0.4); 1.2328 (1.4); 1.2032 (0.4); 1.1925 (0.4); 1.1644 (0.4); -0.0002 (4.0)	545.2	30

40



I-24		<p>I-24: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, CD<sub>3</sub>CN):  <math>\delta</math>= 9.1359 (1.8); 9.1316 (1.9); 9.1303 (1.9);        8.5021 (1.4); 8.4963 (1.4); 8.4810 (1.5); 8.4753 (1.5); 8.3731 (1.4); 8.3697 (1.6); 8.3612 (1.5);        8.3577 (1.6); 8.1105 (1.4); 8.1070 (1.5); 8.0902 (1.8); 8.0869 (3.0); 8.0837 (3.1); 8.0802 (2.0);        8.0640 (2.2); 8.0430 (2.0); 7.9215 (0.7); 7.9060 (2.2); 7.8256 (1.8); 7.3905 (1.5); 7.3784 (1.4);        7.3704 (1.4); 7.3584 (1.4); 5.9775 (0.9); 5.9593 (1.4); 5.9415 (1.0); 3.9266 (16.0); 3.6648 (0.4);        3.6483 (0.9); 3.6316 (1.3); 3.6151 (1.0); 3.5986 (0.4); 3.1324 (0.6); 3.1138 (1.7); 3.1032 (15.6);        3.0955 (2.3); 3.0768 (0.6); 2.7281 (5.3); 2.5076 (0.6); 2.2227 (38.6); 2.1219 (0.4); 2.1159 (0.4);        2.1098 (0.4); 2.1035 (0.4); 1.9667 (1.0); 1.9605 (0.7); 1.9548 (9.8); 1.9486 (19.2); 1.9425 (27.7); 1.9363 (19.2); 1.9301 (9.9); 1.7278 (6.6); 1.7105 (6.5); 1.3535 (2.0); 1.3357 (12.5);        1.3196 (10.1); 1.2680 (0.7); 1.1000 (3.2); 1.0848 (3.2); -0.0002 (11.2); -0.0083 (0.5)</p>	564.3
I-25		<p>I-25: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.4344 (3.8); 9.4158 (3.9); 8.9704 (6.0);        8.9647 (6.4); 8.7104 (2.8); 8.6987 (2.8); 8.6880 (1.0); 8.3781 (5.8); 8.3744 (8.0); 8.3658 (4.7);        8.3621 (5.5); 8.3534 (4.1); 8.3187 (0.8); 8.2770 (16.0); 8.2229 (4.1); 8.2196 (4.2); 8.2029 (4.5);        8.1996 (4.3); 7.9364 (6.4); 7.9155 (5.9); 7.4346 (4.0); 7.4226 (3.9); 7.4145 (3.9); 7.4026 (3.9);        5.8779 (0.5); 5.8604 (2.4); 5.8428 (3.7); 5.8252 (2.4); 5.8074 (0.5); 3.9436 (0.5); 3.3780 (0.6);        3.3322 (257.4); 3.2785 (0.3); 2.8117 (15.9); 2.8005 (15.9); 2.6762 (2.6); 2.6717 (3.6);        2.6674 (2.7); 2.6027 (0.4); 2.5908 (0.3); 2.5250 (11.3); 2.5072 (431.8); 2.5028 (571.6); 2.4985 (415.9); 2.3339</p>	537.2
I-26		<p>I-26: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.4311 (3.7); 9.4122 (3.8); 8.5915 (6.2);        8.5861 (6.3); 8.3795 (4.1); 8.3768 (4.4); 8.3677 (4.3); 8.3650 (4.2); 8.3033 (14.0); 8.2830 (6.1);        8.2378 (4.1); 8.2351 (4.1); 8.2179 (4.3); 8.2150 (4.1); 8.0759 (3.3); 8.0704 (3.3); 8.0553 (4.0);        8.0498 (4.0); 7.8927 (6.3); 7.8722 (5.1); 7.4393 (3.5); 7.4273 (3.5); 7.4193 (3.5); 7.4073 (3.3);        5.9134 (0.6); 5.8967 (2.2); 5.8790 (3.4); 5.8610 (2.2); 5.8441 (0.5); 3.3608 (18.5); 2.9850 (15.2); 2.9404 (0.3); 2.7467 (16.0); 2.6749 (0.6); 2.5728 (0.4); 2.5100 (70.6); 2.5061 (87.9); 2.5023 (66.9); 2.3327 (0.5); 2.0799 (0.5); 1.7179 (12.8); 1.7008 (12.6); 1.2447 (0.4); 1.2336 (0.7); -0.0002 (0.4)</p>	551.2
I-27		<p>I-27: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2769 (2.4); 9.2585 (2.4); 8.9792 (3.8);        8.9741 (3.9); 8.7271 (1.8); 8.7157 (1.8); 8.7053 (0.6); 8.3980 (2.4); 8.3920 (2.4); 8.3761 (4.3);        8.3716 (5.3); 8.3635 (2.9); 8.3600 (3.0); 8.3185 (0.4); 8.2168 (2.6); 8.2134 (2.8); 8.1968 (3.0);        8.1934 (2.9); 7.9403 (3.9); 7.9194 (3.6); 7.6958 (16.0); 7.4321 (2.6); 7.4201 (2.5); 7.4121 (2.5);        7.4001 (2.5); 5.8393 (0.3); 5.8220 (1.5); 5.8044 (2.3); 5.7868 (1.5); 5.7697 (0.3); 3.3311 (121.0); 2.8226 (10.2); 2.8114 (10.2); 2.6763 (1.2); 2.6718 (1.7); 2.6674 (1.2); 2.5252 (4.6);        2.5204 (7.0); 2.5114 (90.0); 2.5073 (189.1); 2.5028 (254.2); 2.4984 (186.3); 2.3342 (1.1); 2.3296 (1.6); 2.3253 (1.2); 1.6939 (8.5); 1.6767 (8.5); -0.0002 (1.9)</p>	569.2

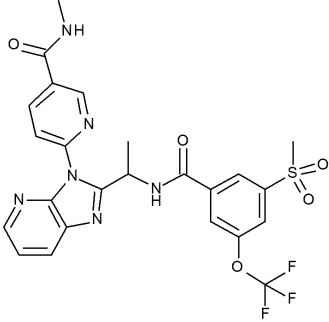
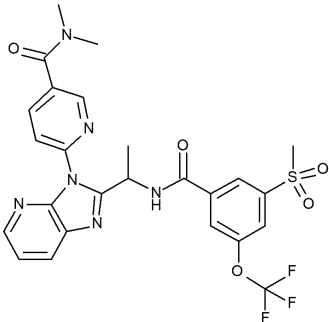
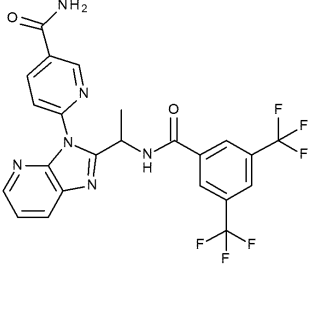
10

20

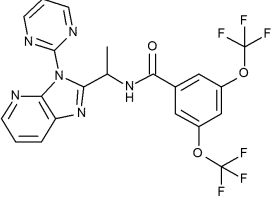
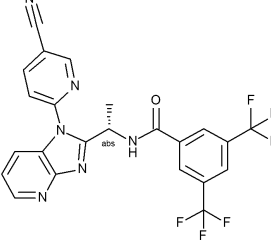
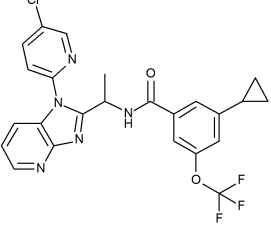
30

