

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第3838659号  
(P3838659)

(45) 発行日 平成18年10月25日(2006.10.25)

(24) 登録日 平成18年8月11日(2006.8.11)

(51) Int. Cl. F I  
**CO7D 231/06 (2006.01)** CO7D 231/06  
**AO1N 43/40 (2006.01)** AO1N 43/40 1 O 1  
**CO7D 231/20 (2006.01)** CO7D 231/20

請求項の数 12 (全 65 頁)

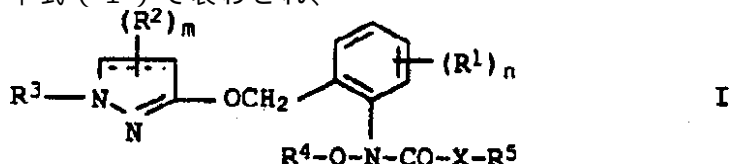
<p>(21) 出願番号 特願平8-503648                  (86) (22) 出願日 平成7年6月21日(1995.6.21)                  (65) 公表番号 特表平10-504810                  (43) 公表日 平成10年5月12日(1998.5.12)                  (86) 国際出願番号 PCT/EP1995/002396                  (87) 国際公開番号 W01996/001256                  (87) 国際公開日 平成8年1月18日(1996.1.18)                  審査請求日 平成14年6月10日(2002.6.10)                  (31) 優先権主張番号 P4423612.3                  (32) 優先日 平成6年7月6日(1994.7.6)                  (33) 優先権主張国 ドイツ(DE)</p>	<p>(73) 特許権者                  ビーエーエスエフ アクチェンゲゼルシャ                  フト                  ドイツ国、D-67056、ルートヴィッ                  ヒスハーフェン                  (74) 代理人                  弁理士 江藤 聡明                  (72) 発明者                  ミュラー、ベルント                  ドイツ国、D-67227、フランケンタ                  ール、ジャン-ガンス-シュトラ-セ、2                  1                  (72) 発明者                  ケーニツヒ、ハルトマン                  ドイツ国、D-69115、ハイデルベル                  ク、ブルーメンシュトラ-セ、16</p> <p style="text-align: right;">最終頁に続く</p>
---	---

(54) 【発明の名称】 2 - [ (ジヒドロ) ピラゾリル-3' -オキシメチレン] アニリド、その製造方法および用途

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項1】

下式(I)で表わされ、



かつ、

が単一もしくは二重結合を意味し、

nが0または1を意味し、

mが0または1を意味し、

Xが、直接結合、OまたはNR<sup>a</sup>を意味し、

このR<sup>a</sup>が水素を意味し、

R<sup>1</sup>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>ハロゲンアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>ハロゲンアルコキシを意味し、

R<sup>2</sup>が、ニトロ、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロゲンアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ、またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルを意味し、

R<sup>3</sup>が、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、または、

フェニル、ベンジル、またはナフチル（これらの基が、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ -  $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニル、および、フェニル、フェノキシ、フェニル -  $C_1 - C_4$ アルコキシ（これらのフェニル環自体が、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル、または $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルを持っていてもよい）、を有していてもよく、および/または、基  $CR = NOR$ （ $R$ は水素または $C_1 - C_4$ アルキルを、 $R$ は $C_1 - C_6$ アルキルを意味する）を有していてもよく、および/または、オキシ -  $C_1 - C_3$ アルコキシブリッジまたはオキシ -  $C_1 - C_3$ ハロゲンアルコキシブリッジで結合されているフェニル環の隣接2炭素原子を有していてもよい）、または、

ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、またはピリダジニル（これらの基は、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルまたは $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルを持っていてもよい）、を意味し、

$R^4$ が水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、または $C_1 - C_2$ アルコキシカルボニルを意味し、

$R^5$ が $C_1 - C_2$ -アルキルを意味し、また $X$ が $NR^a$ を意味する場合には、さらに水素を意味する場合の2 - [(ジヒドロ)ピラゾリル - 3 - オキシメチレン]アニリド。

【請求項2】

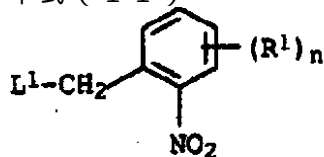
$R^3$ が、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、または、フェニル、ベンジル、またはナフチル（これらの基が、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個の $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシを有していてもよく、および/または、オキシ -  $C_1 - C_3$ アルコキシブリッジまたはオキシ -  $C_1 - C_3$ ハロゲンアルコキシブリッジで結合されているフェニル環の隣接2炭素原子を有していてもよい）、または、

ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、またはピリダジニル（これらの基が、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個の $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキルを持っていてもよい）、を意味することを特徴とする、請求項1に記載の - [(ジヒドロ)ピラゾリル - 3 - オキシメチレン]アニリド。

【請求項3】

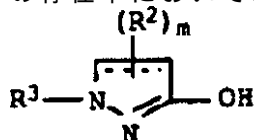
請求項1または2の式(I)において、 $R^4$ が水素を意味し、 $X$ が直接結合または酸素を意味する場合の化合物を製造するために、

下式(II)



II

で表わされ、かつ $L^1$ が求核的に互換可能の基を意味する場合のベンジル誘導体を、塩基の存在下において、下式(III)



III

で表わされる3 - ヒドロキシ(ジヒドロ)ピラゾールと反応させて、下式(IV)

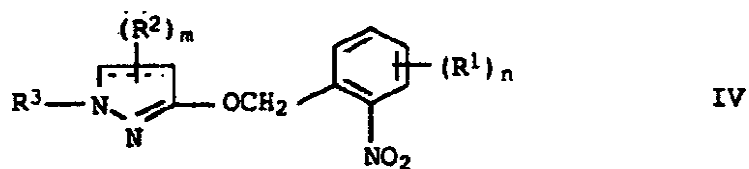
10

20

30

40

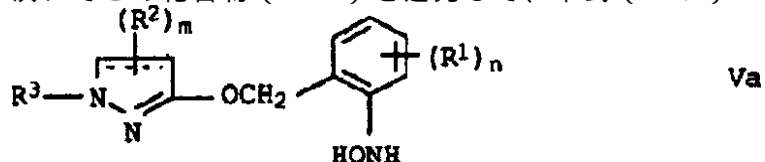
50



で表わされる、対応する 2 - [ (ジヒドロ)ピラゾリル - 3 - オキシメチレン ] ニトロ

ベンゼンに転化し、

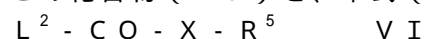
次いでこの化合物 (IV) を還元して、下式 (Va)



10

で表わされる N - ヒドロキシアニリンに転化し、

この化合物 (Va) を、下式 (VI)



( $L^2$  はハロゲンを、X が直接結合または酸素を意味する) で表わされるカルボニル化合物と反応させて、目的化合物 (I) に転化することを特徴とする方法。

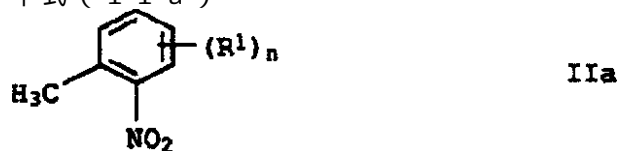
【請求項 4】

請求項 1 または 2 の式 (I) において、 $R^4$  が水素を意味せず、X が直接結合または酸素

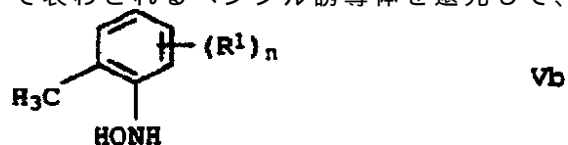
20

を意味する場合の化合物を製造するために、

下式 (IIa)



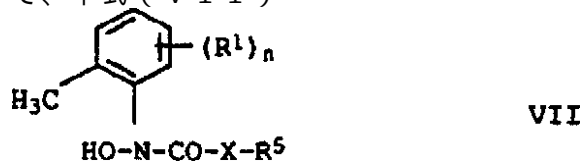
で表わされるベンジル誘導体を還元して、下式 (Vb)



30

で表わされる、対応するヒドロキシアニリンに転化し、

この化合物 (Vb) を、請求項 3 の式 (VI) で表わされるカルボニル化合物と反応させて、下式 (VII)



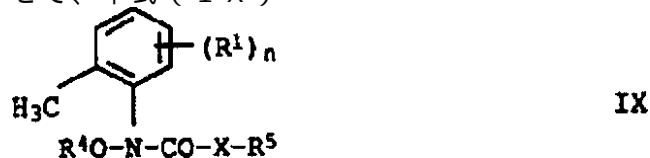
で表わされる、対応するアニリドに転化し、

次いで、この化合物 (VII) を、下式 (VIII)



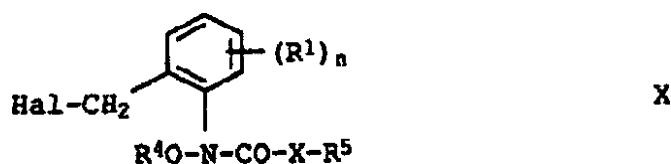
40

( $L^3$  は求核的互換性基を意味し、 $R^4$  は水素を意味しない) で表わされる化合物と反応させて、下式 (IX)



で表わされるアミドに転化し、

次いで、この化合物 (IX) を、下式 (X)



(Hal はハロゲン原子を意味する) で表わされる、対応するベンジルハロゲニドに転化し、

この化合物 (X) を、塩基の存在下において、請求項 3 の式 (III) で表わされる 3 - ヒドロキシ (ジヒドロ) ピラゾールと反応させて、目的化合物 (I) に転化することを特徴とする方法。

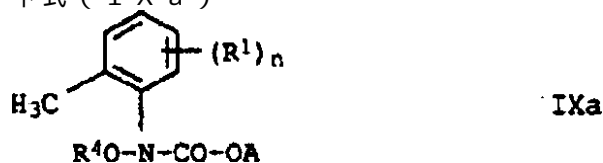
【請求項 5】

請求項 1 または 2 の式 (I) において、R<sup>4</sup> が水素を意味せず、X が直接結合または酸素を意味する場合の化合物を製造するために、R<sup>4</sup> が水素を意味する場合の対応する化合物 (I) を、請求項 4 の式 (VII) で表わされる化合物と反応させることを特徴とする方法。

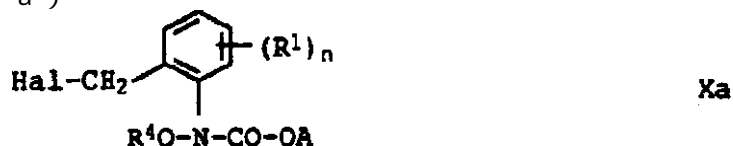
【請求項 6】

請求項 1 または 2 の式 (I) において、X が NR<sup>a</sup> を意味する場合の化合物を製造するために、

下式 (IXa)

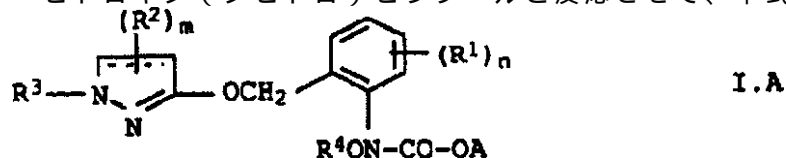


(A はアルキルまたはフェニルを意味する) で表わされるベンジリアニリドを、下式 (Xa)



(Hal はハロゲン原子を意味する) で表わされる、対応するベンジルハロゲニドに転化し、

この化合物 (Xa) を、塩基の存在下において、請求項 3 の式 (III) で表わされる 3 - ヒドロキシ (ジヒドロ) ピラゾールと反応させて、下式 (I.A)



で表わされる化合物に転化し、

次いでこの化合物 (I.A) を、下式 (XIa) または (XIb)

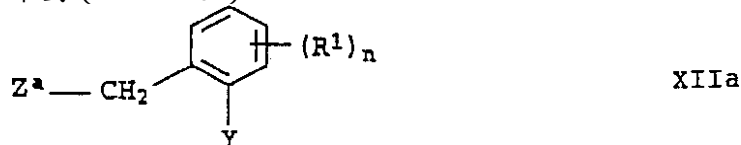


(XIa)                      (XIb)

で表わされるアミンと反応させて、目的化合物 (I) に転化することを特徴とする方法。

【請求項 7】

下式 (XIIa)



で表わされ、かつ

n が 0 または 1 を意味し、

R<sup>1</sup> が、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>ハロゲンアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ

10

20

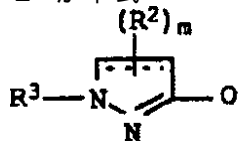
30

40

50

、または  $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシを意味し、  
 $Y$ が  $NO_2$ 、 $NHOH$ または  $NHOR^4$ を意味し、  
 この  $R^4$ が  $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、または  $C_1 - C_2$ アルコシカルボニルを意味し、

$Z^a$ が下式



$Z^a$

で表わされる基を意味し、

$m$ が0または1を意味し、

$R^2$ がニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、または  $C_1 - C_4$ アルコシカルボニルを意味し、

$R^3$ が、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、または、

フェニル、ベンジル、またはナフチル（これらの基が、部分的もしくは全体的にハロゲン

化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ アルキル

、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ -  $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカル

ボニル、 $C_1 - C_4$ アルコシカルボニル、および、フェニル、フェノキシ、フェニル -  $C_1 - C_4$ アルコキシ（これらのフェニル環自体が、部分的もしくは全体的にハロゲン化され

ていてもよく、かつ/もしくは、1から3個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニル、または  $C_1 - C_4$ アルコシカルボニルを

持っていてよい）、を有していてもよく、および/または、基  $CR = NOR$ （ $R$ は水素または  $C_1 - C_4$ アルキルを、 $R$ は  $C_1 - C_6$ アルキルを意味する）を有していても

よく、および/または、オキシ -  $C_1 - C_3$ アルコキシブリッジまたはオキシ -  $C_1 - C_3$ ハロゲンアルコキシブリッジで結合されているフェニル環の隣接2炭素原子を有していても

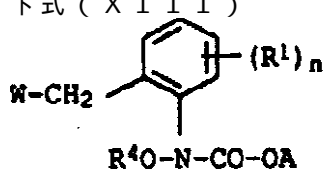
よい）、または、

ピリジル、ピリミジニル、ピラジニル、またはピリダジニル（これらの基が、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは、1から3個のシアノ、ニト

ロ、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキルカルボニルまたは  $C_1 - C_4$ アルコシカルボニルを持っていてよい）、を意味することを特徴とする中間生成物

【請求項8】  
 固体状もしくは液体状の担体と請求項1または2の式(I)で表わされる化合物を含有する虫類を含む有害動物および有害菌類を防除するのに適する剤。

【請求項9】  
 下式(XIII)の



XIII

で表わされ、かつ  $R^1$ 、 $R^4$ および  $n$ が、請求項1に示される意味を持っており、 $W$ が請求項7に示す意味を有する  $Z^a$ で表わされる基を、 $A$ がフェニルを意味する中間生成物。

【請求項10】  
 請求項1または2の化合物(I)を、有害動物および有害菌類を防除するのに適する剤の製造のために使用する方法。

【請求項11】  
 菌類あるいは菌類繁殖前に保護されるべき各種材料、植物、土壌または種子を、請求項1または2の式(I)で表わされる化合物の有効量で処理することを特徴とする有害菌類の

10

20

30

40

50

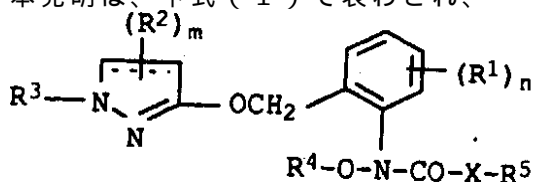
防除方法。

【請求項 1 2】

有害動物あるいは有害動物繁殖前に保護されるべき各種材料、植物、土壌または種子を、請求項 1 または 2 の式 (I) で表わされる化合物の有効量で処理することを特徴とする有害動物の防除方法。

【発明の詳細な説明】

本発明は、下式 (I) で表わされ、



I

10

かつ、

が単一結合もしくは二重結合を意味し、

n が 0、1、2、3 または 4 を意味し、これが 2 以上である場合には、複数の上記 R<sup>1</sup> は互に異なる意味を持っていてもよく、

m が 0、1 または 2 を意味し、これが 2 以上である場合には、複数の上記 R<sup>2</sup> は互に異なる意味を持っていてもよく、

X が、直接結合、O または N R<sup>a</sup> を意味し、

この R<sup>a</sup> が、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキルまたはシクロアルケニルを意味し、

R<sup>1</sup> が、ニトロ、シアノ、ハロゲン、置換されていてもよい、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシを、

また n が 2 である場合には、さらに、隣接する 2 個の環員原子に結合されており、かつ 3 もしくは 4 個の炭素原子を、あるいは 1 から 3 個の炭素原子と、1 もしくは 2 個の窒素、酸素および / または硫黄原子から成る 3 から 4 個の構成員を持っており、置換されていてもよいブリッジを意味し、またこのブリッジが、結合されている環と共に、部分的不飽和基もしくは芳香族基を形成してもよく、

R<sup>2</sup> が、ニトロ、シアノ、ハロゲン、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ハロゲンアルキル、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルキルチオまたは C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> アルコキシカルボニルを意味し、

R<sup>3</sup> が、置換されていてもよい、アルキル、アルケニルまたはアルキニル、さらに環員として炭素原子のほかにヘテロ原子として 3 個までの酸素、硫黄、窒素原子を持っていることができる、置換されていてもよい、飽和または単一もしくは二重不飽和環、または炭素原子のほかに、環員として 4 個までの窒素原子、または 1 もしくは 2 個の窒素原子と 1 個の酸素もしくは硫黄原子、または 1 個の酸素もしくは硫黄原子を持っていることができる、単一もしくは二重環の、置換されていてもよい芳香族環を意味し、

R<sup>4</sup> が水素、置換されていてもよい、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルキルカルボニルを意味し、

R<sup>5</sup> がアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、または X が N R<sup>a</sup> を意味する場合、さらに水素を意味する場合の 2 - [(ジヒドロ)ピラゾリル - 3 - オキシメチレン] アニリドに関する。

また本発明はさらに、これらの化合物を製造するための方法ならびに中間生成物、および動物有害微小生物ならびに有害菌を防除するための、上記化合物を含有するための剤ならびにこれら化合物の用途に関する。

PCT 特願公開 WO 93 / 15046 号公報から、上述防除に有効な 2 - [ピラゾリル - 4 - オキシメチレン] アニリドは公知である。

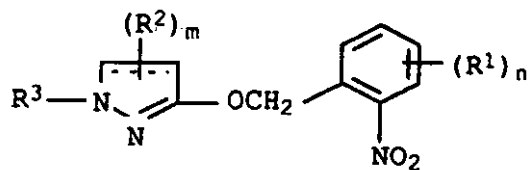
本発明はさらに改善された防除効果を有するこの種化合物を見出し、提供することをその課題とする。

50

しかるに、本明細書冒頭に定義された新規化合物(Ⅰ)が、本発明者らにより見出された。さらにこれら化合物を製造するための方法ならびに中間生成物、およびこれらを含む、上記防除のための剤、およびこの目的のためのこれら化合物の用途も本発明者らにより見出された。

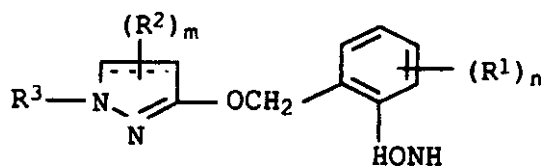
本発明化合物(Ⅰ)は、種々の方法により得られる。

式中、 $R^4$ が水素を、 $X$ が直接結合または酸素原子を意味する場合の化合物(Ⅰ)は、例えば、下式(Ⅱ)のベンジル誘導体を、塩基の存在下に、下式(Ⅲ)の3-[ヒドロキシ(ジヒドロ)-ピラゾリル-3-オキシメチレン]ニトロベンゼンと反応させて、下式(Ⅳ)の化合物を得、次いでこの化合物(Ⅳ)を還元して、下式(Va)のN-ヒドロキシルアニリンに転化し、この化合物(Va)を下式(VI)のカルボニル化合物との反応により、目的化合物(Ⅰ)が得られる。



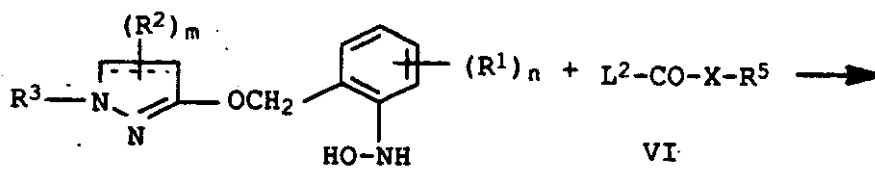
10

IV



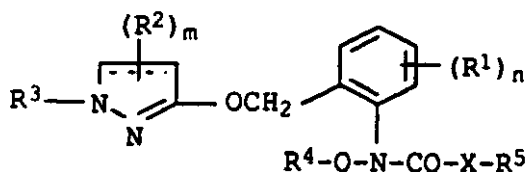
20

Va



30

Va

I (R<sup>4</sup> = H)

40

上記構造式 (II) 中の L<sup>1</sup> および式 (VI) 中の L<sup>2</sup> は、それぞれ求核的互換性基、ことにハロゲン (例えば塩素、臭素、沃素)、アルキルスルホナートないしアリールスルホナート (例えばメチルスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、フェニルスルホナート、4-メチルフェニルスルホナート) である。

化合物 (II) および (III) のエーテル化は、慣用のように 0 から 80、ことに 20 から 60 の温度で行なわれる。

このための溶媒としては、トルエン、o-、m-、p-キシレンのような芳香族炭化水素、メチレンクロリド、クロロホルム、クロロベンゼンのようなハロゲン化炭化水素、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、t-ブチルメチルエーテル、ジオキサン、アニソール、テトラヒドロフランのようなエーテル類、アセトニトリル、プロピオニトリルのよ

50



うなニトリル類、メタノール、エタノール、n-プロパノール、i-プロパノール、n-ブタノール、t-ブタノールのようなアルコール類、アセトン、メチルエチルケトンのようなケトン類、ならびにジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、1,3-ジメチル-イミダゾリジノン-2、1,2-ジメチルテトラヒドロ-2(1H)-ピリミジン、ことにメチレンクロリド、アセトン、トルエン、メチル-t-ブチルエーテルおよびジメチルホルムアミドが好ましい。これらの混合溶媒も使用され得る。

塩基としては、アルキル金属およびアルキル土類金属の水酸化物（例えばリチウムヒドロキシド、カリウムヒドロキシド、カルシウムヒドロキシド）、アルカリ金属およびアルキル土類金属の酸化物（例えばリチウムオキシド、ナトリウムオキシド、カルシウムオキシド、マグネシウムオキシド）、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水素化物（例えばリチウムヒドريد、ナトリウムヒドريد、カリウムヒドريد、カルシウムヒドريد）、アルカリ金属アミド（例えばリチウムアミド、ナトリウムアミド、カリウムアミド）、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の炭酸塩（例えばリチウムカルボナート、カルシウムカルボナート）、ならびにアルカリ金属の炭酸水素塩（例えば炭酸水素カルボナート）のような無機化合物、金属有機化合物、ことにアルカリ金属アルキル（例えばメチルリチウム、ブチルリチウム、フェニルリチウム）、アルカリ金属ハロゲン化物（例えばメチルマグネシウムクロリド）、アルカリ金属およびアルカリ土類金属のアルコラート（例えばナトリウムメタノラート、ナトリウムエタノラート、カリウムエタノラート、カリウム-t-ブタノラート）、ジメトキシマグネシウム、さらに有機塩基、例えばトリメチルアミン、トリエチルアミン、トリスプロピルエチルアミン、N-メチルピペリジン、ピリジン、コリジン、ルチジン、4-ジメチルアミノピリジンのような置換ピリジンならびに二環式アミンなどが挙げられる。

ことに、ナトリウムヒドロキシド、カリウムカルボナート、カリウム-t-ブタノラートが好ましい。

塩基は、一般的に等モル量、過剰量で、場合により溶媒として使用される。

また、反応のための触媒量のクラウンエーテル（例えば18-クラウン-6または15-クラウン-5）を使用するのが有利である。

反応は、またアルカリ金属またはアルカリ土類金属またはこれらの炭酸塩の水溶液と、有機相（例えば芳香族炭化水素、ハロゲン化炭化水素）とから成る2相混合物中において行なわれ得る。相転移触媒として、例えばアンモニウムハロゲン化物およびそのテトラフルオロボラート（例えばベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムクロリド、ヘキサデシルトリメチルアンモニウムプロミド、テトラブチルアンモニウムテトラフルオロボラート）ならびにホスホニウムハロゲニド（例えばテトラブチルホスホニウムクロリド、テトラフェニルホスホニウムプロミド）が挙げられる。

反応のためには、まず3-ヒドロキシ(ジヒドロ)ピラゾールを、塩基と反応させて対応するヒドロキシラートとし、次いでベンジル誘導体と反応させるのが好ましい。

化合物(I)を製造するための出発物質(II)は、ヨーロッパ特願公開513580号公報から公知であるか、あるいはこれに引用されている文献(Synthesis 1991、181、Anal. Chem. Acta 185、295(1986)、ヨーロッパ特願公開336567号公報)の方法で製造され得る。

3-ヒドロキシピラゾール(IIIa)および3-ヒドロキシジヒドロピラゾール(IIIb)も、同様に文献公知であるか、これらに記載されている方法により製造され得る[(IIIa)については、J. Heterocycl. Chem. 30、49(1993)、Chem. Ber. 107、1318(1974)、Chem. Pharm. Bull. 19、1389(1971)、Tetrahedron Lett. 11、875(1970)、Chem. Heterocycl. Comp. 5、527(1969)、Chem. Ber. 102、3260(1969)、Chem. Ber. 109、261(1976)、J. Org. Chem. 31、1538(1966)、Tetrahedron 43、607(1987)、(IIIb)については、J. Med. Chem. 19

10

20

30

40

50

、715(1967)参照]。

3-ヒドロピラゾール(III a)は、西独特願415484.4明細書中に記載されている方法によりことに有利に得られる。

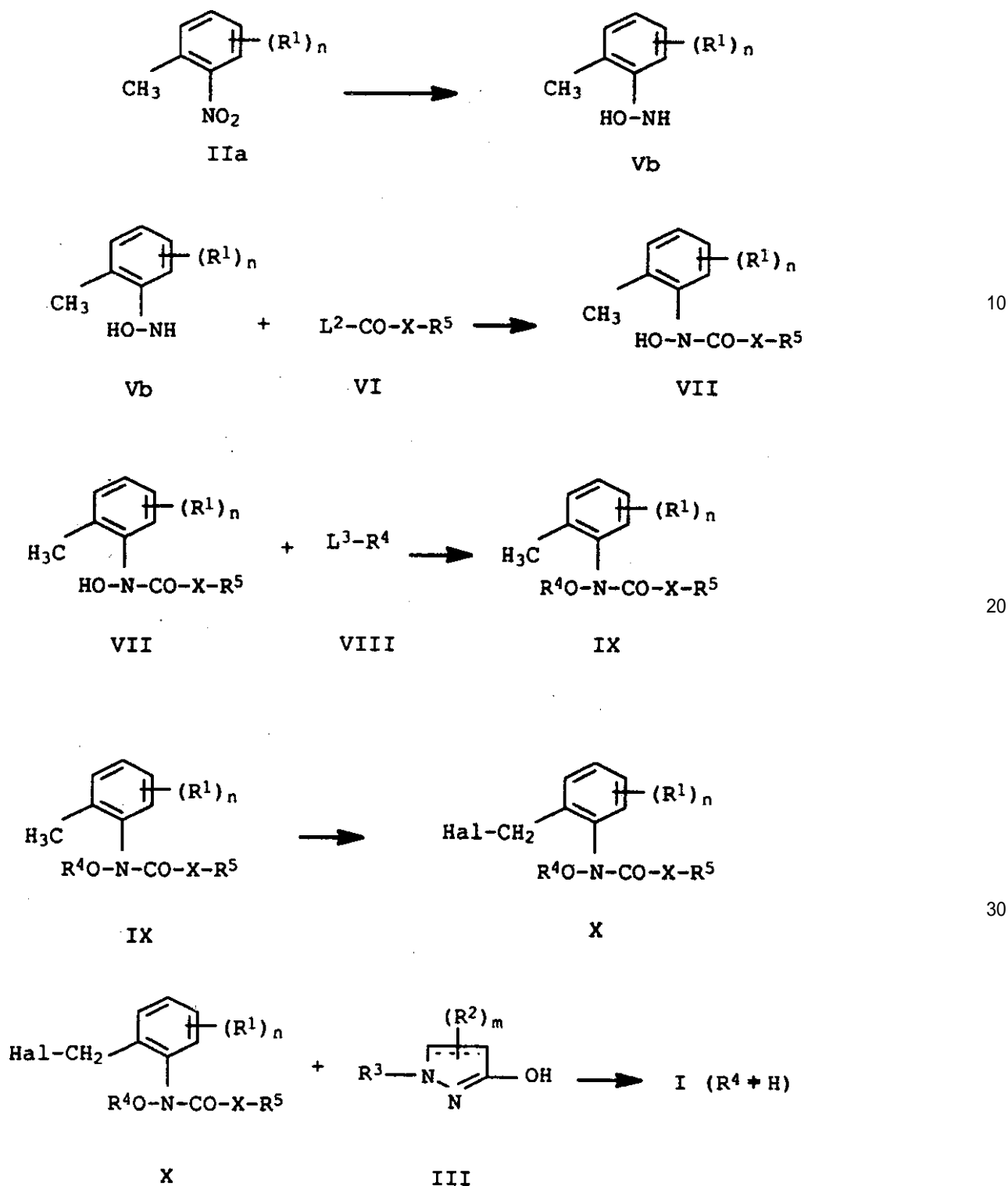
ニトロ化合物(IV)の還元による対応N-ヒドロキシアニリン(V a)への転化は、文献公知の方法と類似する方法により例えば亜鉛のような金属を使用して行なわれ[Ann. Chem. 316, 278(1901)]、または水素を使用して行なわれる(ヨーロッパ特願公開85890号公報参照)。

N-ヒドロキシアニリン(V a)と、カルボニル化合物(VI)との反応は、上述した化合物(II)と、3-ヒドロキシ(ジヒドロ)ピラゾール(III)との反応条件と同様にアルカリ性条件下に行なわれる。反応は、ことに-10 から30 の温度で行なわれるのが好ましい。溶媒としては、メチレンクロリド、トルエン、t-ブチルメチルエーテル、酢酸エチルエステルを使用するのが好ましい。好ましい塩基は、炭酸水素ナトリウム、カリウムカルボナート、ナトリウムヒドロキシド水溶液である。

また式(I)のXが直接結合または酸素を意味する場合の化合物は、例えば式(III a)のベンジル誘導体を、まず式(V b)のヒドロキシアニリンに還元、転化し、この化合物(V b)を、式(VI)のカルボニル化合物と反応させて、対応する式(VII)のアニリドとし、次いでこの化合物(VII)を化合物(VIII)と反応させて、式(IX)のアミドに転化し、次いでこの化合物(IX)を、対応するベンジルハロゲニドに転化し、この化合物(X)を、塩基の存在下に、3-ヒドロキシ(ヒドロ)ピラゾール(III)と反応させることにより得られる。

10

20



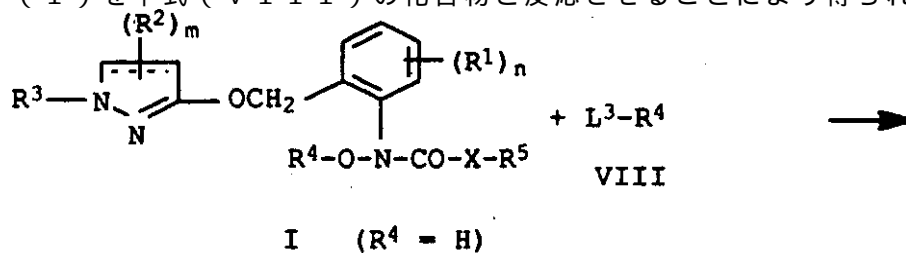
上記構造式 (X) において Hal はハロゲン、ことに塩素または臭素を意味し、式 (V I I I) の  $\text{L}^3$  は求核互換性基、ことにハロゲン (例えば塩素、臭素、沃素) またはアルキルスルホナート、アリールスルホナート (例えばメチルスルホナート、トリフルオロメチルスルホナート、フェニルスルホナート、4 - メチルフェニルスルホナート) を意味し、 $\text{R}^4$  は水素を意味しない。 40

反応は前述したのと同様に行なわれる。

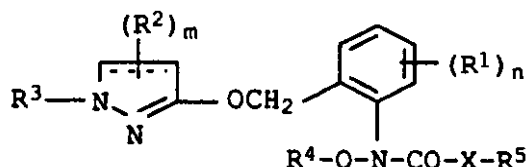
化合物 (IX) のハロゲン化は、ハロゲン化剤として、例えば N - クロロスクシンイミド、N - プロモスクシンイミド、元素ハロゲン (例えば塩素、臭素)、チオニルクロリド、スルフリルクロリド、三塩化燐もしくは四塩化燐、その他類似の化合物が使用される。さらに慣用のラジカル開始剤 (例えばアゾビスイソブチロニトリルを使用し、または、反応を紫外線照射下に行なう。ハロゲン化は、それ自体公知の態様で、慣用の有機希釈剤中に 50

おいて行なわれる。

$R^4$ が水素を意味しない場合の化合物(I)は、また、 $R^4$ が水素を意味する場合の化合物(I)を下式(VIII)の化合物と反応させることにより得られる。