40

50

I-28		<p>I-28: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.4177 (3.9); 9.3992 (4.1); 8.9819 (6.2);  8.9763 (6.6); 8.7442 (1.1); 8.7340 (3.0); 8.7226  (3.0); 8.7124 (1.1); 8.4015 (3.7); 8.3957 (3.6);  8.3801 (7.5); 8.3757 (7.8); 8.3675 (4.8); 8.3641  (4.6); 8.3184 (0.8); 8.2596 (8.3); 8.2208 (4.4);  8.2175 (4.3); 8.2008 (4.8); 8.1975 (4.4); 8.0322  (5.6); 7.9559 (6.6); 7.9352 (10.9); 7.4348 (4.0);  7.4228 (3.9); 7.4148 (3.8); 7.4028 (3.9); 5.8639  (0.6); 5.8469 (2.4); 5.8291 (3.7); 5.8115 (2.4);  5.7951 (0.6); 3.3792 (0.4); 3.3671 (0.4); 3.3308  (246.2); 2.8228 (16.0); 2.8116 (15.8); 2.6893  (4.0); 2.6758 (2.4); 2.6714 (3.2); 2.6673 (2.4);  2.6156 (0.4); 2.6056 (0.4); 2.5759 (0.5); 2.5247  (9.8); 2.5069 (376.5); 2.5026 (487.2); 2.4983  (350.7); 2.4417 (0.3); 2.3337 (2.3); 2.3294  (3.0); 2.3250 (2.2); 1.7053 (13.3); 1.6881  (13.2); 1.2338 (0.6); -0.0002 (3.7)</p>	563.2	10
I-29		<p>I-29: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.3834 (3.5); 9.3643 (3.6); 8.5939 (5.8);  8.5893 (5.9); 8.3775 (4.0); 8.3740 (4.5); 8.3656  (4.4); 8.3621 (4.5); 8.3186 (0.4); 8.2491 (4.5);  8.2457 (8.1); 8.2424 (5.1); 8.2356 (4.4); 8.2320  (4.4); 8.2155 (4.6); 8.2120 (4.4); 8.1351 (0.4);  8.0737 (3.7); 8.0679 (3.6); 8.0531 (4.6); 8.0474  (4.7); 8.0354 (5.0); 7.9468 (5.0); 7.8863 (6.2);  7.8657 (5.1); 7.4371 (4.1); 7.4251 (4.0); 7.4171  (3.9); 7.4051 (4.0); 6.5916 (0.7); 5.8949 (0.5);  5.8781 (2.2); 5.8601 (3.2); 5.8421 (2.2); 5.8254  (0.5); 3.3735 (0.9); 3.3317 (91.8); 3.0152 (0.5);  2.9846 (15.1); 2.9081 (0.4); 2.7562 (16.0);  2.6765 (1.0); 2.6721 (1.4); 2.6676 (1.0); 2.5254  (4.4); 2.5205 (6.8); 2.5118 (81.6); 2.5075  (168.3); 2.5031 (222.9); 2.4986 (159.9); 2.4944  (76.5); 2.3343 (0.9); 2.3299 (1.3); 2.3254 (0.9);  2.0764 (2.1); 1.7064 (12.6); 1.6893 (12.5);  1.2348 (0.4); -0.0002 (1.6)</p>	577.3	20
I-30		<p>I-30: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.4603 (4.2); 9.4419 (4.4); 9.0219 (6.8);  9.0164 (7.2); 8.4388 (4.0); 8.4330 (4.0); 8.4179  (4.4); 8.4121 (4.4); 8.3795 (4.4); 8.3764 (5.2);  8.3677 (4.8); 8.3644 (5.2); 8.3191 (0.5); 8.2900  (16.0); 8.2708 (6.8); 8.2196 (8.6); 8.2166 (7.5);  8.1994 (5.2); 8.1961 (5.2); 7.9561 (7.1); 7.9352  (6.6); 7.6848 (4.4); 7.4348 (4.3); 7.4228 (4.2);  7.4148 (4.2); 7.4028 (4.2); 5.8784 (0.6); 5.8610  (2.7); 5.8434 (4.2); 5.8257 (2.7); 5.8088 (0.6);  3.3318 (97.8); 2.6771 (1.0); 2.6726 (1.3);  2.6682 (1.0); 2.5257 (3.3); 2.5079 (155.6);  2.5036 (210.7); 2.4994 (159.5); 2.3347 (1.0);  2.3305 (1.3); 2.3262 (1.0); 2.0767 (1.2); 1.7184  (14.9); 1.7012 (15.0); 1.2334 (0.4); 0.8765  (0.6); 0.8597 (0.6); 0.1460 (1.0); 0.0178 (0.4);  0.0078 (7.0); -0.0002 (216.6); -0.1496 (1.0)</p>	523.2	30

40

I-31		<p>I-31: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.3193 (3.2); 9.3001 (3.3); 8.9765 (15.6);        8.9642 (16.0); 8.3527 (3.7); 8.3492 (4.2);        8.3408 (4.0); 8.3372 (4.2); 8.2121 (4.0); 8.2085        (4.1); 8.1921 (4.5); 8.1885 (4.2); 7.7272 (4.0);        7.6651 (9.6); 7.6028 (4.1); 7.5905 (7.9); 7.5783        (4.0); 7.4190 (4.1); 7.4070 (3.9); 7.3989 (3.9);        7.3870 (3.9); 5.8105 (0.5); 5.7933 (2.1); 5.7752        (3.0); 5.7571 (2.2); 5.7400 (0.5); 3.3381        (115.2); 2.6778 (0.4); 2.6734 (0.7); 2.6691        (0.5); 2.5267 (1.6); 2.5219 (2.4); 2.5131 (36.3);        2.5089 (76.3); 2.5044 (102.1); 2.4999 (73.3);        2.4956 (34.8); 2.3354 (0.4); 2.3313 (0.6);        2.3268 (0.5); 1.6870 (12.7); 1.6698 (12.7); -        0.0002 (0.4)</p>	513.2
I-32		<p>I-32: <sup>1</sup>H-NMR(600.1 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 20.2266 (0.1); 9.5279 (3.8); 9.5155 (3.9);        9.1007 (6.0); 9.0995 (6.3); 9.0970 (6.4); 9.0957        (6.1); 8.6023 (5.7); 8.5985 (5.6); 8.5884 (5.9);        8.5846 (6.0); 8.5684 (0.2); 8.5262 (5.8); 8.5237        (6.2); 8.5184 (6.5); 8.5158 (6.4); 8.4876 (0.1);        8.4838 (0.1); 8.3446 (0.1); 8.3136 (0.5); 8.2991        (5.2); 8.2827 (12.5); 8.0334 (6.6); 8.0321 (6.6);        8.0195 (6.5); 8.0182 (6.5); 7.9507 (5.7); 7.9482        (6.0); 7.9371 (6.6); 7.9346 (6.4); 7.3723 (6.0);        7.3645 (5.7); 7.3588 (5.8); 7.3509 (6.1); 6.9511        (0.1); 5.7946 (0.6); 5.7833 (2.8); 5.7714 (4.0);        5.7595 (3.0); 5.7536 (2.5); 5.7480 (0.6); 3.7444        (0.1); 3.3160 (145.1); 2.6205 (0.5); 2.6174        (1.2); 2.6143 (1.7); 2.6112 (1.2); 2.6081 (0.6);        2.5384 (0.2); 2.5233 (4.3); 2.5202 (5.3); 2.5171        (4.8); 2.5084 (81.5); 2.5053 (185.4); 2.5022        (263.3); 2.4991 (188.4); 2.4961 (85.8); 2.3922        (0.5); 2.3892 (1.2); 2.3861 (1.7); 2.3830 (1.2);        2.3800 (0.6); 1.7374 (15.9); 1.7260 (16.0);        1.6470 (0.1); 1.4429 (0.3); 1.4309 (0.3); 1.3857        (0.1); 1.3523 (0.4); 1.3411 (0.1); 1.3369 (0.1);        1.2595 (0.2); 1.2501 (0.3); 1.2345 (0.7); 1.1111        (0.1); 1.0455 (0.5); 1.0433 (0.8); 1.0331 (0.8);        0.8516 (0.3); 0.8190 (0.3); 0.0968 (1.4); 0.0054        (12.0); -0.0001 (448.0); -0.0057 (13.9); -0.0269        (0.1); -0.1002 (1.4)</p>	505.5
I-33		<p>I-33: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.0841 (3.9); 9.0652 (4.0); 8.6535 (6.8);        8.6479 (6.9); 8.6470 (6.7); 8.5014 (5.2); 8.4976        (5.7); 8.4895 (5.7); 8.4857 (5.6); 8.1825 (5.3);        8.1759 (5.2); 8.1612 (6.0); 8.1546 (5.9); 7.8541        (5.0); 7.8503 (5.2); 7.8338 (5.9); 7.8300 (5.6);        7.8198 (7.7); 7.7982 (7.0); 7.3354 (10.5);        7.3234 (10.5); 7.3194 (9.4); 7.3153 (9.0);        7.3032 (5.3); 7.2551 (5.4); 5.6892 (0.6); 5.6720        (2.7); 5.6541 (3.9); 5.6361 (2.8); 5.6189 (0.6);        3.3390 (36.4); 2.6764 (0.4); 2.6719 (0.6);        2.6673 (0.5); 2.5253 (1.9); 2.5206 (2.9); 2.5119        (30.5); 2.5074 (62.6); 2.5028 (83.1); 2.4982        (58.7); 2.4937 (27.2); 2.3342 (0.4); 2.3297        (0.6); 2.3251 (0.4); 2.0746 (7.7); 2.0417 (0.8);        2.0291 (1.7); 2.0206 (1.8); 2.0169 (1.3); 2.0082        (3.5); 1.9996 (1.3); 1.9957 (2.0); 1.9873 (1.8);        1.9747 (0.9); 1.6849 (16.0); 1.6677 (15.9);        1.0375 (2.2); 1.0268 (5.4); 1.0211 (6.0); 1.0168        (3.1); 1.0108 (3.2); 1.0058 (5.5); 1.0002 (5.9);        0.9900 (2.4); 0.7722 (2.6); 0.7617 (6.6); 0.7565        (6.7); 0.7494 (6.2); 0.7441 (7.0); 0.7329 (2.1);        0.0080 (1.4); -0.0002 (40.8); -0.0085 (1.2)</p>	502.2

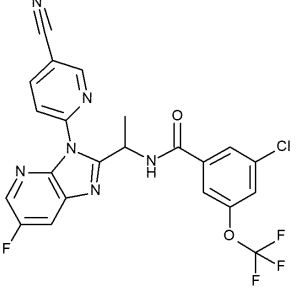
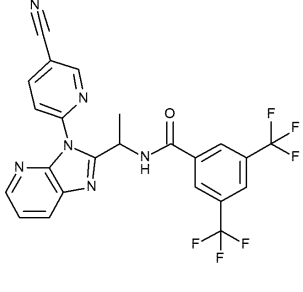
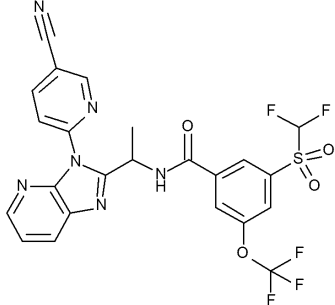
10

20

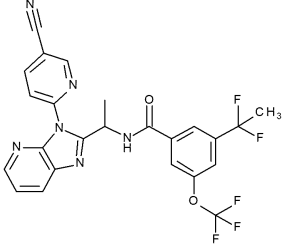
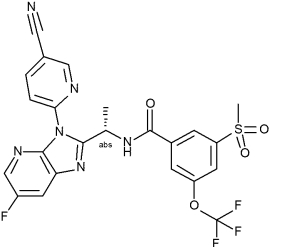
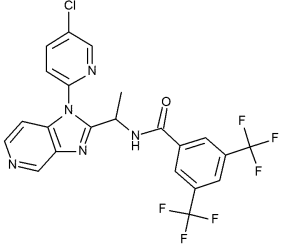
30

40

50

I-34		<p>I-34: <sup>1</sup>H-NMR(600.1 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2241 (4.1); 9.2118 (4.1); 9.0812 (6.4);  9.0775 (6.6); 8.5865 (4.3); 8.5828 (4.2); 8.5725  (4.4); 8.5687 (4.4); 8.4308 (4.6); 8.4281 (5.8);  8.3120 (1.0); 8.2529 (3.6); 8.2487 (3.4); 8.2377  (3.7); 8.2338 (3.2); 8.1165 (6.8); 8.1025 (6.4);  7.7834 (8.0); 7.7575 (5.4); 7.5777 (5.7); 5.7990  (2.8); 5.7874 (4.3); 5.7757 (2.8); 3.3260  (186.8); 3.3229 (343.5); 3.3212 (540.8); 3.3168  (566.6); 2.6139 (5.0); 2.5228 (9.8); 2.5198  (12.6); 2.5167 (12.1); 2.5076 (262.0); 2.5048  (580.9); 2.5018 (826.9); 2.4988 (635.9); 2.3857  (5.4); 1.6874 (15.8); 1.6759 (16.0); 0.0053  (2.0); -0.0001 (80.2)</p>	505.2	10
I-35		<p>I-35: <sup>1</sup>H-NMR(600.4 MHz, CD<sub>3</sub>CN):  <math>\delta</math>= 8.9221 (3.6); 8.9209 (3.7); 8.9184 (3.9);  8.9171 (3.6); 8.3808 (3.3); 8.3784 (3.5); 8.3729  (3.5); 8.3704 (3.5); 8.3275 (3.1); 8.3237 (3.1);  8.3134 (3.9); 8.3096 (4.0); 8.2207 (4.7); 8.2196  (4.7); 8.2066 (3.6); 8.2055 (3.6); 8.1859 (8.6);  8.1321 (3.5); 8.1031 (3.5); 8.1007 (3.6); 8.0898  (3.7); 8.0873 (3.6); 7.8100 (0.9); 7.7998 (1.0);  7.3955 (4.0); 7.3875 (4.0); 7.3822 (3.9); 7.3742  (3.9); 6.0166 (0.6); 6.0050 (2.1); 5.9930 (3.0);  5.9811 (2.2); 5.9695 (0.6); 5.4458 (10.2);  4.0656 (0.9); 4.0537 (0.9); 2.1373 (79.2);  2.1046 (0.9); 2.0541 (0.4); 2.0500 (0.6); 2.0459  (0.4); 1.9715 (4.4); 1.9635 (5.0); 1.9554 (2.2);  1.9512 (2.8); 1.9474 (34.9); 1.9433 (66.7);  1.9392 (98.1); 1.9351 (67.6); 1.9310 (34.2);  1.9223 (0.7); 1.8284 (0.4); 1.8242 (0.6); 1.8201  (0.4); 1.7373 (15.9); 1.7258 (16.0); 1.3792  (0.8); 1.2698 (0.4); 1.2158 (1.2); 1.2039 (2.4);  1.1921 (1.2); 1.1067 (0.4); 0.0967 (0.6); 0.0054  (4.5); -0.0001 (161.1); -0.0057 (5.4); -0.0127  (0.4); -0.1001 (0.6)</p>	505.1	20
I-36		<p>I-36: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.5733 (1.4); 9.5552 (1.5); 9.0794 (2.1);  9.0777 (2.4); 9.0739 (2.3); 9.0721 (2.3); 8.5712  (1.8); 8.5655 (1.8); 8.5500 (2.0); 8.5444 (2.0);  8.4068 (1.7); 8.4032 (2.0); 8.3948 (1.9); 8.3912  (2.0); 8.3248 (1.7); 8.3214 (3.2); 8.3180 (2.0);  8.2448 (1.8); 8.2412 (1.9); 8.2248 (2.0); 8.2212  (1.9); 8.1964 (2.0); 8.1943 (1.9); 8.1645 (2.4);  8.1628 (2.6); 8.1434 (2.2); 8.1417 (2.4); 8.1042  (2.0); 7.5603 (1.1); 7.4682 (1.9); 7.4561 (1.8);  7.4481 (1.8); 7.4361 (2.0); 7.4306 (2.6); 7.3008  (1.3); 5.8937 (1.0); 5.8761 (1.5); 5.8584 (1.0);  4.0394 (0.4); 4.0216 (0.4); 3.3419 (86.7);  2.5281 (0.9); 2.5234 (1.4); 2.5146 (15.0);  2.5102 (31.4); 2.5057 (41.9); 2.5011 (30.0);  2.4967 (14.2); 1.9913 (1.8); 1.7261 (5.3);  1.7089 (5.3); 1.3966 (16.0); 1.1943 (0.5);  1.1765 (1.0); 1.1587 (0.5); -0.0002 (0.7)</p>	566.1	30

40

I-37		<p>I-37: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2760 (3.2); 9.2577 (3.3); 9.0706 (5.2);  9.0651 (5.2); 8.5675 (3.7); 8.5618 (3.6); 8.5464 (4.0); 8.5407 (4.1); 8.3995 (3.5); 8.3961 (4.2);  8.3876 (3.8); 8.3841 (4.2); 8.2421 (3.7); 8.2386 (4.0); 8.2221 (4.1); 8.2186 (4.2); 8.1426 (5.6);  8.1214 (5.1); 7.8876 (5.7); 7.7347 (4.5); 7.7171 (4.5); 7.4630 (3.8); 7.4510 (3.6); 7.4430 (3.6);  7.4310 (3.6); 5.8937 (0.4); 5.8766 (2.1); 5.8590 (3.2); 5.8414 (2.2); 5.8240 (0.5); 5.7621 (10.3);  3.3434 (55.4); 2.5300 (0.7); 2.5253 (1.0);  2.5163 (15.6); 2.5121 (33.6); 2.5076 (45.7);  2.5032 (33.8); 2.0546 (7.1); 2.0071 (16.0);  1.9930 (0.6); 1.9594 (8.1); 1.7209 (12.0);  1.7037 (12.0); 1.3956 (1.2); 1.2476 (0.4);  1.2320 (0.4); -0.0002 (0.8)</p>	516.1
I-38		<p>I-38: <sup>1</sup>H-NMR(600.1 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.4527 (0.6); 9.4406 (0.6); 9.0998 (1.0);  9.0985 (1.0); 9.0960 (1.0); 9.0947 (1.0); 8.5971 (0.9);  8.5933 (0.9); 8.5831 (1.0); 8.5793 (1.0);  8.4409 (0.7); 8.4383 (0.8); 8.4365 (0.8); 8.4340 (0.7);  8.2885 (0.8); 8.2860 (1.5); 8.2835 (0.8);  8.2606 (0.7); 8.2562 (0.6); 8.2454 (0.8); 8.2410 (0.6);  8.1445 (1.0); 8.1432 (1.0); 8.1305 (1.0);  8.1292 (1.0); 8.0669 (0.7); 8.0657 (0.6); 7.9587 (0.7);  7.9571 (0.6); 5.8441 (0.4); 5.8323 (0.6);  5.8206 (0.4); 3.5231 (0.3); 3.3458 (6.5); 3.3368 (16.0);  3.2228 (0.2); 2.5298 (0.1); 2.5267 (0.1);  2.5236 (0.1); 2.5149 (2.3); 2.5118 (5.1); 2.5087 (7.2);  2.5056 (5.3); 2.5026 (2.4); 1.7199 (2.2);  1.7084 (2.2); 1.6662 (0.1); 1.6547 (0.1); -0.0001 (1.4)</p>	548.1
I-39		<p>I-39: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.8386 (0.7); 9.5603 (0.5); 9.5464 (0.5);  9.4507 (4.0); 9.4317 (4.1); 9.3739 (0.4); 9.3714 (0.4);  9.2852 (0.6); 9.2009 (0.5); 9.1981 (0.5);  9.1617 (0.6); 9.0767 (1.4); 8.6246 (7.7); 8.6183 (7.8);  8.6017 (2.1); 8.5446 (0.9); 8.5131 (0.6);  8.4912 (0.4); 8.4705 (0.5); 8.4062 (1.6); 8.3762 (1.5);  8.3187 (1.4); 8.3050 (7.4); 8.2857 (1.3);  8.2471 (16.0); 8.1752 (4.8); 8.1686 (4.6);  8.1539 (5.3); 8.1473 (5.2); 7.8985 (0.3); 7.8797 (0.4);  7.8231 (7.8); 7.8019 (7.0); 7.7714 (0.4);  7.7654 (0.4); 7.7496 (0.5); 7.7423 (0.5); 7.5398 (0.3);  7.4591 (2.9); 7.4462 (2.8); 7.3238 (0.4);  7.2918 (0.7); 7.2685 (0.6); 7.1851 (0.7); 7.0462 (0.4);  5.7551 (0.6); 5.7382 (2.7); 5.7202 (3.8);  5.7023 (2.7); 5.6854 (0.6); 4.5764 (0.3); 4.5591 (0.3);  4.1115 (0.9); 4.0984 (0.9); 3.9729 (1.9);  3.9601 (4.6); 3.7909 (0.4); 3.5683 (0.4); 3.3884 (1.2);  3.3352 (360.3); 3.2693 (0.4); 3.1740 (5.2);  3.1627 (4.9); 2.6765 (2.8); 2.6720 (3.8);  2.6677 (3.0); 2.5758 (0.4); 2.5568 (0.6); 2.5254 (12.5);  2.5118 (236.1); 2.5076 (466.0); 2.5031 (601.0);  2.4986 (423.1); 2.4944 (198.1); 2.3344 (2.7);  2.3299 (3.7); 2.3256 (2.6); 2.2332 (0.4);  2.2173 (0.4); 1.9094 (0.4); 1.7108 (15.9);  1.6937 (15.8); 1.6289 (1.0); 1.6122 (0.9);  1.5339 (2.0); 1.5160 (2.1); 1.4874 (0.4); 1.4501 (1.4);  1.4324 (1.3); 1.3791 (0.4); 1.3007 (5.6);  1.2590 (1.2); 1.2432 (2.9); 1.2344 (3.6); 1.2272 (2.6);  1.2185 (2.1); 1.2126 (1.6); 1.2067 (1.2);  1.1959 (1.2); 1.1904 (1.1); 1.1747 (0.5); 1.1574 (0.3);  1.0569 (0.4); 1.0476 (0.4); 0.8547 (0.4);  0.0079 (0.5); -0.0002 (11.3); -0.0086 (0.4)</p>	514.3