10



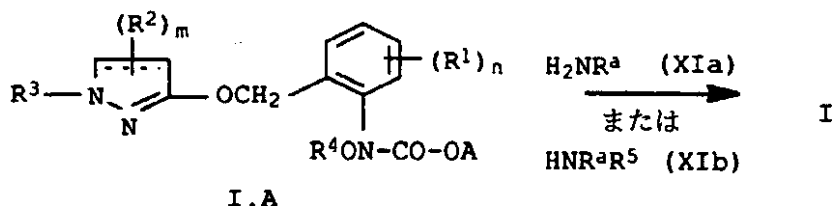
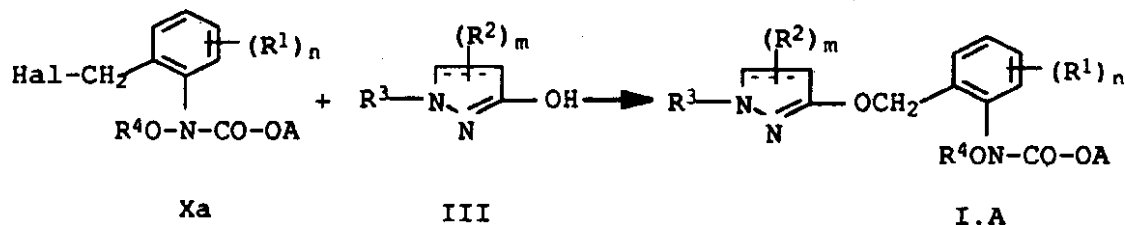
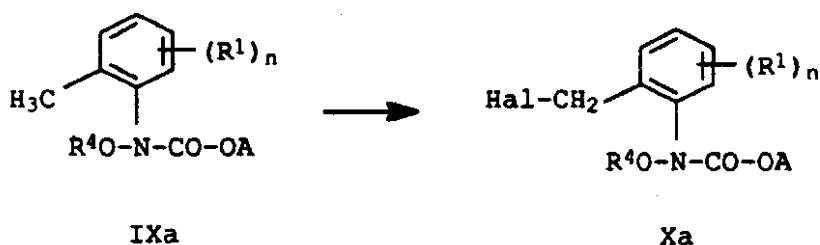
この反応は、0 から 50 の温度で、塩基の存在下、不活性有機溶媒中において、慣用の態様で行なわれる。

20

この塩基としては、ことに炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化ナトリウムおよび水酸化ナトリウム水溶液が使用され、溶媒としては、ことにアセトン、ジメチルホルムアミド、トルエン、t-ブチルメチルエーテル、酢酸エチルエステル、メタノールが使用される。

式Xが $NR^a$ を意味する場合の化合物(I)は、式(I X a)のベンジルアニリドを式(X a)の対応するベンジルハロゲニドに転化し、この化合物(X a)を、塩基の存在下に、式(III)の3-ヒドロキシ(ジヒドロ)ピラゾールと反応させてIAの化合物に転化し、次いでこの化合物(IA)を式(X I)の1級もしくは2級アミンと反応させることにより得られる。

30



上記式 (V I I a) の A は、アルキル (ことに C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> アルキル) またはフェニルを、式 (V I I I a) の H a l はハロゲン (ことに塩素、臭素) を意味する。

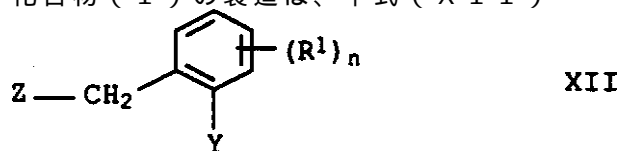
(I X a) から (X a) へ、(X a) から (I a) への反応は、前述した反応条件下で行なわれる。

化合物 (I A) と式 (X I a) ないし (X I b) の 1 級ないし 2 級アミンとの反応は、0 から 100 の温度で不活性の溶媒ないし混合溶媒中に行なわれる。

溶媒としては、ことに水、t-ブチルメチルエーテル、トルエンまたはこれらの混合溶媒が好ましい。反応材料の溶解性を改善するために、以下の溶媒 (補助溶媒として)、すなわち、テトラヒドロフラン、メタノール、ジメチルホルムアミド、エチレングリコールエーテルを追加的に使用することができる。

アミン (X I a) ないし (X I b) は、化合物 (X) に対して 100% までの過剰量で使用され、または溶媒として使用される。収率の観点から、反応は加圧下に行なうのが好ましい。

化合物 (I) の製造は、下式 (X I I)



で表わされ、かつ

n が 0、1、2、3 または 4 を意味し、(n が 2 以上であるとき、複数の R<sup>1</sup> は互に異なる意味を持っていてもよい)、

R<sup>1</sup> がニトロ、シアノ、ハロゲン、置換されていてもよい、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アルケニルオキシ、アルキニルオキシ、さらに n が 2 である場合、隣接する 2 個の環員に結合されており、かつ 3 から 4 個の炭素原子、1 から 3 個の炭素原子と 1 もしくは 2 個の窒素、酸素および / または硫黄原子から成る 3 から 4 の構成員を有する、置換されていてもよいブリッジを意味し、またこのブリッジが結合されている環と共に部分的不飽和基もしくは芳香族基を構成してもよく、

Y が NO<sub>2</sub>、NHOH または NHOR<sup>4</sup> を意味し、

10

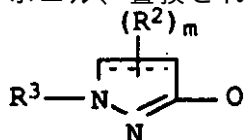
20

30

40

50

$R^4$ が置換されていてもよい、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アルキルカルボニルまたはアルコキシカルボニルを意味し、  
Zが水素、ヒドロキシ、メルカプト、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ アルキルスルホニル、置換されていてもよいアリールスルホニルまたは基( $Z^a$ )を意味し、

 $Z^a$ 

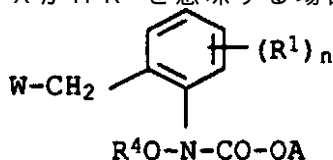
mが0、1または2を意味し(mが2の場合、2個の $R^2$ は互に異なる意味を持っていてもよい)、

$R^2$ がニトロ、シアノ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルキルチオまたは $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルを意味し、  
 $R^3$ が置換されていてもよい、アルキル、アルケニルまたはアルキニル、さらに炭素原子のほかに環員として3個以下のヘテロ原子、すなわち酸素、硫黄、窒素原子を持っていてもよい、場合により置換されている、飽和または単一もしくは二重不飽和環、または炭素原子のほかに、4個までの窒素原子、または1もしくは2個の窒素原子と、1個の酸素もしくは硫黄原子または1個の酸素もしくは硫黄原子を環員として持っていてもよい、場合により置換されている単環もしくは2環芳香族基を意味する場合の中間生成物を経由して行なわれる。

ことに、Yが $NHOH$ 、Zが基 $Z^a$ を意味する場合の中間生成物(XII)を経由するのが好ましい。

さらに、Yが $NO_2$ を、Zが基 $Z^a$ を意味するする場合の中間生成物(IX)を経由するの  
も有利である。

Xが $HR^a$ を意味する場合の化合物(I)を製造する場合、下式(XIII)



XIII

で表わされ、かつ $R^1$ および $R^4$ ならびにnが冒頭に定義した意味を有し、Wが水素、ハロゲンまたは基 $Z^a$ を、Aがアルキルまたはフェニルを意味する場合の中間生成物が好ましい。

Wが水素、塩素、臭素または基 $Z^a$ を意味する中間生成物(XIII)がことに好ましく、またAが $C_1 - C_6$ アルキルを意味する中間生成物(XIII)

Aがフェニルを意味する場合の中間生成物(XIII)がことに好ましい。

同様に $R^4$ が水素、メチルまたはエチルを意味する中間生成物(XIII)が好ましい。

さらにnが零である場合の中間生成物(XIII)が、ことに好ましい。

従って、nが零を、Wが水素、塩素、臭素または基 $Z^a$ を、 $R^4$ が水素、メチルまたはエチルを、Aがフェニルを意味する場合の中間生成物(XIII)が極めて好ましい。

化合物(I)は酸中心または塩基中心を有し、これに対応する酸付加生成物もしくは塩基付加生成物または塩を形成する。

酸付加生成物のための酸は、ことに鉱酸(例えば塩化水素酸、臭化水素酸のようなハロゲン化水素酸、磷酸、硫酸、硝酸)、有機酸(例えば蟻酸、酢酸、オキサリ酸、マロン酸、乳酸、りんご酸、こはく酸、酒石酸、くえん酸、サリチル酸、p-トルエンスルホン酸、ドデシルベンゼンスルホン酸)、その他のプロトン酸化合物(例えばサッカリン)である。また塩基付加生成物のための塩基は、ことにアルカリ金属ないしアルカリ土類金属の酸化物、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素化物(例えばカリウムヒドロキシド、ナトリウムヒドロキシド、これらのカルボナート)またはアンモニウム化合物(例えばアンモニウムヒドロキシド)である。

上述した各構造式中の符号の定義に使用された各上位概念は、具体的にはそれぞれ下記の基を意味する。すなわち、

10

20

30

40

50

ハロゲンは、弗素、塩素、臭素および沃素を意味する。

アルキルは、炭素原子数 1 から 4 または 10 の、飽和、直鎖もしくは分岐炭化水素、例えばメチル、エチル、プロピル、1 - メチルエチル、ブチル、1 - メチルプロピル、2 - メチルプロピルおよび 1, 1 - ジメチルエチルを意味する。

ハロゲンアルキルチオは、炭素原子数 1 から 4 の直鎖もしくは分岐アルキル（上述）であって、その水素原子が部分的もしくは全体的に上述したようなハロゲン原子により置換されているアルキル、例えば  $C_1$  -  $C_2$  ハロゲンアルキル、ことにクロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ - 2 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチルおよびペンタフルオロエチルを意味する。

10

アルキルカルボニルは、ことに炭化水素数 1 から 10 の、直鎖もしくは分岐アルキル（上述）であって、カルボニル基（-CO-）で骨格に結合されている基を意味する。

アルコキシは、炭素原子数 1 から 4 の、直鎖もしくは分岐アルキル（上述）であって、酸素原子（-O-）で骨格に結合されている基を意味する。

アルコシカルボニルは、炭素原子数 1 から 4 の、直鎖もしくは分岐アルキル（上述）であって、カルボニル基（-CO-）で骨格に結合されている基を意味する。

アルキルチオは、炭素原子数 1 から 4 の、直鎖もしくは分岐アルキル（上述）であって、硫黄原子（-S-）で骨格に結合されている基を意味する。

20

置換されていてもよいアルキルは、ことに炭素原子 1 から 10 の、飽和、直鎖もしくは分岐炭化水素基であって、例えばメチル、エチル、プロピル、1 - メチルエチル、ブチル、1 - メチルプロピル、2 - メチルプロピル、1, 1 - ジメチルエチル、ペンチル、1 - メチルブチル、2 - メチルブチル、3 - メチルブチル、2, 2 - ジメチルプロピル、1 - エチルプロピル、ヘキシル、1, 1 - ジメチルプロピル、1, 2 - ジメチルプロピル、1 - メチルペンチル、2 - メチルペンチル、3 - メチルペンチル、4 - メチルペンチル、1, 1 - ジメチルブチル、1, 2 - ジメチルブチル、1, 3 - ジメチルブチル、2, 2 - ジメチルブチル、2, 3 - ジメチルブチル、3, 3 - ジメチルブチル、1 - エチルブチル、2 - エチルブチル、1, 1, 2 - トリメチルプロピル、1, 2, 2 - トリメチルプロピル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルおよび 1 - エチル - 2 - メチルプロピルのような  $C_1$  -  $C_6$  アルキルを意味する。

30

置換されていてもよいアルケニルは、炭素原子数 2 から 10 で、任意の位置に二重結合を有する、不飽和、直鎖もしくは分岐炭化水素基であって、例えばエテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、1 - メチルエテニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - メチル - 1 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、1 - ペンテニル、2 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1 - メチル - 1 - ブテニル、2 - メチル - 1 - ブテニル、3 - メチル - 1 - ブテニル、1 - メチル - 2 - ブテニル、2 - メチル - 2 - ブテニル、3 - メチル - 2 - ブテニル、1 - メチル - 3 - ブテニル、2 - メチル - 3 - ブテニル、3 - メチル - 3 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 1 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - プロペニル、1 - エチル - 2 - プロペニル、1 - ヘキセニル、2 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル、1 - メチル - 1 - ペンテニル、2 - メチル - 1 - ペンテニル、3 - メチル - 1 - ペンテニル、4 - メチル - 1 - ペンテニル、1 - メチル - 2 - ペンテニル、2 - メチル - 2 - ペンテニル、3 - メチル - 2 - ペンテニル、4 - メチル - 2 - ペンテニル、1 - メチル - 3 - ペンテニル、2 - メチル - 3 - ペンテニル、3 - メチル - 3 - ペンテニル、4 - メチル - 3 - ペンテニル、1 - メチル - 4 - ペンテニル、2 - メチル - 4 - ペンテニル、3 - メチル - 4 - ペンテニル、4 - メチル - 4 - ペンテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 2 - ブテニル、1

40

50

, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 1 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 1 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、3 - 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 - 2 - メチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 2 - メチル - 1 - プロペニルおよび 1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロペニルを意味する。

置換されていてもよいアルケニルオキシは、炭素原子数 3 から 10 の直鎖もしくは分岐アルケニル（上述）であって、酸素原子（-O）で骨格に結合されている基を意味する。

アルキニルは、炭素原子数 2 から 20 で、任意の位置に二重結合を有する直鎖もしくは分岐炭化水素基であって、例えばエチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、1 - ペンチニル、2 - ペンチニル、3 - ペンチニル、4 - ペンチニル、1 - メチル - 2 - ブチニル、1 - メチル - 3 - ブチニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、3 - メチル - 1 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロピニル、1 - エチル - 2 - プロピニル、1 - ヘキシニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニル、1 - メチル - 2 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ペンチニル、1 - メチル - 4 - ペンチニル、2 - メチル - 3 - ペンチニル、2 - メチル - 4 - ペンチニル、3 - メチル - 1 - ペンチニル、3 - メチル - 4 - ペンチニル、4 - メチル - 1 - ペンチニル、4 - メチル - 2 - ペンチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブチニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブチニル、1 - エチル - 2 - ブチニル、1 - エチル - 3 - ブチニル、2 - エチル - 3 - ブチニルおよび 1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロピニルを意味する。

置換されていてもよいアルキニルオキシは、炭素原子数 3 から 10 の、酸素原子で骨格に結合されている直鎖もしくは分岐アルキニル基を意味する。

置換されていてもよいシクロアルキルは、炭素原子数 5 から 10 で、環の任意の位置に二重結合を有する単環もしくは二環炭化水素基であって、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、ボルナニル、ノルボルナニル、ジシクロヘキシル、ビスシクロ[3.3.0]オクチル、ビスシクロ[3.2.1]オクチル、ビスシクロ[2.2.2]オクチル、ビスシクロ[3.3.1]ノニルのような、C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-（ビ）シクロアルキルを意味する。

置換されていてもよいシクロアルケニルは、炭素原子数 5 から 10 で、環の任意位置に二重結合を有する、単環もしくは二環の炭化水素基であって、例えばシクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘプテニル、ボルネニル、ノルボルネニル、ジシクロヘキセニルおよびビスシクロ[3.3.0]オクテニルのような C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-（ビ）シクロアルケニルを意味する。

3 もしくは 4 個の炭素原子、1 から 3 個の炭素原子と 1 もしくは 2 個の窒素、酸素および / または硫黄原子から成る 3 から 4 個の構成員を有し、隣接する 2 環員に結合されている、置換されていてもよく、また結合されている環と合体して部分的不飽和基または芳香族基を形成し得るブリッジと称するのは、結合されている環と共に例えばキノリニル、ベンゾフラニル、ナフチルを形成するブリッジを意味する。

炭素原子のほかに環員として、3 個までのヘテロ原子、すなわち酸素、硫黄、窒素原子を有する、置換されていてもよい、飽和または単一もしくは二重不飽和環と称するのは、例えばシクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロペンテニル - 2、シクロヘキセニル - 2 のような炭素環、例えば 2 - テトラヒドロフラニル、3 - テトラヒドロフラニル、2 - テトラヒドロチエニル、3 - テトラヒドロチエニル、2 - ピロリジニル、3 - ピロリジニル、3 - イソオキサゾリジニル、4 - イソオキサゾリジニル、5 - イソオキサゾリジニル、3 - イソチアゾリジニル、4 - イソチアゾリジニル、5 - イソチアゾリジ