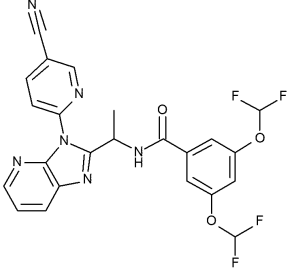
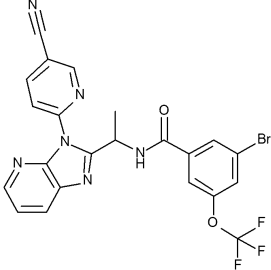
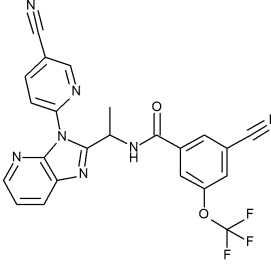
10

20

30

40

50

I-40		<p>I-40: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.1132 (3.4); 9.0949 (3.6); 9.0846 (5.9);  9.0803 (5.8); 9.0790 (5.6); 8.5862 (4.2); 8.5806  (4.1); 8.5651 (4.6); 8.5595 (4.6); 8.3967 (4.0);  8.3932 (4.6); 8.3848 (4.4); 8.3812 (4.6); 8.2321  (4.2); 8.2286 (4.4); 8.2121 (4.7); 8.2086 (4.5);  8.1574 (5.9); 8.1373 (5.3); 8.1363 (5.4); 7.5967  (0.4); 7.5529 (0.8); 7.4864 (7.3); 7.4578 (4.4);  7.4458 (4.1); 7.4378 (4.1); 7.4316 (0.6); 7.4258  (4.2); 7.3694 (1.6); 7.3601 (12.7); 7.3547  (13.7); 7.3412 (0.4); 7.3031 (15.1); 7.2090  (3.6); 7.2036 (6.3); 7.1983 (3.3); 7.1858 (0.7);  7.1197 (7.7); 7.0934 (0.5); 7.0257 (0.6); 5.8677  (0.5); 5.8506 (2.3); 5.8330 (3.6); 5.8153 (2.3);  5.7980 (0.5); 5.7586 (16.0); 3.3301 (15.4);  2.8644 (1.8); 2.5285 (0.6); 2.5238 (0.9); 2.5150  (14.5); 2.5106 (30.9); 2.5061 (41.7); 2.5015  (30.6); 2.4971 (15.1); 1.7015 (13.0); 1.6843  (13.0); 1.2326 (0.4); 1.2217 (0.4); 1.2169 (0.4);  1.2059 (0.4); 1.1785 (0.4); 1.1184 (0.5)</p>	500.1
I-41		<p>I-41: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2083 (1.5); 9.1902 (1.6); 9.0732 (2.6);  9.0678 (2.6); 8.5792 (1.9); 8.5735 (1.9); 8.5582  (2.1); 8.5524 (2.1); 8.3939 (1.9); 8.3904 (2.2);  8.3820 (2.1); 8.3784 (2.2); 8.2346 (2.0); 8.2310  (2.0); 8.2145 (2.2); 8.2109 (2.1); 8.1425 (2.8);  8.1214 (2.6); 7.9105 (1.9); 7.9067 (3.6); 7.9031  (2.4); 7.8610 (2.2); 7.6069 (2.2); 7.4579 (2.1);  7.4458 (2.0); 7.4378 (2.0); 7.4258 (2.0); 5.8418  (1.1); 5.8242 (1.7); 5.8065 (1.1); 3.3224  (406.8); 2.6793 (0.8); 2.6750 (1.7); 2.6704  (2.4); 2.6659 (1.8); 2.6617 (0.8); 2.5408 (1.8);  2.5239 (7.0); 2.5192 (10.0); 2.5105 (133.4);  2.5060 (278.8); 2.5015 (374.2); 2.4969 (271.0);  2.4925 (130.9); 2.3374 (0.8); 2.3328 (1.6);  2.3283 (2.3); 2.3238 (1.7); 2.3193 (0.8); 2.0738  (16.0); 1.6925 (6.4); 1.6753 (6.4); 0.1459 (0.7);  0.0080 (4.8); -0.0002 (159.4); -0.0084 (5.3); -  0.1497 (0.7)</p>	530.0
I-42		<p>I-42: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2959 (2.8); 9.2776 (2.9); 9.0820 (5.3);  9.0781 (4.9); 9.0764 (5.0); 8.5789 (4.0); 8.5732  (3.8); 8.5578 (4.4); 8.5521 (4.3); 8.3993 (3.8);  8.3956 (4.2); 8.3874 (4.1); 8.3837 (4.1); 8.3149  (0.4); 8.2369 (4.0); 8.2333 (4.0); 8.2168 (6.5);  8.2132 (7.9); 8.2047 (7.2); 8.2011 (8.1); 8.1599  (5.6); 8.1388 (5.1); 7.9208 (4.2); 7.4612 (4.0);  7.4492 (3.8); 7.4411 (3.8); 7.4292 (3.9); 5.8789  (0.5); 5.8615 (2.0); 5.8442 (3.3); 5.8264 (2.2);  5.8095 (0.4); 3.9083 (0.4); 3.4136 (0.4); 3.3858  (0.6); 3.3628 (1.1); 3.3214 (920.5); 3.2659  (0.3); 2.6790 (2.5); 2.6748 (5.1); 2.6702 (7.1);  2.6656 (5.2); 2.6611 (2.4); 2.6288 (0.4); 2.6101  (0.4); 2.6018 (0.5); 2.5942 (0.5); 2.5406 (3.2);  2.5237 (23.0); 2.5189 (35.7); 2.5102 (416.2);  2.5058 (839.8); 2.5012 (1105.7); 2.4967  (789.7); 2.4922 (373.2); 2.4475 (0.6); 2.4209  (0.3); 2.3371 (2.2); 2.3326 (4.9); 2.3281 (6.8);  2.3235 (4.9); 2.3190 (2.3); 2.0737 (16.0);  1.7019 (12.0); 1.6847 (12.1); 1.2364 (0.4);  0.1458 (2.2); 0.0080 (18.4); -0.0002 (522.6); -  0.0085 (16.8); -0.1498 (2.2)</p>	477.1

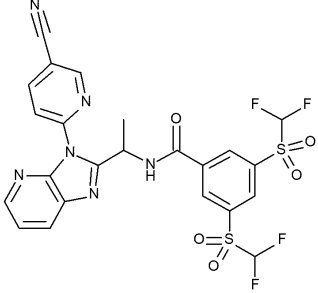
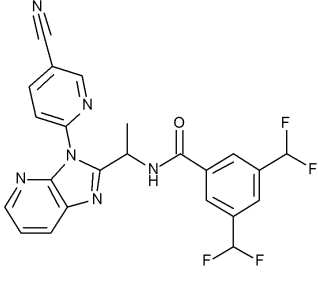
10