10

20

30

40

50



ニル、3 - ピラゾリジニル、4 - ピラゾリジニル、5 - ピラゾリジニル、2 - オキサゾリジニル、4 - オキサゾリジニル、5 - オキサゾリジニル、2 - チアゾリジニル、4 - チアゾリジニル、5 - チアゾリジニル、2 - イミダゾリジニル、4 - イミダゾリジニル、1, 2, 4 - オキサジアゾリジニル - 3, 1, 2, 4 - オキサジアゾリジニル - 5, 1, 2, 4 - チアジアゾリジニル - 3, 1, 2, 4 - チアジアゾリジニル - 5, 1, 2, 4 - トリアゾリジニル - 3, 1, 3, 4 - オキサジアゾリジニル - 2, 1, 3, 4 - チアジアゾリジニル - 2, 1, 3, 4 - トリアゾリジニル - 2, 2, 3 - ジヒドロフリル - 2, 2, 3 - ジヒドロフリル - 3, 2, 4 - ジヒドロフリル - 2, 2, 4 - ジヒドロフリル - 3, 2, 3 - ジヒドロチエニル、2, 2, 3 - ジヒドロチエニル - 3, 2, 4 - ジヒドロチエニル - 2, 2, 4 - ジヒドロチエニル - 3, 2, 3 - ピロリニル - 2, 2, 3 - ピロリニル - 3, 2, 4 - ピロリニル - 2, 2, 4 - ピロリニル - 3, 2, 3 - イソオキサゾリニル - 3, 3, 4 - イソオキサゾリニル - 3, 4, 5 - イソオキサゾリニル - 3, 2, 3 - イソオキサゾリニル - 4, 3, 4 - イソオキサゾリニル - 4, 4, 5 - イソオキサゾリニル - 4, 2, 3 - イソオキサゾリニル - 5, 3, 4 - イソオキサゾリニル - 5, 4, 5 - イソオキサゾリニル - 5, 2, 3 - イソチアゾリニル - 3, 3, 4 - イソチアゾリニル - 3, 4, 5 - イソチアゾリニル - 3, 2, 3 - イソチアゾリニル - 4, 3, 4 - イソチアゾリニル - 4, 4, 5 - イソチアゾリニル - 4, 2, 3 - イソチアゾリニル - 5, 3, 4 - イソチアゾリニル - 5, 4, 5 - イソチアゾリニル - 5, 2, 3 - ジヒドロピラゾリル - 1, 2, 3 - ジヒドロピラゾリル - 2, 2, 3 - ジヒドロピラゾリル - 3, 2, 3 - ジヒドロピラゾリル - 4, 2, 3 - ジヒドロピラゾリル - 5, 3, 4 - ジヒドロピラゾリル - 1, 3, 4 - ジヒドロピラゾリル - 3, 3, 4 - ジヒドロピラゾリル - 4, 3, 4 - ジヒドロピラゾリル - 5, 4, 5 - ジヒドロピラゾリル - 1, 4, 5 - ジヒドロピラゾリル - 3, 4, 5 - ジヒドロピラゾリル - 4, 4, 5 - ジヒドロピラゾリル - 5, 2, 3 - ジヒドロオキサゾリル - 2, 2, 3 - ジヒドロオキサゾリル - 3, 2, 3 - ジヒドロオキサゾリル - 4, 2, 3 - ジヒドロオキサゾリル - 5, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 2, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 3, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 4, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 5, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 2, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 3, 3, 4 - ジヒドロオキサゾリル - 4, 2 - ピペリジニル、3 - ピペリジニル、4 - ピペリジニル、1, 3 - ジオキサニル - 5, 2 - テトラヒドロピラニル、4 - テトラヒドロピラニル、2 - テトラヒドロチエニル、3 - テトラヒドロチエニル、4 - テトラヒドロチエニル、2 - テトラヒドロピリミジニル、4 - テトラヒドロピリミジニル、5 - テトラヒドロピリミジニル、2 - テトラヒドロピラジニル、1, 3, 5 - テトラヒドロトリアジニル - 2 および 1, 2, 4 - テトラヒドロトリアジニル - 3, ことに 2 - テトラヒドロフラニル、2 - テトラヒドロチエニル、2 - ピロリジニル、3 - イソオキサゾリジニル、3 - イソチアゾリジニル、1, 3, 4 - オキサゾリジニル - 2, 2, 3 - ジヒドロチエニル - 2, 4, 5 - イソオキサゾリニル - 3, 3 - ピペリジニル、1, 3 - ジオキサニル - 5, 4 - ピペリジニル、2 - テトラヒドロピラニル、4 - テトラヒドロピラニルのような、3 個までの窒素原子および / または 1 個の酸素もしくは硫黄原子を持っている、5 から 6 員の飽和もしくは不飽和ヘテロ環を、

炭素原子のほかに、環員として 1 から 4 個の窒素原子、または 1 ないし 2 個の窒素原子と、1 個の酸素もしくは硫黄原子、または 1 個の酸素もしくは硫黄原子を持っていてもよく、置換されていてよい単環もしくは 2 環芳香族環基、例えばフェニル、ナフチル、ことにフェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチルのようなアリールおよびヘテロアリール、例えば 1 から 3 個の窒素原子および / または 1 個の酸素または硫黄原子を有する 5 員ヘテロ芳香族環であって、例えば 2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、1 - ピロリル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、1 - ピラゾリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、1 - イミダゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、1, 2, 4 - オキサ

ジアゾリル - 3、1, 2, 4 - オキサジアゾリル - 5、1, 2, 5 - トリアゾリル - 4、5 - テトラゾリル、1, 2, 3, 4 - チアトリアゾリル - 5 および 1, 2, 3, 4 - オキサトリアゾリル - 5、ことに 3 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、4 - オキサゾリル、4 - チアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル - 2 および 1, 3, 4 - チアジアゾリル - 2 を、さらに

ヘテロ原子として 1 から 4 個の窒素原子を有する 6 員芳香族環であって、例えば 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - プリミジニル、4 - プリミジニル、5 - プリミジニル、2 - ピラジニル 1, 3, 5 - トリアジニル - 2、1, 2, 4 - トリアジニル - 3、1, 2, 4, 5 - テトラジニル - 3、ことに 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、2 - プリミジニル、4 - プリミジニル、2 - ピリジニル および 4 - ピリダジニルを意味する。

10

アルキル、アルケニルおよびアルキニルに関して「置換されていてもよい」という表現は、これらの基が部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく（すなわち、これらの基の水素原子の一部もしくは全部が、前述したようなハロゲン原子、すなわち弗素、塩素、臭素、沃素、ことに塩素、臭素で置換されていてもよく）、かつ/もしくは 1 から 3 個、ことに以下の置換基、すなわち

$C_1 - C_6$  アルコキシ、 $C_1 - C_6$  ハロゲンアルコキシ、 $C_1 - C_6$  アルキルチオ、 $C_1 - C_6$  ハロゲンアルキルチオ、 $C_1 - C_6$  アルキルアミノ、ジ  $C_1 - C_6$  アルキルアミノ、 $C_2 - C_6$  アルケニルオキシ、 $C_2 - C_6$  アルキニルオキシ、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  シクロアルケニル、 $C_3 - C_6$  シクロアルケニルオキシ、さらに

20

炭素原子のほかに、環員として 1 から 4 個の窒素原子、または 1 から 2 個の窒素原子と 1 個の酸素もしくは硫黄原子、または 1 個の酸素もしくは硫黄原子を持っていてもよく、且つ問題となっている上記アルキル基などに直接的に、または酸素原子 (-O)、硫黄原子 (-S-) またはアミノ基 (-NR<sup>a</sup>-) を介して結合されている単環もしくは 2 環芳香族基（これら自体、さらに置換されていてもよい）、例えばフェニル、ナフチル、ことにフェニル、1 - ナフチル、2 - ナフチルのようなアリールおよびヘテロアリール、例えば 1 から 3 個の窒素原子および/または 1 個の酸素もしくは硫黄原子を持っている 5 員ヘテロ芳香族基、例えば 2 - フリル、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、1 - ピロリル、2 - ピロリル、3 - ピロリル、3 - イソオキサゾリル、4 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、3 - イソチアゾリル、4 - イソチアゾリル、5 - イソチアゾリル、1 - ピラゾリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、2 - オキサゾリル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チアゾリル、1 - イミダゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル - 3、1, 2, 4 - オキサジアゾリル - 5、1, 2, 4 - チアジアゾリル - 3、1, 2, 4 - チアジアゾリル - 5、1, 2, 5 - トリアゾリル - 3、1, 2, 3 - トリアゾリル - 4、1, 2, 3 - トリアゾリル - 5、1, 2, 3 - トリアゾリル - 4、5 - テトラゾリル、1, 2, 3, 4 - チアトリアゾリル - 5 および 1, 2, 3, 4 - オキサトリアゾリル - 5、ことに 3 - イソオキサゾリル、5 - イソオキサゾリル、4 - オキサゾリル、4 - チアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル - 2、1, 3, 4 - チアジアゾリル - 2 を、さらに

30

40

ヘテロ原子として 1 から 4 個の窒素原子を有する 6 員環、例えば 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - プリミジニル、4 - プリミジニル、5 - プリミジニル、2 - ピラジニル、1, 3, 5 - トリアジニル - 2、1, 2, 4 - トリアジニル - 3、1, 2, 4, 5 - テトラジニル - 3、ことに 2 - ピリジニル、3 - ピリジニル、4 - ピリジニル、2 - プリミジニル、4 - プリミジニル、2 - ピラジニル、4 - ピリダジニルを意味する。

また、環式基（飽和、不飽和または芳香族）に関して「置換されていてもよい」と称するのは、これらの基が部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく（すなわち、これらの基の水素原子の一部もしくは全部が、前述したようなハロゲン原子、すなわち弗素、塩素、臭素、沃素、ことに塩素、臭素で置換されていてもよく）、かつ/もしくは 1 か

50

ら3個の以下の置換基を持っていてもよいことを意味する。

この置換基は、まずそれ自体が部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよい(すなわち、その水素原子が弗素、塩素、臭素、沃素のようなハロゲン原子、ことに弗素、塩素により置換されていてもよい)単環もしくは2環の芳香族もしくはヘテロ芳香族環基である。

この置換基としての単環もしくは2環の芳香族基またはヘテロ芳香族環基は、上述したハロゲン原子のほかに、1から3個の以下の置換基を持っていてもよい。すなわち、

ニトロ、シアノ、チオシアナート、

アルキル、ことに上述したような $C_1 - C_6$ アルキル、好ましくはメチル、エチル、1-メチルエチル、1,1-ジメチルエチル、ブチル、ヘキシル、なかんずくメチルおよび1-メチルエチルを、

10

上述したような $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、ことにトリクロロメチル、ジフルオロメチル、2,2-ジフルオロメチル、2,2,2-トリフルオロエチルおよびペンタフルオロエチルを、

$C_1 - C_4$ アルコキシ、好ましくはメトキシ、エトキシ、1-メチルエトキシおよび1,1-ジメチルエトキシ、ことにメトキシを、

$C_1 - C_4$ ハロゲンアルコキシ、好ましくはジフルオロメチルオキシ、トリフルオロメチルオキシおよび2,2,2-トリフルオロエチルオキシのような $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシ、ことにジフルオロメチルオキシを、

$C_1 - C_4$ アルキルチオ、好ましくはメチルチオおよび1-メチルエチルチオ、ことにメチルチオを、

20

$C_1 - C_4$ アルキルアミノ、例えばメチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、1-メチルエチルアミノ、ブチルアミノ、1-メチルプロピルアミノ、2-メチルプロピルアミノおよび1,1-ジメチルエチルアミノ、好ましくはメチルアミノおよび1,1-ジメチルエチルアミノ、ことにメチルアミノを、

ジ- $C_1 - C_4$ アルキルアミノ、例えばN,N-ジメチルアミノ、N,N-ジエチルアミノ、N,N-ジプロピルアミノ、N,N-ジ-(1-メチルエチル)アミノ、N,N-ジブチルアミノ、N,N-ジ-(1-メチルプロピル)アミノ、N,N-ジ-(2-メチルプロピル)アミノ、N,N-ジ-(1,1-ジメチルエチル)アミノ、N-エチル-N-メチルアミノ、N-メチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-(1-メチルエチル)アミノ、N-ブチル-N-メチルアミノ、N-メチル-N-(1-メチルプロピル)アミノ、N-メチル-N-(2-メチルプロピル)アミノ、N-(1,1-ジメチルエチル)-N-メチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-エチル-N-(1,1-ジメチルエチル)アミノ、N-(1-メチルエチル)-N-プロピルアミノ、N-ブチル-N-プロピルアミノ、N-(1-メチルプロピル)-N-プロピルアミノ、N-(2-メチルプロピル)-N-プロピルアミノ、N-(1,1-ジメチルエチル)-N-プロピルアミノ、N-ブチル-N-(1-メチルエチル)アミノ、N-(1-メチルエチル)-N-(1-メチルプロピル)アミノ、N-(1-メチルエチル)-N-(2-メチルプロピル)アミノ、N-(1,1-ジメチルエチル)-N-(1-メチルエチル)アミノ、N-ブチル-N-(1-メチルプロピル)アミノ、N-ブチル-N-(2-エチルプロピル)アミノ、N-ブチル-N-(1,1-ジメチルエチル)アミノ、N-(1-メチルプロピル)-N-(2-メチルプロピル)アミノ、N-(1,1-ジメチルエチル)-N-(1-メチルプロピル)アミノおよびN-(1,1-ジメチルエチル)-N-(2-メチルプロピル)アミノ、好ましくはN,N-ジメチルアミノおよびN,N-ジエチルアミノ、ことにN,N-ジメチルアミノを、

30

40

$C_1 - C_6$ アルキルカルボニル、例えばメチルカルボニル、エチルカルボニル、プロピルカルボニル、1-メチルエチルカルボニル、ブチルカルボニル、1-メチルプロピルカルボニル、2-メチルプロピルカルボニル、1,1-ジメチルエチルカルボニル、ペンチルカルボニル、1-メチルブチルカルボニル、2-メチルブチルカルボニル、3-メチルブチルカルボニル、1,1-ジメチルプロピルカルボニル、1,2-ジメチルプロピルカルボ

50

ニル、2, 2 - ジメチルプロピルカルボニル、1 - エチルプロピルカルボニル、ヘキシルカルボニル、1 - メチルペンチルカルボニル、2 - メチルペンチルカルボニル、3 - メチルペンチルカルボニル、4 - メチルペンチルカルボニル、1, 1 - ジメチルブチルカルボニル、1, 2 - ジメチルブチルカルボニル、1, 3 - ジメチルブチルカルボニル、2, 2 - ジメチルブチルカルボニル、2, 3 - ジメチルブチルカルボニル、3, 3 - ジメチルブチルカルボニル、1 - エチルブチルカルボニル、2 - エチルブチルカルボニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルカルボニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルカルボニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルカルボニルおよび 1 - エチル - 2 - メチルプロピルカルボニル、好ましくはメチルカルボニル、エチルカルボニルおよび 1, 1 - ジメチルカルボニル、ことにエチルカルボニルを、

10

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>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、プロピルオキシカルボニル、1 - メチルエトキシカルボニル、ブチルオキシカルボニル、1 - メチルプロピルカルボニル、2 - メチルプロピルカルボニル、1, 1 - ジメチルエトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、1 - メチルブチルオキシカルボニル、2 - メチルブチルオキシカルボニル、3 - メチルブチルオキシカルボニル、2, 2 - ジメチルプロピルオキシカルボニル、1 - エチルプロピルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル、1, 1 - ジメチルプロピルオキシカルボニル、1, 2 - ジメチルプロピルオキシカルボニル、1 - メチルペンチルオキシカルボニル、2 - メチルペンチルオキシカルボニル、3 - メチルペンチルオキシカルボニル、4 - メチルペンチルオキシカルボニル、1, 1 - ジメチルブチルオキシカルボニル、1, 2 - ジメチルブチルオキシカルボニル、1, 3 - ジメチルブチルオキシカルボニル、2, 2 - ジメチルブチルオキシカルボニル、2, 3 - ジメチルブチルオキシカルボニル、3, 3 - ジメチルブチルオキシカルボニル、1 - エチルブチルオキシカルボニル、2 - エチルブチルオキシカルボニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルオキシカルボニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルオキシカルボニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルオキシカルボニルおよび 1 - エチル - 2 - メチルプロピルオキシカルボニル、好ましくはメトキシカルボニル、エトキシカルボニルおよび 1, 1 - ジメチルエトキシカルボニル、ことにエトキシカルボニルを、

20

C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>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、プロピルアミノカルボニル、1 - メチルエチルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、1 - メチルプロピルアミノカルボニル、2 - メチルプロピルアミノカルボニル、1, 1 - ジメチルエチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、1 - メチルブチルアミノカルボニル、2 - メチルブチルアミノカルボニル、3 - メチルブチルアミノカルボニル、2, 2 - ジメチルプロピルアミノカルボニル、1 - エチルプロピルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、1, 1 - ジメチルプロピルアミノカルボニル、1, 2 - ジメチルプロピルアミノカルボニル、1 - メチルペンチルアミノカルボニル、2 - メチルペンチルアミノカルボニル、3 - メチルペンチルアミノカルボニル、4 - メチルペンチルアミノカルボニル、1, 1 - ジメチルブチルアミノカルボニル、1, 2 - ジメチルブチルアミノカルボニル、1, 3 - ジメチルブチルアミノカルボニル、2, 2 - ジメチルブチルアミノカルボニル、2, 3 - ジメチルブチルアミノカルボニル、3, 3 - ジメチルブチルアミノカルボニル、1 - エチルブチルアミノカルボニル、2 - エチルブチルアミノカルボニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルアミノカルボニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルアミノカルボニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルアミノカルボニルおよび 1 - エチル - 2 - メチルプロピルアミノカルボニル、好ましくはメチルアミノカルボニルおよびエチルアミノカルボニル、ことにメチルアミノカルボニルを、

30

40

ジ - C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>アルキルアミノカルボニル、ことにジ - C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>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 - ジプロピルアミノカルボニル、N, N - ジ - (1 - メチルエチル)アミノカルボニル、N, N - ジブチルアミノカルボニル、N, N - ジ - (1 - メチルプロピル)アミノカルボニル、N, N - ジ - (2 - メチルプロピル)アミノカルボニル、N, N - ジ - (1, 1 - ジメチルエチル)アミノカルボニル、N - エチル - N - メチルアミノカルボニル、N - メチル -

50

N - プロピルアミノカルボニル、N - メチル - N - ( 1 - メチルエチル ) アミノカルボニル、N - ブチル - N - メチルアミノカルボニル、N - メチル - N - ( 1 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - メチル - N - ( 2 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - N - メチルアミノカルボニル、N - エチル - N - プロピルアミノカルボニル、N - エチル - N - ( 1 - メチルエチル ) アミノカルボニル、N - ブチル - N - エチルアミノカルボニル、N - エチル - N - ( 1 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - エチル - N - ( 2 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - エチル - N - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) アミノカルボニル、N - ( 1 - メチルエチル ) - N - プロピルアミノカルボニル、N - ブチル - N - プロピルアミノカルボニル、N - ( 1 - メチルプロピル ) - N - プロピルアミノカルボニル、N - ( 2 - メチルプロピル ) - N - プロピルアミノカルボニル、N - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - N - プロピルアミノカルボニル、N - ブチル - N - ( 1 - メチルエチル ) アミノカルボニル、N - ( 1 - メチルエチル ) - N - ( 1 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - ( 1 - メチルエチル ) - N - ( 2 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) - N - ( 1 - メチルエチル ) アミノカルボニル、N - ブチル - N - ( 1 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - ブチル - N - ( 2 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、N - ブチル - N - ( 1 , 1 - ジメチルエチル ) アミノカルボニル、N - ( 1 - メチルプロピル ) - N - ( 1 - メチルプロピル ) アミノカルボニルおよび N - ( 1 - メチルプロピル ) - N - ( 2 - メチルプロピル ) アミノカルボニル、好ましくは N , N - ジメチルおよび N , N - ジエチルアミノカルボニル、ことに N , N - ジメチルアミノカルボニルを持っていてもよく、さらに

$C_1 - C_6$ アルキルカルボキシ、例えばメチルカルボキシ、エチルカルボキシ、プロピルカルボキシ、1 - メチルエチルカルボキシ、ブチルカルボキシ、1 - メチルプロピルカルボキシ、2 - メチルプロピルカルボキシ、1 , 1 - ジメチルエチルカルボキシ、ペンチルカルボキシ、1 - メチルブチルカルボキシ、2 - メチルブチルカルボキシ、3 - メチルブチルカルボキシ、1 , 1 - ジメチルプロピルカルボキシ、1 , 2 - ジメチルプロピルカルボキシ、2 , 2 - ジメチルプロピルカルボキシ、1 - エチルプロピルカルボキシ、ヘキシルカルボキシ、1 - メチルペンチルカルボキシ、2 - メチルペンチルカルボキシ、3 - メチルペンチルカルボキシ、4 - メチルペンチルカルボキシ、1 , 1 - ジメチルブチルカルボキシ、1 , 2 - ジメチルブチルカルボキシ、1 , 3 - ジメチルブチルカルボキシ、2 , 2 - ジメチルブチルカルボキシ、2 , 3 - ジメチルブチルカルボキシ、3 , 3 - ジメチルブチルカルボキシ、1 - エチルブチルカルボキシ、2 - エチルブチルカルボキシ、1 , 1 , 2 - トリメチルプロピルカルボキシ、1 , 2 , 2 - トリメチルプロピルカルボキシ、1 - エチル - 1 - メチルカルボキシおよび 1 - エチル - 2 - メチルカルボキシ、好ましくはメチルカルボキシ、エチルカルボキシおよび 1 , 1 - ジメチルエチルカルボキシ、ことにメチルカルボキシおよび 1 , 1 - ジメチルエチルカルボキシを、

$C_1 - C_6$ アルキルカルボニルアミノ、例えばメチルカルボニルアミノ、エチルカルボニルアミノ、プロピルカルボニルアミノ、1 - メチルエチルカルボニルアミノ、ブチルカルボニルアミノ、1 - メチルプロピルカルボニルアミノ、2 - メチルプロピルカルボニルアミノ、1 , 1 - ジメチルエチルカルボニルアミノ、ペンチルカルボニルアミノ、1 - メチルブチルカルボニルアミノ、2 - メチルブチルカルボニルアミノ、3 - メチルブチルカルボニルアミノ、2 , 2 - ジメチルプロピルカルボニルアミノ、1 - エチルプロピルカルボニルアミノ、ヘキシルカルボニルアミノ、1 , 1 - ジメチルプロピルカルボニルアミノ、1 , 2 - ジメチルプロピルカルボニルアミノ、1 - メチルペンチルカルボニルアミノ、2 - メチルペンチルカルボニルアミノ、3 - メチルペンチルカルボニルアミノ、4 - メチルペンチルカルボニルアミノ、1 , 1 - ジメチルブチルカルボニルアミノ、1 , 2 - ジメチルブチルカルボニルアミノ、1 , 3 - ジメチルブチルカルボニルアミノ、2 , 2 - ジメチルブチルカルボニルアミノ、2 , 3 - ジメチルブチルカルボニルアミノ、3 , 3 - ジメチルブチルカルボニルアミノ、1 - エチルブチルカルボニルアミノ、2 - エチルブチルカルボニルアミノ、1 , 1 , 2 - トリメチルプロピルカルボニルアミノ、1 , 2 , 2 - トリメチルプロピルカルボニルアミノ、1 - エチル - 1 - メチルプロピルカルボニルアミノおよび

1 - エチル - 2 - メチルプロピルカルボニルアミノ、好ましくはメチルカルボニルアミノ、およびエチルカルボニルアミノ、ことにエチルカルボニルアミノを、

$C_3 - C_7$ シクロアルキル、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルおよびシクロペンチル、好ましくはシクロプロピル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル、ことにシクロプロピルを、

$C_3 - C_7$ シクロアルコキシ、例えばシクロプロピルオキシ、シクロブチルオキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシおよびシクロヘプチルオキシ、好ましくはシクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシおよびシクロヘキシルオキシ、ことにシクロヘキシルオキシを、

$C_3 - C_7$ シクロアルキルチオ、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およびシクロヘプチルチオ、好ましくはシクロヘキシルチオを、さらに

$C_3 - C_7$ シクロアルキルアミノ、例えばシクロプロピルアミノ、シクロブチルアミノ、シクロペンチルアミノ、シクロヘキシルアミノ、およびシクロヘプチルアミノ、好ましくはシクロプロピルアミノおよびシクロヘキシルアミノ、ことにシクロプロピルアミノを置換基として持っていてよい。

単環もしくは2環の芳香族もしくはヘテロ芳香族環基は、上述した置換基のほかに、さらに基 - CR = NOR を持っていてよい。ただし、

R は水素、シアノ、アルキル (好ましくは  $C_1 - C_6$ アルキル、ことに  $C_1 - C_4$ アルキル)、ハロアルキル (好ましくは  $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ことに  $C_1 - C_2$ ハロアルキル)、アルケニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ アルケニル、ことに  $C_2 - C_4$ アルケニル)、ハロアルケニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ ハロアルケニル、ことに  $C_2 - C_4$ ハロアルケニル)、アルキニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ アルキニル、ことに  $C_2 - C_4$ アルキニル)、ハロアルキニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ ハロアルキニル、ことに  $C_2 - C_4$ ハロアルキニル) およびシクロアルキル (好ましくは  $C_3 - C_8$ シクロアルキル、ことに  $C_3 - C_6$ シクロアルキル) を意味し、

R はアルキル (好ましくは  $C_1 - C_6$ アルキル、ことに  $C_1 - C_4$ アルキル)、ハロアルキル (好ましくは  $C_1 - C_4$ ハロアルキル、ことに  $C_1 - C_2$ ハロアルキル)、アルケニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ アルケニル)、ハロアルケニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ ハロアルケニル、ことに  $C_2 - C_4$ ハロアルケニル)、アルキニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ アルキニル、ことに  $C_2 - C_4$ アルキニル)、ハロアルキニル (好ましくは  $C_2 - C_6$ ハロアルキニル、ことに  $C_2 - C_4$ ハロアルキニル) およびシクロアルキル (好ましくは  $C_3 - C_8$ シクロアルキル、ことに  $C_3 - C_6$ シクロアルキル) を意味する。

化合物 (I) の生物学的効果にかんがみて、式中の

は二重結合を意味するのが好ましい。

式中の

---

が単一結合を意味する場合の化合物 (I) も好ましい。

同様に n が 0 または 1、ことに 0 を意味する場合の化合物 (I) が好ましい。

さらに、 $R^1$  がハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_2$ ハロゲンアルコキシを意味する場合の化合物 (I) が好ましい。

また m が 0 または 1 を意味する場合の化合物 (I) が好ましい。

同様にして  $R^2$  がニトロ、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ アルコキシカルボニルを意味する場合の化合物 (I) が好ましい。

さらに、 $R^3$  が  $C_1 - C_4$ アルキルまたは  $C_3 - C_6$ シクロアルキルを意味する場合の化合物が好ましい。

また、 $R^3$  が炭素原子のほかに、環員として、1 から 4 個の窒素原子、または 1 もしくは 2 個の窒素原子と 1 個の酸素もしくは硫黄原子、または 1 個の酸素もしくは硫黄原子を持っていたりもよく、置換されていてもよい、単環もしくは2環芳香族基を意味する場合の化

10

20

30

40

50

化合物 (I) も好ましい。

なお、 $R^3$  が部分的もしくは全体的にハロゲン化され、かつ/もしくは以下の置換基を持っていてもよいフェニル環を有するフェニル、ベンジルを意味する場合の化合物 (I) は、ことに好ましい。上述の置換基は、

1 から 3 個の、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_4$  ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$  アルコキシ、 $C_1 - C_4$  アルコキシ -  $C_1 - C_4$  アルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  アルコキシカルボニル、フェニル、フェノキシ、フェニル -  $C_1 - C_4$  アルコキシ (これらのフェニル環自体が、部分的もしくは全体的にハロゲン化されていてもよく、かつ/もしくは 1 から 3 個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $C_1 - C_2$  ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$  アルコキシ、 $C_1 - C_2$  ハロゲンアルコキシ、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  アルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$  アルコキシカルボニルを持っていてもよい) および/または

基  $CR = NOR$  ( $R$  は水素または  $C_1 - C_4$  アルキルを、 $R$  は  $C_1 - C_6$  アルキルを意味する) および/または

オキシ -  $C_1 - C_3$  アルコキシブリッジまたはオキシ -  $C_1 - C_3$  ハロゲンアルコキシブリッジで結合されているフェニル環の隣接 2 炭素原子である。

さらに、 $R^3$  が部分的もしくは全体的にハロゲン化されており、かつ/もしくは 1 から 3 個のシアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $C_1 - C_2$  ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$  アルコキシ、 $C_1 - C_2$  ハロゲンアルコキシ、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_4$  アルキルカルボニルまたは  $C_1 - C_4$  アルコキシカルボニルを置換基として持っていてもよいピリジル環から成るピリジルまたはピリジニルを意味する場合の化合物 (I) もことに好ましい。

また、 $R^4$  が水素、 $C_1 - C_4$  アルキル、 $C_1 - C_2$  ハロゲンアルキルを意味する場合の化合物 (I) も好ましい。

さらに、 $R^5X$  がメチル、エチル、メトキシまたはメチルアミノを意味する場合の化合物 (I) も好ましい。

ことに好ましい化合物 (I) を以下の表に掲記する。

表 1

下式 (I. 1) で表わされ、 $R^4$  がメチルを意味し、 $R^5X$  がメチルを意味し、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物。

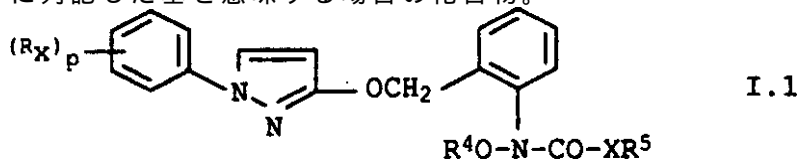


表 2

$R^4$  がメチルを、 $R^5X$  がエチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I. 1)。

表 3

下式 (I. 2) で表わされ、 $R^4$  がメチルを、 $R^5X$  がメチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物。

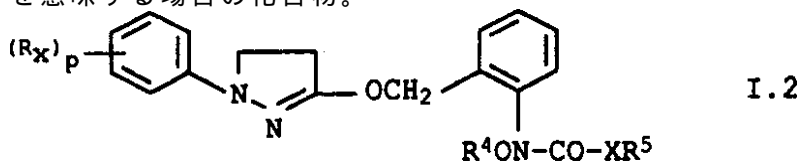


表 4

$R^4$  がメチルを、 $R^5X$  がエチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I. 2)。

表 5

$R^4$  がメチルを、 $R^5X$  がメトキシを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I. 2)。

表 6

10

20

30

40

50

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.2)。

表7

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.2)。

表8

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.2)。

表9

下式(I.3)で表わされ、 $R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルを、 $R^y$ が水素を、 $R^z$ が塩素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物。

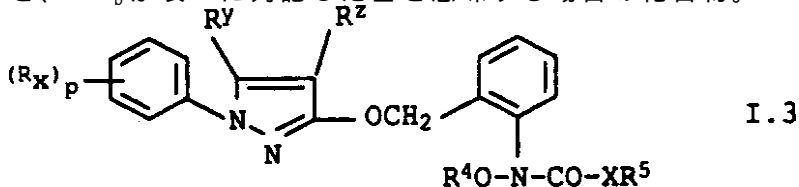


表10

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がエチルを、 $R^y$ が水素を、 $R^z$ が塩素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表11

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメトキシを、 $R^y$ が水素を、 $R^z$ が塩素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表12

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^y$ が水素を、 $R^z$ が塩素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表13

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表14

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がエチルを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表15

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメトキシを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表16

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表17

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表18

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がエチルを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

19

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメトキシを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表20

$R^4$ がメチルを、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表21

10

20

30

40

50



下記 (I . 4) で表わされ、 $R^5X$  がメチルを、 $R^1$ 、 $R^y$ 、 $R^z$  および  $R^4$  の組合わせが、表 B に示される基を意味する場合の化合物。

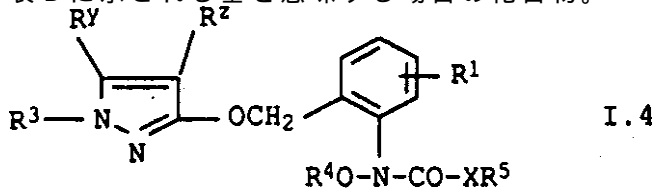


表 2 2

$R^5X$  がエチルを、 $R^1$ 、 $R^y$ 、 $R^z$ 、 $R^3$  および  $R^4$  の組合わせが、表 B に示される基を意味する場合の化合物 (I . 4)。

10

表 2 3

$R^5X$  がメトキシを、 $R^1$ 、 $R^y$ 、 $R^z$ 、 $R^3$  および  $R^4$  の組合わせが、表 B に示される基を意味する場合の化合物 (I . 4)。

表 2 4

$R^5X$  がメチルアミノを、 $R^1$ 、 $R^y$ 、 $R^z$ 、 $R^3$  および  $R^4$  の組合わせが、表 B に示される基を意味する場合の化合物 (I . 4)。

表 2 5

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 1)。

表 2 6

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がエチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 1)。

20

表 2 7

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 2)。

表 2 8

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がエチルを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 2)。

表 2 9

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメトキシを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 1)。

30

表 3 0

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメトキシを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 1)。

表 3 1

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメチルアミノを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 1)。

表 3 2

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメチルアミノを、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 2)。

40

表 3 3

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメチルを、 $R^y$  が水素を、 $R^z$  が塩素を、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 3)。

表 3 4

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がエチルを、 $R^y$  が水素を、 $R^z$  が塩素を、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 3)。

表 3 5

$R^4$  が水素を、 $R^5X$  がメトキシを、 $R^y$  が水素を、 $R^z$  が塩素を、 $R^x_p$  が表 A に列記した基を意味する場合の化合物 (I . 3)。

表 3 6

50

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメチルチオを、 $R^y$ が水素を、 $R^z$ が塩素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表37

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメチルを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表38

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がエチルを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表39

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメトキシを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。 10

表40

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^y$ がメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表41

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメチルを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表42

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がエチルを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。 20

表43

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメトキシを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表44