20

30

40

50

I-43		<p>I-43: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.8445 (1.3); 9.8257 (1.4); 9.0854 (2.3);  9.0799 (2.2); 8.7650 (6.2); 8.7611 (6.4); 8.5800  (1.6); 8.5741 (1.6); 8.5588 (1.8); 8.5532 (1.9);  8.4671 (2.9); 8.4090 (1.6); 8.4054 (1.8); 8.3970  (1.7); 8.3934 (1.8); 8.3156 (0.4); 8.2409 (1.7);  8.2375 (1.8); 8.2210 (1.8); 8.2174 (1.8); 8.1804  (2.4); 8.1585 (2.2); 7.6261 (2.0); 7.4963 (4.6);  7.4685 (1.6); 7.4563 (1.7); 7.4484 (1.6); 7.4364  (1.6); 7.3665 (2.3); 5.9141 (0.9); 5.8966 (1.6);  5.8791 (1.1); 3.6141 (0.4); 3.5141 (0.4); 3.4882  (0.5); 3.4526 (0.5); 3.4475 (0.5); 3.4109 (0.6);  3.3869 (1.0); 3.3650 (1.6); 3.3211 (1387.0);  3.2692 (0.7); 3.2391 (0.4); 3.2209 (0.3); 2.7113  (0.3); 2.6932 (0.6); 2.6747 (7.9); 2.6701 (10.9);  2.6656 (8.2); 2.6610 (4.1); 2.6310 (0.6); 2.5956  (0.7); 2.5910 (0.7); 2.5405 (13.1); 2.5236  (33.6); 2.5189 (48.8); 2.5101 (627.5); 2.5057  (1288.4); 2.5012 (1714.4); 2.4967 (1244.2);  2.4923 (607.5); 2.4181 (0.5); 2.4128 (0.4);  2.3980 (0.4); 2.3369 (3.4); 2.3327 (7.5); 2.3279  (10.6); 2.3235 (7.8); 2.0857 (0.4); 2.0736  (16.0); 1.7383 (5.2); 1.7212 (5.1); 1.3575 (0.4);  1.3367 (0.4); 1.2368 (0.4); 0.1459 (3.5); 0.0278  (0.5); 0.0079 (24.6); -0.0002 (786.1); -0.0085  (27.4); -0.0219 (1.2); -0.1497 (3.4)</p>	596.1	10
I-44		<p>I-44: <sup>1</sup>H-NMR(400.2 MHz, d<sub>6</sub>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2979 (3.9); 9.2795 (4.0); 9.0678 (6.9);  9.0637 (6.5); 9.0623 (6.8); 8.5633 (4.9); 8.5577  (4.8); 8.5422 (5.5); 8.5366 (5.5); 8.3923 (4.8);  8.3887 (5.5); 8.3803 (5.2); 8.3767 (5.4); 8.2309  (5.0); 8.2274 (5.3); 8.2110 (5.5); 8.2074 (5.4);  8.1465 (7.3); 8.1254 (6.8); 8.0194 (13.4);  7.9041 (6.0); 7.4554 (5.1); 7.4434 (4.9); 7.4353  (5.0); 7.4233 (5.0); 7.2820 (5.7); 7.1434 (13.2);  7.0049 (6.2); 5.8966 (0.6); 5.8797 (2.8); 5.8621  (4.3); 5.8445 (2.8); 5.8261 (0.6); 3.3651 (1.0);  3.3209 (929.8); 3.2645 (0.4); 2.6747 (5.2);  2.6702 (7.5); 2.6656 (5.4); 2.6612 (2.7); 2.6126  (0.5); 2.5406 (12.1); 2.5237 (22.6); 2.5190  (32.8); 2.5101 (420.1); 2.5057 (871.4); 2.5012  (1168.6); 2.4967 (851.3); 2.4922 (414.9);  2.4396 (0.7); 2.4161 (0.4); 2.3371 (2.4); 2.3325  (5.2); 2.3281 (7.3); 2.3236 (5.4); 2.0738 (7.6);  1.7042 (16.0); 1.6870 (16.0); 1.3562 (0.3);  0.1458 (2.0); 0.0080 (15.1); -0.0002 (501.7); -  0.0085 (17.0); -0.0226 (0.5); -0.1497 (2.1)</p>	468.1	20 30

1) ‘abs’ は、当該化合物が、図中に描かれている絶対配置を有する主要な立体異性体を含んでいるエナンチオマー的に富化された又は純粋な形態で得られたことを示している。

2) ‘低 T’は、当該測定が 260 ケルビンの温度で実施されたことを示している。

3) 記載されている質量は、最も強い強度を有する [M+H]<sup>+</sup> イオンの同位体パターンからのピークに対応する。#は、[M-H]<sup>-</sup> イオンが記録されたことを示している。

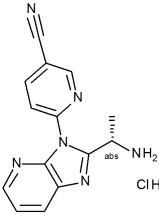
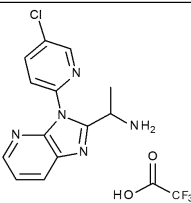
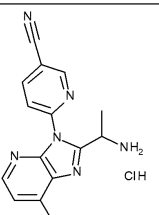
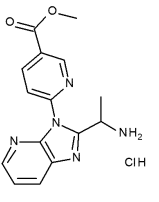
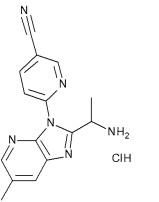
40

【 0 3 8 0 】

50

## 【表 3】

表 2 — 中間体

実施例	構造 <sup>1)</sup>	NMR ピークリスト <sup>2)</sup>	ESI 質量 (m/z) <sup>3)</sup>
INT-1		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO) δ= 9.18 – 9.17 (dd, 1H), 8.79 – 8.78 (bd, 2H, NH <sub>2</sub> ), 8.73 – 8.71 (dd, 1H), 8.53 – 8.50 (m, 2H), 8.33 – 8.31 (dd, 1H), 7.56 – 7.53 (dd, 1H), 5.27 – 5.18 (m, 1H), 1.62 – 1.60 (d, 3H).	265.2 [732+H <sup>+</sup> ]
INT-2			274.1 [732+H <sup>+</sup> ]
INT-3			279.2 [732+H <sup>+</sup> ]
INT-4		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.1796 (1.2); 9.1750 (1.3); 8.8275 (0.4); 8.8230 (0.4); 8.7908 (1.2); 8.7008 (0.8); 8.6950 (0.8); 8.6794 (0.9); 8.6737 (0.9); 8.5309 (0.9); 8.5276 (1.0); 8.5190 (0.9); 8.5156 (0.9); 8.4508 (1.3); 8.4296 (1.1); 8.3292 (0.9); 8.3260 (0.9); 8.3092 (1.0); 8.3058 (1.0); 8.2873 (0.3); 7.5529 (0.8); 7.5409 (0.8); 7.5328 (0.8); 7.5208 (0.8); 5.2145 (0.4); 3.9582 (7.5); 3.8679 (2.0); 3.8383 (0.6); 3.8208 (0.7); 3.8039 (0.5); 3.7965 (0.5); 3.7717 (0.5); 3.7562 (0.9); 3.7336 (0.4); 3.7155 (0.4); 3.7119 (0.4); 3.7016 (0.4); 3.6804 (0.4); 3.5683 (16.0); 2.5083 (28.6); 2.5040 (37.1); 2.4997 (28.0); 1.6206 (3.0); 1.6038 (3.0); 1.5085 (0.6); 1.4910 (0.6); 1.2336 (0.7); -0.0002 (3.9)	298.4 [732+H <sup>+</sup> ]
INT-5			279.2 [732+H <sup>+</sup> ]