$R^4$ が水素を、 $R^5X$ がメチルアミノを、 $R^y$ がトリフルオロメチルを、 $R^z$ が水素を、 $R^x_p$ が表Aに列記した基を意味する場合の化合物(I.3)。

表 A

No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
1	H
2	2-F
3	3-F
4	4-F
5	2,4-F <sub>2</sub>
6	2,4,6-F <sub>3</sub>
7	2,3,4,5,6-F <sub>5</sub>
8	2,3-F <sub>2</sub>
9	2-Cl
10	3-Cl
11	4-Cl
12	2,3-Cl <sub>2</sub>
13	2,4-Cl <sub>2</sub>
14	2,5-Cl <sub>2</sub>
15	2,6-Cl <sub>2</sub>
16	3,4-Cl <sub>2</sub>
17	3,5-Cl <sub>2</sub>
18	2,3,4-Cl <sub>3</sub>
19	2,3,5-Cl <sub>3</sub>
11	2,3,6-Cl <sub>3</sub>
12	2,4,5-Cl <sub>3</sub>
13	2,4,6-Cl <sub>3</sub>
14	3,4,5-Cl <sub>3</sub>
15	2,3,4,6-Cl <sub>4</sub>
16	2,3,5,6-Cl <sub>4</sub>

10

20

30

No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
17	2,3,4,5,6-Cl <sub>5</sub>
18	2-Br
19	3-Br
20	4-Br
21	2,4-Br <sub>2</sub>
22	2,5-Br <sub>2</sub>
23	2,6-Br <sub>2</sub>
24	2,4,6-Br <sub>3</sub>
25	2,3,4,5,6-Br <sub>5</sub>
26	2-J
27	3-J
28	4-J
29	2,4-J <sub>2</sub>
30	2-Cl, 3-F
31	2-Cl, 4-F
32	2-Cl, 5-F
33	2-Cl, 6-F
34	2-Cl, 3-Br
35	2-Cl, 4-Br
36	2-Cl, 5-Br
37	2-Cl, 6-Br
38	2-Br, 3-Cl
39	2-Br, 4-Cl
40	2-Br, 5-Cl
41	2-Br, 3-F
42	2-Br, 4-F
43	2-Br, 5-F
44	2-Br, 6-F
45	2-F, 3-Cl
46	2-F, 4-Cl
47	2-F, 5-Cl
48	3-Cl, 4-F
49	3-Cl, 5-F
50	3-Cl, 4-Br
51	3-Cl, 5-Br
52	3-F, 4-Cl
53	3-F, 4-Br
54	3-Br, 4-Cl
55	3-Br, 4-F

10

20

30

40

No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
56	2,6-Cl <sub>2</sub> , 4-Br
57	2-CH <sub>3</sub>
58	3-CH <sub>3</sub>
59	4-CH <sub>3</sub>
60	2,3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
61	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
62	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
63	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
64	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
65	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
66	2,3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
67	2,3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
68	2,3,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
69	2,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
70	2,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
71	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
72	2,3,4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>4</sub>
73	2,3,5,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>4</sub>
74	2,3,4,5,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>5</sub>
75	2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
76	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
77	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
78	2,4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
79	2,6-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
80	3,5-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>
81	2,4,6-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>3</sub>
82	2-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
83	3-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
84	4-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
85	2-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
86	3-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
87	4-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
88	2,4-(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
89	2,6-(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
90	3,5-(i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ) <sub>2</sub>
91	2-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
92	3-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
93	4-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
94	2-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
95	3-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
96	4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
97	4-n-C <sub>9</sub> H <sub>19</sub>
98	2-CH <sub>3</sub> , 4-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
99	2-CH <sub>3</sub> , 6-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
100	2-CH <sub>3</sub> , 4-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
101	2-CH <sub>3</sub> , 5-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
102	3-CH <sub>3</sub> , 4-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
103	2-シクロ-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
104	3-シクロ-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
105	4-シクロ-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>
106	2-Cl, 4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
107	2-Br, 4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
108	2-OCH <sub>3</sub>
109	3-OCH <sub>3</sub>
110	4-OCH <sub>3</sub>
111	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
112	3-O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
113	4-O-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
114	2-O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
115	3-O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
116	4-O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
117	2-O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
118	3-O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
119	4-O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
120	2-O-n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>
121	3-O-n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>
122	4-O-n-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>
123	2-O-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
124	3-O-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
125	4-O-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
126	2-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
127	4-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
128	2,3-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
129	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
130	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
131	2,6-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
132	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
133	3,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
134	2-O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
135	3-O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
136	4-O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
137	3-(3'-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
138	4-(4'-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
139	2-O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
140	3-O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
141	4-O-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
142	2-O-(2'-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
143	3-O-(3'-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
144	4-O-(4'-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
145	2,3,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> , 4-F
146	2,3,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> , 4-Cl
147	2,3,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> , 4-Br
148	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 6-F
149	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 6-Cl
150	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 6-Br
151	2-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> , 4-Cl, 5-CH <sub>3</sub>
152	2-Cl, 4-NO <sub>2</sub>
153	2-NO <sub>2</sub> , 4-Cl
154	2-OCH <sub>3</sub> , 5-NO <sub>2</sub>
155	2,4-Cl <sub>2</sub> , 5-NO <sub>2</sub>
156	2,4-Cl <sub>2</sub> , 6-NO <sub>2</sub>
157	2,6-Cl <sub>2</sub> , 4-NO <sub>2</sub>
158	2,6-Br <sub>2</sub> , 4-NO <sub>2</sub>
159	2,6-I <sub>2</sub> , 4-NO <sub>2</sub>
160	2-CH <sub>3</sub> , 5-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> , 4-Cl
161	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
162	3-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
163	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
164	2-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
165	3-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
166	4-CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>
167	2-Me-4-CH <sub>3</sub> -CH(CH <sub>3</sub> )-CO
168	2-CH <sub>3</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NOCH <sub>3</sub> )
169	2-CH <sub>3</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
170	2-CH <sub>3</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NO-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
171	2-CH <sub>3</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NO-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
172	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NOCH <sub>3</sub> )

10

20

30

40

No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
173	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )
174	2,5-(CH <sub>3</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NO-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> ))
175	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -4-(CH <sub>3</sub> -C=NO-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> )
176	2-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
177	3-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
178	4-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>
179	2-(2'-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )
180	2-CH <sub>3</sub> , 5-Br
181	2-CH <sub>3</sub> , 6-Br
182	2-Cl, 3-CH <sub>3</sub>
183	2-Cl, 4-CH <sub>3</sub>
184	2-Cl, 5-CH <sub>3</sub>
185	2-F, 3-CH <sub>3</sub>
186	2-F, 4-CH <sub>3</sub>
187	2-F, 5-CH <sub>3</sub>
188	2-Br, 3-CH <sub>3</sub>
189	2-Br, 4-CH <sub>3</sub>
190	2-Br, 5-CH <sub>3</sub>
191	3-CH <sub>3</sub> , 4-Cl
192	3-CH <sub>3</sub> , 5-Cl
193	3-CH <sub>3</sub> , 4-F
194	3-CH <sub>3</sub> , 5-F
195	3-CH <sub>3</sub> , 4-Br
196	3-CH <sub>3</sub> , 5-Br
197	3-F, 4-CH <sub>3</sub>
198	3-Cl, 4-CH <sub>3</sub>
199	3-Br, 4-CH <sub>3</sub>
200	2-Cl, 4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
201	2-Br, 4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
202	2-Cl, 3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
203	2-Br, 3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
204	2,6-Cl <sub>2</sub> , 4-CH <sub>3</sub>
205	2,6-F <sub>2</sub> , 4-CH <sub>3</sub>
206	2,6-Br <sub>2</sub> , 4-CH <sub>3</sub>
207	2,4-Br <sub>2</sub> , 6-CH <sub>3</sub>
208	2,4-F <sub>2</sub> , 6-CH <sub>3</sub>
209	2,4-Br <sub>2</sub> , 6-CH <sub>3</sub>
210	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-F
211	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-Cl

10

20

30

40



No.	R <sup>x</sup> <sub>p</sub>
212	2,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-Br
213	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-F
214	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-Cl
215	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , 4-Br
216	2-CF <sub>3</sub>
217	3-CF <sub>3</sub>
218	4-CF <sub>3</sub>
219	2-OCF <sub>3</sub>
220	3-OCF <sub>3</sub>
221	4-OCF <sub>3</sub>
222	3-OCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>
223	2-NO <sub>2</sub>
224	3-NO <sub>2</sub>
225	4-NO <sub>2</sub>
226	2-CN
227	3-CN
228	4-CN
229	2-CH <sub>3</sub> , 3-Cl
230	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl
231	2-CH <sub>3</sub> , 5-Cl
232	2-CH <sub>3</sub> , 6-Cl
233	2-CH <sub>3</sub> , 3-F
234	2-CH <sub>3</sub> , 4-F
235	2-CH <sub>3</sub> , 5-F
236	2-CH <sub>3</sub> , 6-F
237	2-CH <sub>3</sub> , 3-Br
238	2-CH <sub>3</sub> , 4-Br
239	2-ピリジル-2'
240	3-ピリジル-3'
241	4-ピリジル-4'

10

20

30

表 B

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
334	H	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
335	H	H	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
336	H	H	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
337	H	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
338	H	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
339	H	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
340	H	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
341	H	H	Cl	ベンジル	CH <sub>3</sub>
342	H	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
343	H	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
344	H	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
345	H	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
346	H	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
347	H	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
348	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
349	H	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
350	H	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
351	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
352	H	H	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
353	H	H	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
354	H	H	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
355	H	H	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
356	H	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
357	H	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
358	H	H	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
359	H	H	Cl	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
360	H	H	Cl	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
361	H	H	Cl	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
362	H	H	Cl	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
363	H	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
364	H	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
365	H	H	Cl	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
366	H	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
367	H	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
368	H	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
369	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
370	H	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
371	H	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
372	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
373	H	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
374	H	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
375	H	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
376	H	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
377	H	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
378	H	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
379	H	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
380	H	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
381	H	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
382	H	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
383	H	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
384	H	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
385	H	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
386	H	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
387	H	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
388	H	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
389	H	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
390	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
391	H	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
392	H	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
393	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
394	H	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
395	H	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
396	H	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
397	H	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
398	H	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
399	H	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
400	H	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
401	H	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
402	H	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
403	H	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
404	H	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
405	H	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
406	H	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
407	H	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
408	H	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
409	H	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
410	H	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
411	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
412	H	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
413	H	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
414	H	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
415	3-F	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
416	3-F	H	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
417	3-F	H	H	フェニル	CH <sub>3</sub>
418	3-F	H	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
419	3-F	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
420	3-F	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
421	3-F	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
422	3-F	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
423	3-F	H	Cl	ベンジル	CH <sub>3</sub>
424	3-F	H	Cl	フェニル	CH <sub>3</sub>
425	3-F	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
426	3-F	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
427	3-F	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
428	3-F	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
429	3-F	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
430	3-F	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
431	3-F	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>3</sub>
432	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
433	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
434	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
435	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
436	3-F	H	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
437	3-F	H	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
438	3-F	H	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
439	3-F	H	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
440	3-F	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
441	3-F	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
442	3-F	H	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
443	3-F	H	Cl	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
444	3-F	H	Cl	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
445	3-F	H	Cl	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
446	3-F	H	Cl	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
447	3-F	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
448	3-F	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
449	3-F	H	Cl	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
450	3-F	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
451	3-F	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
452	3-F	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
453	3-F	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
454	3-F	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
455	3-F	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
456	3-F	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
457	3-F	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
458	3-F	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
459	3-F	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
460	3-F	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
461	3-F	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
462	3-F	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
463	3-F	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
464	3-F	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
465	3-F	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
466	3-F	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
467	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
468	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
469	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
470	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
471	3-F	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
472	3-F	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
473	3-F	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
474	3-F	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
475	3-F	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
476	3-F	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
477	3-F	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
478	3-F	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
479	3-F	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
480	3-F	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
481	3-F	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
482	3-F	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
483	3-F	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
484	3-F	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
485	3-F	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
486	3-F	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
487	3-F	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
488	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
489	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
490	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
491	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
492	6-Cl	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
493	6-Cl	H	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
494	6-Cl	H	H	フェニル	CH <sub>3</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
495	6-Cl	H	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
496	6-Cl	H	H	5-Cl-ピリジル-2	CH <sub>3</sub>
497	6-Cl	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	CH <sub>3</sub>
498	6-Cl	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
499	6-Cl	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
500	6-Cl	H	Cl	ベンジル	CH <sub>3</sub>
501	6-Cl	H	Cl	フェニル	CH <sub>3</sub>
502	6-Cl	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
503	6-Cl	H	Cl	5-Cl-ピリジル-2	CH <sub>3</sub>
504	6-Cl	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	CH <sub>3</sub>
505	6-Cl	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
506	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
507	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
508	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>3</sub>
509	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
510	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリジル-2	CH <sub>3</sub>
511	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	CH <sub>3</sub>
512	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
513	6-Cl	H	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
514	6-Cl	H	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
515	6-Cl	H	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
516	6-Cl	H	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
517	6-Cl	H	H	5-Cl-ピリジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
518	6-Cl	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
519	6-Cl	H	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
520	6-Cl	H	Cl	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
521	6-Cl	H	Cl	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
522	6-Cl	H	Cl	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
523	6-Cl	H	Cl	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
524	6-Cl	H	Cl	5-Cl-ピリジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
525	6-Cl	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
526	6-Cl	H	Cl	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
527	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
528	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
529	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
530	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
531	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
532	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
533	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
534	6-Cl	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
535	6-Cl	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
536	6-Cl	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
537	6-Cl	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
538	6-Cl	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
539	6-Cl	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
540	6-Cl	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
541	6-Cl	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
542	6-Cl	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
543	6-Cl	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
544	6-Cl	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
545	6-Cl	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
546	6-Cl	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
547	6-Cl	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
548	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
549	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
550	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
551	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
552	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
553	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
554	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
555	6-Cl	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
556	6-Cl	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
557	6-Cl	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
558	6-Cl	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
559	6-Cl	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH

10

20

30

40



No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
560	6-Cl	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
561	6-Cl	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
562	6-Cl	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
563	6-Cl	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
564	6-Cl	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
565	6-Cl	H	Cl	2-ピリジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
566	6-Cl	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
567	6-Cl	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
568	6-Cl	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
569	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
570	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
571	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
572	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
573	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
574	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
575	6-Cl	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
576	6-CH <sub>3</sub>	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
577	6-CH <sub>3</sub>	H	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
578	6-CH <sub>3</sub>	H	H	フェニル	CH <sub>3</sub>
579	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピリジニル	CH <sub>3</sub>
580	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
581	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
582	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
583	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
584	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	ベンジル	CH <sub>3</sub>
585	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	フェニル	CH <sub>3</sub>
586	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピリジニル	CH <sub>3</sub>
587	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
588	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
589	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
590	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>
591	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>3</sub>
592	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>3</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>V</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
593	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>
594	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
595	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>3</sub>
596	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>
597	6-CH <sub>3</sub>	H	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
598	6-CH <sub>3</sub>	H	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
599	6-CH <sub>3</sub>	H	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
600	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
601	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
602	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
603	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
604	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
605	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
606	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
607	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
608	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
609	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
610	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
611	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
612	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
613	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
614	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
615	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
616	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
617	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
618	6-CH <sub>3</sub>	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
619	6-CH <sub>3</sub>	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
620	6-CH <sub>3</sub>	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
621	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
622	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
623	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
624	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>y</sup>	R <sup>z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
625	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
626	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
627	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
628	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
629	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
630	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
631	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
632	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
633	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
634	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
635	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
636	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
637	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
638	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
639	6-CH <sub>3</sub>	H	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
640	6-CH <sub>3</sub>	H	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
641	6-CH <sub>3</sub>	H	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
642	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
643	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
644	6-CH <sub>3</sub>	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
645	6-CH <sub>3</sub>	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
646	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
647	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
648	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
649	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
650	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
651	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
652	6-CH <sub>3</sub>	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
653	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	CH <sub>2</sub> C≡CH
654	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
655	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
656	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	CH <sub>2</sub> C≡CH
657	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH

10

20

30

40

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>
658	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	CH <sub>2</sub> C≡CH
659	6-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	CH <sub>2</sub> C≡CH
660	3-F	CH <sub>3</sub>	H	シクロヘキシル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
661	3-F	CH <sub>3</sub>	H	ベンジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
662	3-F	CH <sub>3</sub>	H	フェニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
663	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピリジル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
664	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-Cl-ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
665	3-F	CH <sub>3</sub>	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリ- ジル-2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
666	3-F	CH <sub>3</sub>	H	2-ピラジニル	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

本発明による化合物 I は有害菌類または昆虫、くも、線虫のような他の有害生物の防除に適している。化合物 I は植物保護において、あるいは衛生、在庫管理、獣医学の各分野における、殺菌剤および害虫防除剤として使用される。