10

20

30

40

50



INT-6			279.2 [アミン+H <sup>+</sup> ]	
INT-7		<sup>1</sup> H-NMR(400.2 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 11.4123 (1.2); 10.8503 (1.4); 9.7021 (1.8); 9.1542 (2.0); 8.8940 (2.9); 8.8877 (3.0); 8.8240 (2.8); 8.8082 (1.7); 8.7846 (1.1); 8.7691 (1.2); 8.5805 (1.4); 8.5738 (1.4); 8.4838 (1.1); 8.4681 (3.8); 8.4620 (3.4); 8.4465 (1.8); 8.4401 (1.9); 8.1636 (1.8); 8.1475 (1.7); 8.0652 (2.7); 8.0437 (2.6); 8.0400 (1.5); 8.0330 (1.0); 8.0175 (1.2); 8.0109 (1.2); 7.8842 (1.6); 7.8620 (1.2); 4.8996 (0.7); 4.4357 (0.4); 4.4219 (0.5); 4.4066 (0.4); 3.1666 (8.4); 2.5294 (0.9); 2.5118 (28.6); 2.5074 (37.6); 2.5030 (28.4); 2.0791 (16.0); 1.5839 (6.0); 1.5665 (7.4); 1.5461 (3.4)	10	274.3 [アミン+H <sup>+</sup> ]
INT-8		<sup>1</sup> H-NMR (600.1 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ = 8.8227 (1.9); 8.8220 (1.9); 8.8184 (2.0); 8.8176 (1.9); 8.7373 (1.4); 8.7313 (1.4); 8.6617 (0.1); 8.6299 (0.1); 8.6251 (0.1); 8.5961 (1.6); 8.5937 (1.7); 8.5883 (1.8); 8.5858 (1.7); 8.4440 (0.1); 8.3713 (1.7); 8.3669 (1.6); 8.3570 (1.8); 8.3526 (1.7); 8.3167 (0.2); 8.2605 (0.2); 8.2498 (0.2); 8.2288 (0.1); 8.2119 (0.1); 8.1415 (0.2); 8.1378 (0.4); 8.1266 (0.2); 8.1222 (0.1); 8.0741 (1.6); 8.0716 (1.7); 8.0604 (1.8); 8.0579 (1.8); 7.9260 (2.2); 7.9252 (2.1); 7.9117 (2.1); 7.9109 (2.0); 7.7110 (0.1); 7.7065 (0.1); 7.6963 (0.1); 7.6917 (0.1); 7.4599 (1.6); 7.4520 (1.6); 7.4462 (1.6); 7.4383 (1.6); 4.9961 (0.2); 4.9873 (0.4); 4.9778 (0.5); 4.9671 (0.4); 4.9570 (0.2); 4.7158 (1.1); 4.5296 (0.1); 4.5224 (0.1); 4.5145 (0.1); 4.3305 (0.1); 4.0693 (0.2); 3.7756 (0.2); 3.7713 (0.1); 3.7681 (0.2); 3.7650 (0.1); 3.7606 (0.1); 3.7139 (0.7); 3.6822 (0.1); 3.6743 (0.1); 3.6664 (0.1); 3.5698 (16.0); 3.3937 (0.1); 3.0159 (1.1); 2.8890 (1.0); 2.6922 (4.5); 2.6205 (0.2); 2.6174 (0.3); 2.6144 (0.2); 2.5564 (0.1); 2.5471 (0.2); 2.5378 (0.2); 2.5264 (0.7); 2.5233 (0.8); 2.5202 (0.8); 2.5115 (14.5); 2.5085 (32.2); 2.5054 (45.2); 2.5023 (32.4); 2.4993 (14.8); 2.3924 (0.2); 2.3893 (0.3); 2.3862 (0.2); 1.9102 (0.3); 1.5564 (5.1); 1.5450 (5.1); 1.5359 (0.5); 1.4161 (0.3); 1.4045 (0.3); 1.3942 (0.2); 1.3822 (0.2); 1.3577 (0.3); 1.3088 (0.5); 1.2973 (0.5); 1.2365 (0.4); 1.1125 (0.2); 1.0446 (0.2); 1.0345 (0.2); 0.0968 (0.3); 0.0054 (2.1); -0.0001 (72.5); -0.0057 (2.3); -0.1003 (0.3)	20	274.3 [アミン+H <sup>+</sup> ]

1) 'abs' は、当該化合物が、図中に描かれている絶対配置を有する主要な立体異性体を含んでいるエナンチオマー的に富化された又は純粋な形態で得られたことを示している。

2) '低 T' は、当該測定が 260 ケルビンの温度で実施されたことを示している。

3) 記載されている質量は、最も強い強度を有する [M+H]<sup>+</sup> イオンの同位体パターンからのピークに対応する。#は、[M-H]<sup>-</sup> イオンが記録されたことを示している。

40

### 【 0 3 8 1 】

#### 生物学的実施例

オウシマダニ (Rhipicephalus (Boophilus) microplus) - インピトロ接触試験 幼虫オウシマダニ (合成ピレスロイドに対して抵抗性を示す Parkhurst 系統)

9 mg の化合物を 1 mL のアセトンに溶解させ、アセトンで希釈して所望の濃度とする。250 μL の該試験溶液を 25 mL 容ガラス製試験管の中に入れ、振盪装置上で回転及び傾斜させる (30 rpm で 2 時間) ことによってその内壁に均一に分配させる。900 ppm の化合物濃度、44.7 cm<sup>2</sup> の内表面及び均一な分配によって、5 μg / cm<sup>2</sup>

50

の薬量が達成される。

【0382】

溶媒が蒸発した後、各試験管に20～50匹の幼虫オウシマダニ (*Rhipicephalus microplus*) を入れ、孔が開けられている蓋で閉じ、インキュベーター内で、85%相対湿度及び27℃で、水平位でインキュベートする。48時間経過した後、効力を求める。その幼虫を試験管を軽くたたいてその底に落とし、負の走地性行動を記録する。無処理対照幼虫と同じようにパイアルの上部に上ってきた幼虫は生存として記録し、無処理対照幼虫と同じようには上ってこないが、動きがギクシャクとしているか又は足を痙攣させているだけの幼虫は死にかけているとして記録しとし、底に残って全く動かないダニ幼虫は死んでいるとしてカウントする。

10

【0383】

ある化合物が5 µg / cm<sup>2</sup>の化合物濃度で少なくとも80%の効力がモニターされた場合、その化合物は、オウシマダニ (*Rhipicephalus microplus*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのオウシマダニ幼虫が死んだか又は死にかけていることを意味し；0%は、死んだか又は死にかけているオウシマダニ幼虫が無かったことを意味する。

【0384】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、5 µg / cm<sup>2</sup> (= 500 g / ha) の施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 2。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、5 µg / cm<sup>2</sup> (= 500 g / ha) の施用量で、90%の良好な活性を示した： I - 3。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、5 µg / cm<sup>2</sup> (= 500 g / ha) の施用量で、80%の良好な活性を示した： I - 1。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg / cm<sup>2</sup> (= 100 g / ha) の施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 2、I - 8、I - 14、I - 15、I - 16、I - 31。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg / cm<sup>2</sup> (= 100 g / ha) の施用量で、90%の良好な活性を示した： I - 1、I - 3、I - 6、I - 7、I - 11、I - 13。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg / cm<sup>2</sup> (= 100 g / ha) の施用量で、80%の良好な活性を示した： I - 9。

【0385】

オウシマダニ (*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*) - 注入試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、10 mgの活性化化合物を0.5 mLの溶媒に溶解させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0386】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ (*Rhipicephalus microplus*) の腹部に1 µLの化合物溶液を注入する。そのオウシマダニをレプリカプレートに移し、人工気象室内でインキュベートする。

40

【0387】

7日間経過した後、受精卵の産卵についてモニターする。受精していることが明白ではない卵は、約42日後に孵化するまで人工気象室の中で保存する。100%の効力は、全ての卵が無精卵であることを意味し；0%は、全ての卵が受精していることを意味する。

【0388】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、マダニ1匹当たり4 µgの施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 1、I - 2、I - 3。

【0389】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - 経口試験

50

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、10 mgの活性化化合物を0.5 mLの溶媒に溶解させ、得られた濃厚物をクエン酸塩が添加されたウシ血液で希釈して所望の濃度とする。

【0390】

餌を与えていない約20匹の成体ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を頂部及び底部がガーゼで覆われているノミチャンパーの中に入れる。底面がパラフィルムで密閉されているチャンパーに血液-化合物溶液を入れ、該ノミチャンパーの頂部の上に配置し、それによって、ネコノミは該血液を吸うことができる。その血液チャンパーを37 に加熱し、ノミチャンパーは、室温で維持する。

10

【0391】

2日間経過した後、死虫率(%)を求める。100%は、全てのネコノミが死んだことを意味し；0%は、死んだネコノミが無かったことを意味する。

【0392】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppmの施用量で、100%の良好な活性を示した： I-1。

【0393】

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) - インビトロ接触試験  
成体ネコノミ

9 mgの化合物を1 mLのアセトンに溶解させ、アセトンで希釈して所望の濃度とする。250 µLの該試験溶液を25 mL容ガラス製試験管の中に入れ、振盪装置上で回転及び傾斜させる(30 rpmで2時間)ことによってその内壁に均一に分配させる。900 ppmの化合物濃度、44.7 cm<sup>2</sup>の内表面及び均一な分配によって、5 µg/cm<sup>2</sup>の薬量が達成される。

20

【0394】

溶媒が蒸発した後、各試験管に5~10匹の成体ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) を入れ、孔が開けられている蓋で閉じ、室温及び室内相対湿度で、横向位置でインキュベートする。48時間経過した後、効力を求める。そのネコノミを試験管を軽くたたいてその底に落とし、加熱プレート上で45-50 で最大5分間インキュベートする。動けないままでいるか又は動きがギクシャクとしていて、這い上がることによって熱を回避することができないネコノミは、死んでいるか又は死にかけているとして記録する。

30

【0395】

ある化合物が5 µg/cm<sup>2</sup>の化合物濃度で少なくとも80%の効力がモニターされた場合、その化合物は、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのネコノミが死んだか又は死にかけていることを意味し；0%は、死んだか又は死にかけているネコノミが無かったことを意味する。

【0396】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg/cm<sup>2</sup> (= 100 g/ha)の施用量で、80%の良好な活性を示した： I-15。

40

【0397】

クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) - 成体クリイロコイタマダニを用いたインビトロ接触試験

9 mgの化合物を1 mLのアセトンに溶解させ、アセトンで希釈して所望の濃度とする。250 µLの該試験溶液を25 mL容ガラス製試験管の中に入れ、振盪装置上で回転及び傾斜させる(30 rpmで2時間)ことによってその内壁に均一に分配させる。900 ppmの化合物濃度、44.7 cm<sup>2</sup>の内表面及び均一な分配によって、5 µg/cm<sup>2</sup>の薬量が達成される。

【0398】

50

溶媒が蒸発した後、各試験管に5～10匹の成体クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) を入れ、孔が開けられている蓋で閉じ、室温及び室内相対湿度で、横向位置でインキュベートする。48時間経過した後、効力を求める。そのクリイロコイタマダニを試験管を軽くたたいてその底に落とし、加熱プレート上で45～50℃で最大5分間インキュベートする。動けないままでいるか又は動きがギクシャクとしていて、這い上がることによって熱を回避することができないクリイロコイタマダニは、死んでいるか又は死にかけているとして記録する。

【0399】

ある化合物が5 µg/cm<sup>2</sup>の化合物濃度で少なくとも80%の効力がモニターされた場合、その化合物は、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) に対して良好な効力を示す。100%の効力は、全てのクリイロコイタマダニが死んだか又は死にかけていることを意味し；0%は、死んだか又は死にかけているクリイロコイタマダニが無かったことを意味する。

【0400】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg/cm<sup>2</sup> (= 100 g/ha) の施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 17。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、1 µg/cm<sup>2</sup> (= 100 g/ha) の施用量で、80%の良好な活性を示した： I - 8、I - 13、I - 15。

【0401】

ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) - 経口試験

溶媒： 100重量部のアセトン

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

【0402】

50 µLの化合物溶液をマイクロタイタープレートの中に入れ、150 µLのIPL41昆虫培地 (33% + 15%糖) を添加して総体積200 µL/ウェルとする。その後、そのプレートをパラフィルムで密閉し、そのパラフィルムを通して、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) の混合個体群が該化合物調製物を吸うことができる。

【0403】

5日間経過した後、死虫率 (%) を求める。100%は、全てのワタアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだワタアブラムシが無かったことを意味する。

【0404】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 ppmの施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 4、I - 5、I - 7、I - 9、I - 10、I - 24、I - 27。

【0405】

ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) - 噴霧試験

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。さらなる試験濃度は、乳化剤を含有している水で希釈することによって調製する。

【0406】

浸漬させたコムギ (*Triticum aestivum*) 種子を寒天と少量の水で満たされているマルチウェルプレートの中に置き、1日間インキュベートして発芽させる (ウェル1つ当たり5種子)。発芽したコムギ種子に所望濃度の活性成分を含んでいる試験溶液を噴霧する。その後、各ユニットに10～20匹のジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) の幼虫を寄生させる。

10

20

30

40

50

## 【0407】

7日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのコムギ実生が無処理の寄生されていない対照と同様に成長したことを意味し；0%は、成長したコムギ実生が無かったことを意味する。

## 【0408】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/ha(=32μg/ウェル)の施用量で、100%の良好な活性を示した：I-1、I-3、I-4、I-8、I-9、I-11、I-12、I-15、I-16、I-31、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-40、I-41。

## 【0409】

サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita) - 試験  
溶媒：125.0重量部のアセトン

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

## 【0410】

容器に、砂、活性成分の溶液、サツマイモネコブセンチュウ(Meloidogyne incognita)の卵と幼虫を含んでいる懸濁液及びレタス種子を入れる。レタス種子が発芽し、実生が成長する。根では、こぶが発生する。

## 【0411】

14日間経過した後、こぶの形成によって殺線虫効力(%)を求める。100%は、こぶが見られなかったことを意味し、0%は、処理された植物の根で見られたこぶの数が処理されていない対照植物の根で見られたこぶの数に相当したことを意味する。

## 【0412】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、90%の良好な活性を示した：I-25、I-27、I-38。

## 【0413】

モモアカアブラムシ(Myzus persicae) - 経口試験

溶媒：100重量部のアセトン

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を水で希釈して所望の濃度とする。

## 【0414】

50μLの化合物溶液をマイクロタイタープレートの中に入れ、150μLのIPL41昆虫培地(33%+15%糖)を添加して総体積200μL/ウェルとする。その後、そのプレートをパラフィルムで密閉し、そのパラフィルムを通して、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)の混合個体群が該化合物調製物を吸うことができる。

## 【0415】

5日間経過した後、死虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

## 【0416】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、100%の良好な活性を示した：I-4、I-5、I-7、I-9、I-10、I-24、I-27。

## 【0417】

モモアカアブラムシ(Myzus persicae) - 噴霧試験

溶媒：78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。さらなる試験濃度は、乳化剤を含有している水で希釈することによって調製する。

10

20

30

40

50

## 【0418】

全ての齡のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が寄生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性成分の調製物を噴霧する。

## 【0419】

5日間経過した後、死虫率(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し、0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

## 【0420】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の良好な活性を示した： I-9。

10

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、100%の良好な活性を示した： I-3、I-35。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100g/haの施用量で、90%の良好な活性を示した： I-6、I-15、I-26、I-31。

## 【0421】

ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*) - 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、得られた濃厚物を1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。さらなる試験濃度は、乳化剤を含有している水で希釈することによって調製する。

20

## 【0422】

オオムギ (*Hordeum vulgare*) 植物に、所望濃度の活性成分を含んでいる試験溶液を噴霧し、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*) の幼虫を寄生させる。

## 【0423】

4日間経過した後、死虫率(%)を求める。100%は、全てのミナミアオカメムシが死んだことを意味し；0%は、死んだミナミアオカメムシが無かったことを意味する。

30

## 【0424】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の良好な活性を示した： I-3、I-4、I-5、I-10、I-12、I-25、I-28、I-30、I-31、I-38、I-39。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の良好な活性を示した： I-29。

## 【0425】

トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) - 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。さらなる試験濃度は、乳化剤を含有している水で希釈することによって調製する。

40

## 【0426】

イネ (*Oryza sativa*) 植物に所望濃度の該活性成分の調製物を噴霧し、その植物にトビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*) を寄生させる。

## 【0427】

4日間経過した後、死虫率(%)を求める。100%は、全てのトビイロウンカが死んだことを意味し、0%は、死んだトビイロウンカが無かったことを意味する。

50

## 【0428】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / haの施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 1、I - 26。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500 g / haの施用量で、90%の良好な活性を示した： I - 3、I - 4、I - 15、I - 40。

## 【0429】

ツマジロクサヨトウ (Spodoptera frugiperda) - 噴霧試験

溶媒： 78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記量の溶媒と混合させ、1000 ppmの濃度の乳化剤を含有している水で希釈して所望の濃度とする。さらなる試験濃度は、乳化剤を含有している水で希釈することによって調製する。

## 【0430】

トウモロコシ (Zea mays) の葉の切片に所望濃度の活性成分の調製物を噴霧する。乾燥後、その葉の切片にツマジロクサヨトウ (fall army worm) (Spodoptera frugiperda) の幼虫を寄生させる。

## 【0431】

7日間経過した後、死虫率 (%) を求める。100%は、全てのツマジロクサヨトウ幼虫が死んだことを意味し、0%は、死んだツマジロクサヨトウ幼虫が無かったことを意味する。

## 【0432】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / haの施用量で、100%の良好な活性を示した： I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 5、I - 6、I - 7、I - 8、I - 9、I - 10、I - 11、I - 12、I - 15、I - 16、I - 20、I - 23、I - 31、I - 32、I - 33、I - 34、I - 35、I - 36、I - 37、I - 38、I - 40、I - 41、I - 42。

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、100 g / haの施用量で、83%の良好な活性を示した： I - 14、I - 44。

## 【0433】

ネッタイシマカ (Aedes aegypti) 試験 (AEDSAE 表面処理及び接触アッセイ)

溶媒： アセトン + 2000 ppm ナタネ油メチルエステル (RME)

十分な活性成分含有溶液を製造するために、当該試験化合物を溶媒混合物 (アセトン 2 mg / mL / RME 2000 ppm) に溶解させることが必要である。この溶液をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、アセトンが蒸発した後、その乾燥した表面の上に、ネッタイシマカ (Aedes aegypti) 種の系統 MONHEIM の成体蚊を配置する。暴露時間は、30分である。当該昆虫をその処理された表面と接触させてから24時間経過した後、死虫率 (%) を求める。100%の死虫率は、全ての被験昆虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ昆虫が無かったことを意味する。

## 【0434】

以下の実施例は、この試験において、20 mg / m<sup>2</sup> の表面濃度で、80 - 100% の効力を示した： I - 1、I - 2、I - 3、I - 7、I - 8、I - 10、I - 11、I - 14、I - 15、I - 16、I - 24、I - 26、I - 31、I - 35、I - 40。

以下の実施例は、この試験において、4 mg / m<sup>2</sup> の表面濃度で、80 - 100% の効力を示した： I - 3、I - 4、I - 6、I - 10、I - 15、I - 16、I - 24、I - 27、I - 31、I - 35、I - 40。

## 【0435】

ネッタイエカ (Culex quinquefasciatus) 試験 (CULXFA 表面処理及び接触アッセイ)

10

20

30

40

50

溶媒： アセトン + 2000 ppm ナタネ油メチルエステル (RME)

十分な活性成分含有溶液を製造するために、当該試験化合物を溶媒混合物 (アセトン 2 mg/mL / RME 2000 ppm) に溶解させることが必要である。この溶液をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、アセトンが蒸発した後、その乾燥した表面上に、ネッタイイカ (*Culex quinquefasciatus*) 種の系統 P00 の成体蚊を配置する。暴露時間は、30分である。当該昆虫をその処理された表面と接触させてから24時間経過した後、死虫率 (%) を求める。100%の死虫率は、全ての被験昆虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ昆虫が無かったことを意味する。

【0436】

以下の実施例は、この試験において、20 mg/m<sup>2</sup>の表面濃度で、80 - 100%の効力を示した： I - 3、I - 15、I - 24、I - 31、I - 35。 10