害虫には次のものがある。すなわち、

鱗翅目 (Lepidoptera) の害虫には例えばアドキソフィエス・オラナ (Adoxophyes orana)、アグロテス・イプシロン (Agrotis ypsilon)、アグロテス・セゲタム (Agrotis segetum)、アラバマ・アルジラセア (Alabama argillacea)、アンチカルシア・ゲマタリス (Anticarsia gemmatalis)、アルジレスチア・コンジュゲラ (Argresthia conjugella)、オートグラフィア・ガンマ (Autographa gamma)、カコエシア・ムリナナ (Cacoecia murinana)、カプア・レチキュラナ (Capua reticulana)、チョリストネウラ・フミフェラナ (Choristoneura fumiferana)、チョリストネウラ・オクシデンタリス (Choristoneura occidentalis)、シルピス・ウニプンクタ (Cirphis unipuncta)、クナファロクロシス・メディナリス (Cnaphalocrocis medinalis)、クロシドロミア・ピノタリス (Crocidolomia binotalis)、チディア・ポモネーラ (Cydia pomonella)、デンドロリマス・ピニ (Dendrolimus pini)、ダイアファニア・ニチダリス (Diaphania nitidalis)、ダイアトラエア・グルンディオセーラ (Diatraea grandiosella)、エアリアス・インストラナ (Earias insulana)、エラスモパルパス・リグノセーラス (Elasmopalpus lignosellus)、オイポエシリア・アムピグエーラ (Eupoecilia ambiguella)、フェルチア・サブテラネア (Feltia subterranea)、ガレリア・メロネーラ (Galleria mellonella)、グラホリタ・フネブラナ (Grapholita funebrana)、グラホリタ・モレスタ (Grapholita molesta)、ヘリオテス・アルミゲラ (Heliothis armigera)、ヘリオテス・ピレゼンス (Heliothis virescens)、ヘリオテス・ジー (Heliothis zea)、ヘルラ・アンダリス (Hellula undalis)、ヒベルニア・デフォリアリア (Hiberniade foliaria)、ヒファントリア・クネア (Hyphantria cunea)、ヒポノムータ・マリネラス (Hyponomeutamalinelus)、ケイフェリア・リコペルシセーラ (Keifferia lycopersicella)、ラムブディナ・フィセルリア (Lambdina fiscellaria)、ラフィグマ・エクシグア (Laphygma exigua)、ロイコプテラ・シテルラ (Leucoptera scitella)、リソコレチス・ブランカルデーラ (Lithocolletis blancardella)、

10

20

30

40

50

ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロクソステゲ・スティクテ  
 イカリス (*Loxostege sticticalis*)、リマントリア・ディスパー  
 (*Lymantria dispar*)、リマントリア・モナチャ (*Lymantria*  
*monacha*)、リオネチア・クレルケーラ (*Lyonetia clerkella*)、マンドウカ・セクタ (*Manduca sexta*)、マラコソマ・ノイストリア  
 (*Malacosoma neustria*)、マメストラ・ブラシーカエ (*Mamestra brassicae*)、モキス・レパンダ (*Mocis repanda*)、オベ  
 ロフテラ・ブルマータ (*Operophterabrumata*)、オルギア・プソ  
 イドツガタ (*Orgyiapseudotsugata*)、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パンデミス・ペパラナ (*Pandemish*  
*eparana*)、パノリス・フラメア (*Panolis flamea*)、ペクチノフ  
 オラ・ゴシィピエーラ (*Pectinophoragossypiella*)、フトリマ  
 エア・オペルクレーラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロ  
 チスティス・シトレーラ (*Phyllochitis citrella*)、ピエリス・  
 ブラシーカ (*Pieris brassicae*)、プラティペナ・スカブラ (*Plat*  
*hypena scabra*)、プラティノタ・ストウルタナ (*Platynota s*  
*tultana*)、プルテラ・キシロステーラ (*Plutella xylostella*)、プライス・シトリ (*Prays citri*)、プライス・オレア (*Prays*  
*oleae*)、プロデニア・スニア (*Prodenia sunia*)、プロデニア・  
 オルニトガリ (*Prodenia ornithogalli*)、プソイドブルシア・イ  
 ンクルデンス (*Pseudoplusia includens*)、フィアシオニア・フ  
 ルストラナ (*Phyacionia frustrana*)、スクロビバルブラ・アブソ  
 ルタ (*Scrobipalpula absoluta*)、セサミア・インフェレンス (*Sesamia inferens*)、スパルガノティス・ピレリアナ (*Spargan*  
*othis pilleriana*)、スポドプテラ・フルジベルダ (*Spodoptera frugiperda*)、スポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littoralis*)、スポドプテラ・リチュラ (*Spodoptera litura*)、シレプタ・デロガタ (*Syllepta derogata*)、シナンテドン ミオ  
 パエフォラミス (*Synanthedon myopaeformis*)、タウマトボエ  
 ア・ピティオカムパ (*Thaumatopoea pityocamapa*)、トリトリ  
 ックス・ピリダナ (*Tortrix viridana*)、トリコブルシア・ニ (*Tri*  
*choplusia ni*)、トリポリザ・インセルツラス (*Tryporyza incertulas*)、ザイラフェラ・カナデンシス (*Zeiraphera canadensis*)、ガレリア・メロネア (*Galeria mellonella*)、シトロ  
 ガ・セレレーラ (*Sitotroga cerelella*)、エフェスティア・カウ  
 テラ (*Ephestia cautella*)、ティネオラ・ビセリエラ (*Tineola bisselliella*) が属する。

鞘翅目 (*Coleoptera*) としては例えばアグリオテス・リネアタス (*Agriotes lineatus*)、アグリオテス・オブスキュラス (*Agriotes obscurus*)、アンソノムス・グランディス (*Anthonomus grandis*)、アンソノムス・ポモラム (*Anthonomus pomorum*)、アピオン・フ  
 オラクス (*Apion vorax*)、アトマリア・リネアリム (*Atomarialinearis*)、ブラストファグス・ピニベルダ (*Blastophagus pini perda*)、ブルカス・ルフィマヌス (*Bruchus rufimanus*)、ブル  
 カス・ピソラム (*Bruchus pisorum*)、ブルカス・レントイス (*Bruchus lentis*)、カシィーダ・ネビュローサ (*Cassidanebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ (*Cerotomatrifurcata*)、シュートリー  
 ンカス・アッシミリス (*Ceuthorrhynchus assimilis*)、シュ  
 ートリーンカス・ナピ (*Ceuthorrhynchus napi*)、チャエトクネマ  
 ・ティビアリル (*Chaetocnema tibialis*)、コノデラス・ベスベル

10

20

30

40

50

ティナス (*Conoderus vespertinus*)、クリオセリス・アスパラギ  
 ー (*Crioceris asparagi*)、デンドロクトヌス・レフィペンニス (*D  
 endroctonus refipennis*)、ダイアブロティカ・ロンジコロニス  
 (*Diabroticalongicornis*)、ダイアブロティカ・12-プンクタ  
 タ (*Diabrotica 12-punctata*)、ダイアブロティカ・ビルジフェ  
 ラ (*Diabrotica virgifera*)、エピラシュナ・バリベスティス (*E  
 pilachna varivestis*)、エピトリックス・ヒルティペニス (*Epi  
 trix hirtipennis*)、オイティノボスラス・ブラシリエンシス (*Eut  
 inobothrus brasiliensis*)、ヒロビウス・アビエティス (*Hyl  
 obius abietis*)、ヒペラ・ポステイカ (*Hypera postica*)、  
 ヒペラ・ブルネイペニス (*Hypera brunneipennis*)、イプス・ティ  
 ボグラフィス (*Ips typographus*)、レマ・ビリネアタ (*Lema b  
 ilineata*)、レマ・メラノプス (*Lemamelanopus*)、レプチノタル  
 サ・デセムリネアタ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニ  
 ウス・カリフォルニカス (*Limonius californicus*)、リソルホブ  
 トラス・オリゾフィラス (*Lissorhoptrosoryzophilus*)、メラ  
 ノタス・コムニス (*Melanotus communis*)、メリゲテス・アエネウス  
 (*Meligethesaeneus*)、メロロンタ・ヒポカスタニ (*Melolont  
 hahippocastani*)、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha m  
 elolontha*)、オンレマ・オリザ (*Onlemaoryzae*)、オルティオ  
 リーンカス・サルカタス (*Ortiorrhynchus sulcatus*)、オルテ  
 ムオリーンカス・オバタス (*Ortiorrhynchus ovatus*)、ファエド  
 ン・コックレアリア (*Phaedon cochleariae*)、ピロトレタ・クリソ  
 セファラ (*Phyllotreta chrysocephala*)、フィロフィガ・エ  
 スピー (*Phyllophaga sp.*)、フィロペルサ・ホルティコラ (*Phyll  
 opertha horticola*)、フィロトレタ・ネモラム (*Phyllotre  
 ta nemorum*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta st  
 riolata*)、ポピーリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、  
 サイリオデス・ナピ (*Psylliodes napi*)、スコリツス・イントリカタス  
 (*Scolytus intricatus*)、シトナ・リネアタス (*Sitona l  
 ineatus*)、シトフィラス・グラナリア (*Sitophilus granari  
 a*)、ラシオデルマ・セリコルネ (*Lasioderma serricornes*)、オ  
 リザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensi  
 s*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhyzopertha dominica*)、シトフィ  
 ルス・オリザ (*Sitophilus oryzae*)、トリボリウム・カスターネウム  
 (*Tribolium castaneum*)、トロゴデルマ・グラナリウム (*Trog  
 oderma granarium*)、ザプロテス・サブファシアトス (*Zabrote  
 s subfasciatus*) が属する。

双翅目 (*Diptera*) としてはアエデス・アエジプティ (*Aedes aegypti*)  
 、アエデス・ベクスアン (*Aedes vexans*)、アナストレファ・ルーデンス  
 (*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペニス (*Anophe  
 les maculipennis*)、セラティティス・カピタタ (*Ceratitidis  
 capitata*)、クリソミヤ・ベジーアナ (*Chrysomya bezziana*)  
 、クリソミヤ・ホミニボラックス (*Chrysomya hominivorax*)  
 、クリソミヤ・マセーラリア (*Chrysomya macellaria*)、コンタリ  
 ニア・ソルジヒコラ (*Contarinia sorghicola*)、コルディロピア  
 ・アンソロポフィガ (*Cordylobia anthropophaga*)、キュレック  
 ス・ピピエンス (*Culex pipiens*)、ダカス・キュキュルビテア (*Dacus  
 cucurbitae*)、ダカス・オレア (*Dacus oleae*)、ダシネウラ・  
 ブラシーカ (*Dasineura brassicae*)、デアリア・コアルクタタ (*De*

10

20

30

40

50

*lia coarctata*)、*デリア・ラディコム* (*Delia radicum*)、*ファニア・カニキュラリス* (*Fanniacanicularis*)、*ガステロフィラス・インティティナリス* (*Gasterophilus intestinalis*)、*グロシア・モルシタンス* (*Glossia morsitans*)、*ヘマトビア・イリタンス* (*Haematobia irritans*)、*ハプロディプロシス・エケストリス* (*Haplodiplosis equestris*)、*ヒデレリア・グリセオラ* (*Hydrellia griseola*)、*ヒーレミア・ブラチュラ* (*Hylemyia platura*)、*ヒポデルマ・リネアタ* (*Hypoderma lineata*)、*リリオミザ・サチバエ* (*Liriomyza sativae*)、*リリオミザ・トリフォリイ* (*Liriomyza trifolii*)、*ルシリア・カプリナ* (*Lucilia caprina*)、*ルシリア・クプリナ* (*Luciliacuprina*)、*ルシリア・セリカタ* (*Luciliasericata*)、*マエティオラ・デストラクター* (*Mayetiola destructor*)、*ムスカ・ドメスティカ* (*Muscadomestica*)、*ムシーナ・スタビュランス* (*Muscina stabulans*)、*オエストラス・オビス* (*Oestrus ovis*)、*オルセオリア・オリザエ* (*Orseolia oryzae*)、*オッシネーラ・フリット* (*Oscinella frit*)、*ペゴミア・ヒソシャーミ* (*Pegomya hysocyami*)、*フォルビア・アンティカ* (*Phorbia antiqua*)、*フォルビア・ブラシーカ* (*Phorbia brassicae*)、*フォレビア・コアルクタタ* (*Phorbia coarctata*)、*ラゴレティス・セラシ* (*Rhagoletis cerasi*)、*ラゴレティス・ポモネーラ* (*Rhagoletis pomonella*)、*タバナス・ボビヌス* (*Tabanus bovinus*)、*ティブラ・オレラセア* (*Tipulaoleracea*)、*ティブラ・パルドサ* (*Tipulapaludosa*)、*シミュリウム・ダムノスム* (*Simuliumdamnosum*) が属する。

総翅目 (*Thysanoptera*) として例えば *フランクリニエーラ・フスカ* (*Frankliniella fusca*)、*フランクリニエーラ・オクシデンタリス* (*Frankliniella occidentalis*)、*フランクリニエーラ・トリティシ* (*Frankliniella tritici*)、*ハプロトリプス・トリティシ* (*Haplorthrips tritici*)、*シルトスリップス・シトリ* (*Scirtothrips citri*)、*スリップス・オリザエ* (*Thrips oryzae*)、*スリップス・パルミ* (*Thrips palmi*)、*スリップス・タバシ* (*Thrips tabaci*) が属する。

膜翅目 (*Hymenoptera*) としては例えば *アサリア・ロザエ* (*Athalia rosae*)、*アタ・セファロテス* (*Attacephalotes*)、*アタ・セックスデンス* (*Attasexdens*)、*アタ・テキサナ* (*Atta texana*)、*ホプロカンパ・ミヌタ* (*Hoplocampa minuta*)、*ホプロカンパ・テスチュディネア* (*Hoplocampa testudinea*)、*イリドミルメス・フミリス* (*Iridomyrmes humilis*)、*イリドミルメス・プルブレウス* (*Iridomyrmes purpureus*)、*モノモリウム・ハアラオニス* (*Monomorium pharaonis*)、*ソレノプシス・ゲミナタ* (*Solenopsis geminata*)、*ソレノプシス・インビクタ* (*Solenopsis invicta*)、*ソレノプシス・リヒテリ* (*Solenopsis richteri*) が属する。

異翅亜目 (*Heteroptera*) としては例えば *アクロステルナム・ヒラレ* (*Acrosternum hilare*)、*ブリサッス・ロイコプテラス* (*Blissus leucopterus*)、*シルトペルティス・ノタタス* (*Cyrtopeltis notatus*)、*ディスデルカス・シングラタス* (*Dysdercus cingulatus*)、*ディスデルカス・インテルメディアス* (*Dysdercus intermedius*)、*オイリーガスター・インテグリセプス* (*Eurygaster integriceps*)、*オイチスタス・イミクティベントリス* (*Euchistus imictiventris*)、*レプトグローサス・フィロープス* (*Leptoglossus ph*

yllopus)、リーガス・リネオラリス(*Lygus lineolaris*)、リーガス・ヘスペルス(*Lygus hesperus*)、リーガス・プラテンシス(*Lygus pratensis*)、ネザラ・ピリデウラ(*Nezaraviridula*)、ピエスマ・カドラタ(*Piesma quadrata*)、ソルベア・インストラリス(*Solubea insularis*)、ティアンタ・ベルディートル(*Thyantaperditor*)が属する。

同翅亜目(Homoptera)には例えばアシルトシフォン・オノブリーシス(*Acyrtosiphon onobrychis*)、アシルトシフォン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アデルゲス・ラリス(*Adelges laricis*)、アオニディエラ・アウランティ(*Aonidiella aurantii*)、  
10 アフィドラ・ナスチュルティ(*Aphidula nasturtii*)、アフィス・ファバエ(*Aphis fabae*)、アフィス・ゴシピ(*Aphis gossypii*)、アフィス・ポミ(*Aphis pomi*)、アウラコルトム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバキ(*Bemisia tabaci*)、ブラチーカウダス・カルデウイ(*Brachycaudus cardui*)、ブレブコリンネ・ブラシーカ(*Brevicoryne brassicae*)、ダルブルス・マイデイス(*Dalbulus maidis*)、ドレフュシア・ノルドマンニヤナエ(*Dreyfusia nordmanniana*)、ドレフュシア・ピセエア(*Dreyfusia piceae*)、ドレフュシア・ラジコラ(*Dreyfusia radicola*)、エムポアスカ・ファベイ(*Empoasca fabei*)、エリオソ  
20 マ・ラニゲルム(*Eriosoma lanigerum*)、ラオデルファクス・ストリアテラ(*Laodelphax striatella*)、マクロシフム・アベナエ(*Macrosiphum avenae*)、マクロシフム・オイフォルビア(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・ロザエ(*Macrosiphum rosae*)、メグーラ・ビシア(*Megoura viciae*)、メトポロフィウム・ディルホダム(*Metopolophium dirhodum*)、ミゾデス・ペルシカエ(*Myzodes persicae*)、ミザス・セラシー(*Myzus cerasi*)、ネフォテティクス・シンクテセプス(*Nephotettix cincticeps*)、ニラパルバタ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、ペルキンシェラ・サッカリシデ(*Perkinsiella saccharicida*)、  
30 フォロドン・フムリー(*Phorodon humuli*)、プラノココス・シトリ(*Planococcus citri*)、プリーラ・マリ(*Psyllamali*)、プシーラ・ピリ(*Psylla piri*)、プシーラ・ピリコール(*Psylla pyricol*)、クアドラスピディオトス・ペルニシオサス(*Quadraspidiotus perniciosus*)、ロパロシフム・マイデイス(*Rhopalosiphum maidis*)、サパフィス・オレア(*Sappaphis oleae*)、シザフィス・グラミナム(*Schizaphis graminum*)、セレナスピドス・アルティクラタス(*Selenaspidus articulatus*)、シトピオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、ソガテラ・フルキフェラ(*Sogatella furcifera*)、トキシソプテラ・シトリシダ(*Toxoptera citricida*)、  
40 トリアロイロデス・アブティロネア(*Trialeurodes abutilonea*)、トリアロイロデス・バポラリオラム(*Trialeurodes vaporariorum*)、ビテウス・ビティフォリー(*Viteus vitifolii*)が属する。