以下の実施例は、この試験において、4 mg/m<sup>2</sup>の表面濃度で、80 - 100%の効力を示した： I - 3、I - 10、I - 24、I - 33。

【0437】

イエバエ (*Musca domestica*) 試験 (MUSCDO 表面処理及び接触アッセイ)

溶媒： アセトン + 2000 ppm ナタネ油メチルエステル (RME)

十分な活性成分含有溶液を製造するために、当該試験化合物を溶媒混合物 (アセトン 2 mg/mL / RME 2000 ppm) に溶解させることが必要である。この溶液をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、アセトンが蒸発した後、その乾燥した表面上に、イエバエ (*Musca domestica*) 種の系統 WHO - N の成体ハエを配置する。暴露時間は、30分である。当該昆虫をその処理された表面と接触させてから24時間経過した後、死虫率 (%) を求める。100%の死虫率は、全ての被験昆虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ昆虫が無かったことを意味する 20

【0438】

以下の実施例は、この試験において、20 mg/m<sup>2</sup>の表面濃度で、80 - 100%の効力を示した： I - 1、I - 2、I - 3、I - 8、I - 9、I - 11、I - 14、I - 15、I - 16、I - 31、I - 35、I - 40。

以下の実施例は、この試験において、4 mg/m<sup>2</sup>の表面濃度で、80 - 100%の効力を示した： I - 3、I - 11、I - 15、I - 16、I - 31、I - 35、I - 40。 30

【0439】

チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 試験 (BLTTGE 表面処理及び接触アッセイ)

溶媒： アセトン + 2000 ppm ナタネ油メチルエステル (RME)

十分な活性成分含有溶液を製造するために、当該試験化合物を溶媒混合物 (アセトン 2 mg/mL / RME 2000 ppm) に溶解させることが必要である。この溶液をピペットで光沢のあるタイルの上に移し、アセトンが蒸発した後、その乾燥した表面上に、チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) 種の系統 PAULINIA の成体動物を配置する。暴露時間は、30分である。

【0440】

当該昆虫をその処理された表面と接触させてから24時間経過した後、死虫率 (%) を求める。100%の死虫率は、全ての被験昆虫が死んだことを意味し、0%は、死んだ昆虫が無かったことを意味する 40

【0441】

以下の実施例は、この試験において、20 mg/m<sup>2</sup>の表面濃度で、80 - 100%の効力を示した： I - 31。



## 【 国際調査報告 】

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No <b>PCT/EP2022/061692</b>
----------------------------------------------------------

<b>A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER</b>		
INV. <b>C07D471/04</b>	<b>A01N43/50</b>	<b>A01N43/90</b>
		<b>A01P5/00</b>
		<b>A01P7/00</b>
ADD.		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
<b>B. FIELDS SEARCHED</b>		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) <b>C07D A01N</b>		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) <b>EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data</b>		
<b>C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT</b>		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
<b>X</b>	<b>EP 3 766 881 A1 (NIPPON SODA CO [JP])</b> <b>20 January 2021 (2021-01-20)</b> <b>A</b> <b>claims 1, 2, 4, 5</b> <b>paragraph [0153]</b> <b>paragraph [0093]</b> -----	<b>1-4, 6, 7,</b> <b>9-20</b> <b>5, 8</b>
<b>X</b>	<b>WO 2020/250183 A1 (PI IND LTD [IN])</b> <b>17 December 2020 (2020-12-17)</b> <b>A</b> <b>claims 1, 6, 11</b> <b>page 75, line 20 - page 79, line 2</b> -----	<b>1-4, 6, 7,</b> <b>9-20</b> <b>5, 8</b>
<b>X</b>	<b>WO 2021/013719 A1 (BAYER AG [DE])</b> <b>28 January 2021 (2021-01-28)</b> <b>cited in the application</b> <b>A</b> <b>claims 1, 11</b> <b>page 152, line 9</b> <b>page 146; compounds II-115</b> -----	<b>1-4, 6, 7,</b> <b>9-20</b> <b>5, 8</b>
<input type="checkbox"/> Further documents are listed in the continuation of Box C. <input checked="" type="checkbox"/> See patent family annex.		
* Special categories of cited documents :		
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention	
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone	
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art	
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	"&" document member of the same patent family	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed		
Date of the actual completion of the international search <b>5 July 2022</b>	Date of mailing of the international search report <b>14/07/2022</b>	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Fax: (+31-70) 340-3016	Authorized officer <b>Brandstetter, T</b>	

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (April 2005)

10

20

30

40

1

50

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2022/061692

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 3766881	A1	20-01-2021	BR 112020016773 A2	15-12-2020
			CN 111801329 A	20-10-2020
			EP 3766881 A1	20-01-2021
			JP WO2019176791 A1	08-04-2021
			KR 20200130263 A	18-11-2020
			TW 201938027 A	01-10-2019
			US 2021002263 A1	07-01-2021
			WO 2019176791 A1	19-09-2019
-----				
WO 2020250183	A1	17-12-2020	AR 119140 A1	24-11-2021
			AU 2020292714 A1	23-12-2021
			BR 112021025247 A2	26-04-2022
			CA 3141286 A1	17-12-2020
			CN 114008043 A	01-02-2022
			EP 3983411 A1	20-04-2022
			KR 20220024198 A	03-03-2022
			TW 202112775 A	01-04-2021
			UY 38749 A	29-01-2021
			WO 2020250183 A1	17-12-2020
			-----	
WO 2021013719	A1	28-01-2021	AU 2020318590 A1	17-02-2022
			BR 112022000942 A2	17-05-2022
			CA 3148209 A1	28-01-2021
			CN 114423748 A	29-04-2022
			CO 2022000516 A2	28-01-2022
			DO P2022000011 A	15-03-2022
			EP 4003973 A1	01-06-2022
			KR 20220038403 A	28-03-2022
			TW 202118391 A	16-05-2021
			UY 38796 A	26-02-2021
			WO 2021013719 A1	28-01-2021
-----				

10

20

30

40

50

## フロントページの続き

## (51)国際特許分類

A 0 1 N 53/14 (2006.01)  
A 0 1 N 43/90 (2006.01)

## F I

A 0 1 N 47/02  
A 0 1 N 53/14  
A 0 1 N 43/90 1 0 4

## テーマコード (参考)

MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,N  
E,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,  
CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IQ,IR,IS,IT,JM,J  
O,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KR,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,M  
Z,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,  
TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

(74)代理人 100143823

弁理士 市川 英彦

(74)代理人 100183519

弁理士 櫻田 芳恵

(74)代理人 100196483

弁理士 川崎 洋祐

(74)代理人 100160749

弁理士 飯野 陽一

(74)代理人 100160255

弁理士 市川 祐輔

(74)代理人 100146318

弁理士 岩瀬 吉和

(74)代理人 100127812

弁理士 城山 康文

(72)発明者 カンチョ・グランデ, ヨランダ

ドイツ国、5 1 3 7 3・レーバークーゼン、クリスティアン - ヘス - シュトラーセ・7 9

(72)発明者 フスライン, マルティン

ドイツ国、4 0 2 2 5・デュッセルドルフ、ヴィツェルシュトラーセ・9

(72)発明者 イェシュケ, ペーター

ドイツ国、5 1 4 6 7・ベルギッシュ・グラットパハ、カルミュンテナー・シュトラーセ・4 4 ア  
ー

(72)発明者 ミュラー, シュテフェン

ドイツ国、4 5 4 7 2・ミュールハイム・アン・デア・ルール、ミューレンフェルト・1 0 6

(72)発明者 シュヴァルツ, ハンス - ゲオルク

ドイツ国、4 6 2 8 2・ドルステン、アウフ・デム・ペーアーエンカンブ・8 2 ベー

(72)発明者 テルザー, ヨアヒム

ドイツ国、4 2 1 1 5・ヴッパータール、クルンマッハーシュトラーセ・1 2 7

(72)発明者 ヴィンター, フィリップ

ドイツ国、5 1 3 8 1・レーバークーゼン、アウフ・デム・ボーンビュッヘル・1 0

(72)発明者 エピングハウス - キンチャー, ウルリッヒ

ドイツ国、4 4 2 8 7・ドルトムント、ヴィットプロイッカー・シュトラーセ・1 2 2

(72)発明者 レーゼル, ペーター

ドイツ国、5 1 3 7 1・レーバークーゼン、アム・ショッカー・5

(72)発明者 トゥルベルク, アンドレアス

ドイツ国、4 2 7 8 1・ハーン、ジンターシュトラーセ・8 6

(72)発明者 ハイスラー, アイリング

ドイツ国、4 0 5 9 3・デュッセルドルフ、フランツ・ヒツェ・シュトラーセ・5

(72)発明者 ベア, ロビン・マクシミリアン

ドイツ国、5 1 4 6 9・ベルギッシュ・グラートパハ、レフラーター・ヴェーク・8 7

---

(72)発明者 ダミジョナイティス, アルナス・ヨナス  
アメリカ合衆国、ノースカロライナ・27516、チャペル・ヒル、パークベリー・ベンド・ドライブ・19

Fターム(参考) 4C065 AA04 BB06 CC01 DD03 EE02 HH01 JJ01 KK06 LL01 PP03  
PP12 QQ04  
4H011 AC01 AC02 AC04 BB09 BB11 BB15