等翅目(Isoptera)には例えばカロテルメス・フラビコーリス(*Caloterme flavicollis*)、ロイコテルミス・フラビペス(*Leucotermes flavipes*)、マクロテルメス・サブヒアリヌス(*Macrotermes subhyalinus*)、オドントテルメス・フォルメザヌス(*Odontotermes formosanus*)、レティキュリテルメス・ルシフグス(*Reticulitermes lucifuqus*)、テルメス・ナタレンシス(*Termes na*  
50



*talensis* )。

直翅目 (*Orthoptera*) には例えばアチタ・ドメスチカ (*Acheta domestica*)、ブラッタ・オリエンタリス (*Blatta orientalis*)、ブラッタ・ジェルマニカ (*Blatta germanica*)、グリーロタルパ・グリーロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ロカスタ・ミグラトリア (*Locusta migratoria*)、メラノプラス・ブリッタタス (*Melanoplus brittatus*)、メラノプラス・フェムルールブラム (*Melanoplus femurrubrum*)、メラノプラス・メキシカナス (*Melanoplus mexicanus*)、メラノプラス・サングイニペス (*Melanoplus sanguinipes*)、メラノプラス・スプレタス (*Melanoplus spretus*)、ノマダリクス・セプテムファシアータ (*Nomadacris septemfasciata*)、ペリブラネタ・アメリカーナ (*Periphaneta americana*)、シストセルサ・アメリカーナ (*Schistocerca americana*)、シストセルサ・ペレグリナ (*Schistocerca peregrina*)、スタウロノタス・マロッカナス (*Stauronotus maroccanus*)、シストセルサ・グレガリア (*Schistocerca gregaria*) が属する。

10

蛛形類 (*Arachnoidea* の例にはダニ類) 例えばアムブリオンマ・アメリカナム (*Amblyomma americanum*)、アムブリオンマ・バリエガタム (*Amblyomma variegatum*)、アルガズ・ペルシカス (*Argas persicus*)、ブーフィラス・アンヌラタス (*Boophilus annulatus*)、ブーフィラス・デコロラタス (*Boophilus decoloratus*)、ブーフィラス・ミクロプラス (*Boophilus microplus*)、デルマセントール・シルバラム (*Dermacentor silvarum*)、ヘイアロムマ・トランクアタム (*Hyalomma truncatum*)、イクソデス・リシナス (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ルビカンダス (*Ixodes rubicundus*)、オルニトドラス・マウバタ (*Ornithodoros moubata*)、オトビンス・メグニニ (*Otobius megnini*)、リピセファラス・アペンディキュラタス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファラス・エヴェルトシー (*Rhipicephalus evertsi*) がある。

20

30

植食ダニ類、例えばアクロプス・リコペルシカエ (*Aculops lycopersicae*)、アクロプス・ペレカッシ (*Aculops Pelekassi*)、アクルス・シレエクテンダリ (*Aculus schlechtendali*)、プレバルパス・フェニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、ブリオビラ・ブラエティオサ (*Bryobia praetiosa*)、エオテトラニーカス・カルピニ (*Eotetranychus carpini*)、エウテトラニクス・バンクシ (*Eutetranychus banksii*)、エリオフェス・シエルドニ (*Eriphyes sheldoni*)、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、パノニカス・ウルミ (*Panonychus ulmi*)、パノニカス・シトリ (*Panonychus citri*)、フィロコプトルタ・オレイボラ (*Phyllocopturta oleivora*)、ポリファゴタルソネムス・ラタス (*Polyphagotarsonemus latus*)、タルソネムス・パリダス (*Tarsonemus palliodus*)、テトラニカス・シンナバリナス (*Tetranychus cinnabarinus*)、テトラニカス・カンザワイ (*Tetranychus kanzawai*)、テトラニカス・パシフィック (*Tetranychus pacificus*)、テトラニカス・ウルチカエ (*Tetranychus urticae*) がある。

40

動物寄食ダニ、例えばデルマニサス・ガリナエ (*Dermanyssus gallinae*)、ソブラテス・オビス (*Psoroptes ovis*)、サルコプテス・スカビエ (*Sarcoptes scabiei*) がある。

50

線虫類として例えば根状虫線虫には、例えばメロイドギーネ・ハブラ (*Meloidogyne hapla*)、メロイドギーネ・インコグニタ (*Meloidogyne incognita*)、メロイドギーネ・ジャバニカ (*Meloidogyne javanica*) が属する。

包囊形成線虫には、例えばグロボデラ・パリダ (*Globoderapallida*)、グロボデラ・ロストチーエンシス (*Globoderarostochiensis*)、ヘテロデラ・アベナエ (*Heterodera avenae*)、ヘテロデラ・グリシネス (*Heteroderaglycines*)、ヘテロデラ・シャツティー (*Heteroderaschatti*) がある。

幹および葉線虫には、例えばアングイナ・トリティシ (*Anguinatritici*) 10  
、アフエレンコイデス・ベセイ (*Aphelenchoides besseyi*)、ジチレンカス・アングスタス (*Ditylenchus angustus*)、ジチレンカス・ディプサシ (*Ditylenchus dipsaci*) がある

移動型内部寄生および半寄生線虫類たとえばヘリオコチレンカス・マルチシンクタス (*Helicocotylenchus multicinctus*)、ヒルスマニエラ・オリザエ (*Hirschmanniella oryzae*)、ホプロライムス類 (*Hoplolaimus* spp.)、ロチレンカス・レインフォルミス (*Rotylenchus reinformis*)、スクテロネマ・ブラディス (*Scutellonema brodys*)、プラチーレンカス・ブラキュラス (*Pratylenchus brachyurus*)、プラチーレンカス・ペネトランス (*Pratylenchus penetrans*)、プラチーレンカス・ファラックス (*Pratylenchus fallax*)、プラチーレンカス・バルナスイー (*Pratylenchus vulnus*)、チレンクリス・セミペネトランス (*Tylenchulus semipenetrans*) がある。 20

更にロンジドラス類 (*Longidorus* spp.) にはラドフォラス・シミリス (*Radopholus similis*)、ロチレンカス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、トリコドラス・クリステイ (*Trichodorus christei*)、トリコドラス・ビルリファルス (*Trichodruss viruliferus*)、キシフィネマ・インデックス (*Xiphinema index*)、キシフィネマ・メディテラネウス (*Xiphinema mediterraneum*) 30  
が属する。

化合物 I は単独、その調製物の形態、またはこれから調製される使用形で、例えば直接的に噴霧可能な溶液、粉末、懸濁液、分散液、ペースト、ダスト剤、散布剤又は顆粒の形で噴霧、ミスト法、ダスト法、散布法又は注入法によって適用することができる。使用形態は、完全に使用目的に基づいて決定される。いずれの場合にも、本発明の有効物質の可能な限りの微細分が保証されるべきである。

化合物 I の一部は、殺菌剤として組織的效果を示し、広い範囲にわたる植物病原菌、ことに子囊菌類、不完全菌類、ヒゲかび、担子菌類に対する葉面、土壌殺菌剤として使用し得る。

この殺菌剤混合物は、種々の栽培植物、例えば綿花、野菜類、例えばきゅうり、豆、かぼ 40  
ちゃ)、大麦、牧草、からす麦、コーヒー豆、トウモロコシ、果樹、稲、ライ麦、大豆、ぶどう、コムギ、観賞植物、さとうきび、その他の多くの植物種子に対する他種類の金の防除のために重要である。

化合物 I は次のような植物病の防除に特に適している。

穀物類のエリシペ・グラミニス (*Erysiphe graminis*; うどん粉病)、  
ウリ科のエリシペ・キコラケアラム (*Erysiphe cichoracearum*) 及び  
スフェロテカ・フリギネア (*Sphaerotheca fuliginea*)、  
リンゴのポドスフェラ・ロイコトリカ (*Podosphaera leucotricha*)、

ブドウのウンキヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*)、

穀物類のブッキニア (*Puccinia*) 種、  
 ワタ及びシバのリゾクトニア種 (*Rhizoctonia*)、  
 穀物類及びサトウキビのウスチラゴ (*Ustilago*) 種、  
 リンゴのペンツリア・イネクアリス (*Venturia inaequalis*; 腐敗病)、  
 穀物類のヘルミントスポリウム種 (*Helminthosporium*)、  
 コムギのセプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*)、  
 イチゴ及びブドウのボトリチス・キネレア (*Botrytis cinerea*; 灰色カビ)  
 )、  
 ナンキンマメのセルコスボラ・アラキジコラ (*Cercospora arachidicola*)、  
 コムギ及びオオムギのシュードケルコスボレラ・ヘルボトリコイデス (*Pseudocercospora ellaherpotrichoides*)、  
 イネのピリクラリア・オリザエ (*Pyricularia oryzae*)  
 ジャガイモ及びトマトのフィトピトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)、  
 種々の植物のフサリウム (*Fusarium*) 及びベルチキルリウム (*Verticillium*) 種、  
 ブドウのプラスモパラ・ピチコラ (*Plasmopara viticola*)、  
 果実及び野菜のアルテルナリア (*Alternaria*) 種。  
 例えばパエシロミセス・バリオッティから資材を保護するため、例えば木材、紙材および  
 繊維材料を保護するために新規の化合物を用いることも可能である。  
 新規物質は通常の製剤形、例えば溶液、エマルジョン、懸濁液、微粉末、粉末、ペースト  
 及び顆粒に加工することができる。適用形は全く使用目的次第であるが、いずれにせよ有  
 効物質の細分及び均一な分配が保証されるべきである。  
 製剤は公知方法で、例えば有効物質を溶剤及び/又は賦形剤で、場合により乳化剤及び分  
 散助剤を使用して増量することにより製造することができ、この際希釈剤として水を使用  
 する場合には、溶解助剤として別の有機溶剤を使用することができる。  
 このための助剤としては主に以下の物質が使用される。すなわち、  
 溶剤、例えば芳香族化合物 (例えばキシレン)、塩素化芳香族化合物 (例えばクロルベン  
 ゼン)、パラフィン (例えば石油留分)、アルコール (例えばメタノール、ブタノール)  
 ケトン (例えばシクロヘキサノン)、アミン (例えばエタノールアミン、ジメチルホルム  
 アミド) 及び水、  
 賦形剤、例えば天然岩石粉 (例えばカオリン、アルミナ、タルク、白亜)、合成岩石粉 (例  
 えば高分散性珪素、珪酸塩)、  
 乳化剤、例えば非イオン性及び陰イオン性乳化剤 (例えばポリオキシエチレン - 脂肪アル  
 コールエーテル、アルキルスルホナート及びアリアルスルホナート)、及び  
 分散剤、例えばリグニン - 亜硫酸廃液及びメチルセルロースが用いられる。  
 界面活性剤としては次のものが挙げられる。すなわち、リグニンスルホン酸、フェノール  
 スルホン酸、ナフタリンスルホン酸、及びジブチルナフタリンスルホン酸等の芳香族スル  
 ホン並びに脂肪酸の各アルカリ塩、アルカリ土類塩、アンモニウム塩、アルカリスルフォ  
 ナート、アルキルアリアルスルフォナート、アルキルスルファート、ラウリルエーテルス  
 ルファート、脂肪アルコールスルファート、並びに硫酸化ヘキサデカノール、ヘプタデカ  
 ノール及びオクタデカノールの塩、並びに脂肪アルコールグリコールエーテルの塩、スル  
 ホン化ナフタリン及びナフタリン誘導体とホルムアルデヒドとの縮合生成物、ナフタリン  
 或はナフタリンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドとの縮合生成物、ポリオキ  
 シエチレン - オクチルフェノールエーテル、エトキシル化イソオクチルフェノール、オク  
 チルフェノール、ノニルフェノール、アルキルフェノールポリグリコールエーテル、トリ  
 ブチルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリアルポリエーテルアルコール、イ  
 ソトリデシルアルコール、脂肪アルコールエチレンオキシド - 縮合物、エトキシル化ヒマ  
 シ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、又はポリオキシプロピレン、ラウリルアル

10

20

30

40

50

コールポリグリコールエーテルアセタート、ソルビットエステル、リグニン - 亜硫酸廃液及びメチルセルロース。

水性使用形は乳濁液濃縮物、ペースト、又は湿潤可能の粉末、水分散可能の粉末より水の添加により製造することができる。乳濁液、ペースト又は油分散液を製造するためには、物質をそのまま又は油又は溶剤中に溶解して、湿潤剤、接着剤、分散剤又は乳化剤により水中に均質に混合することができる。しかも有効物質、湿潤剤、接着剤、分散剤又は乳化剤及び場合により溶剤又は油よりなる濃縮物を製造することもでき、これは水にて希釈するのに適する。

粉末、散布剤及び振りかけ剤は有効物質と固状担体物質とを混合又は一緒に磨砕することにより製造することができる。

10

粒状体例えば被覆 -、含浸 - 及び均質粒状体は、有効物質を固状担体物質に結合することにより製造することができる。

固状担体物質は例えば鉱物土、例えばシリカゲル、珪酸、シリカゲル、珪酸塩、滑石、カオリン、石灰石、石灰、白亜、膠塊粒土、石灰質黄色粘土、粘土、白雲石、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、磨砕合成樹脂、肥料例えば硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素及び植物性生成物例えば穀物粉、樹皮、木材及びクルミ穀粉、セルロース粉末及び他の固状担体物質である。

本発明による薬剤は一般的に 0.0001 - 95 重量% の有効物質を含有する。

95 重量% を超過する有効物質を含む組成物を超低質量法 (ULV: Ultra-Low-Volume Verfahren) で用いると良好な結果を生ずる。この場合、有効物質は添加物を含まずに使用可能である。

20

殺菌剤として有効物質を使用する場合は、0.01 - 95 重量%、好ましくは 0.5 - 90 重量% の濃度で使用される。また、有効物質を殺虫剤として用いる場合は 0.0001 - 10 重量%、好ましくは 0.01 - 1 重量% で用いる。

有効物質は一般的に純度 90 ~ 100%、殊に 95 ~ 100% (NMR スペクトルによる) で使用される。

製剤例は以下の通りである。

I. 90 重量部の本発明の化合物 I を、N - メチル - 2 - ピロリドン 10 重量部と混合し、極めて小さい滴の形にて使用するのに適する溶液を得る。

II. 20 重量部の本発明の化合物 I を、アルキルベンゼン 80 重量部、エチレンオキシド 8 乃至 10 モルをオレイン酸 - N - モノエタノールアミド 1 モルに付加した付加生成物 10 重量部、ドデシルベンゼンスルホン酸のカルシウム塩 5 重量部及びエチレンオキシド 40 モルをヒマシ油 1 モルに付加した付加生成物 5 重量部よりなる混合物中に添加する。この組成物を水に微分散することにより分散液が得られる。

30

III. 10 重量部の本発明の化合物 I のシクロヘキサノン 40 重量部、イソブタノール 30 重量部、エチレンオキシド 7 モルをイソオクチルフェノール 1 モルに付加した付加生成物 20 重量部、エチレンオキシド 40 モルをヒマシ油 1 モルに付加した付加生成物 10 重量部よりなる混合物中の溶液を水に微分散して分散液を得る。

IV. 20 重量部の本発明の化合物 I を、シクロヘキサノール 25 重量部、沸点 210 乃至 280 の鉱油留分 65 重量部、及びエチレンオキシド 40 モルをヒマシ油 1 モルに付加した付加生成物 10 重量部よりなる混合物中に添加し、得られた組成物を水に微分散し、水性分散液を得る。

40

V. 20 重量部の本発明の化合物 I を、ジイソブチル - ナフタリン - スルホン酸のナトリウム塩 3 重量部、亜硫酸 - 廃液よりのリグニンスルホン酸のナトリウム塩 17 重量部、及び粉末状シリカゲル 60 重量部と混合し、ハンマーミル中において磨砕する。この混合物を水に微分散することにより噴霧液が得られる。

VI. 3 重量部の本発明の化合物 I を細粒状カオリン 97 重量部と密に混和し、有効物質 3 重量% を含有するダスト剤が得られる。

VII. 30 重量部の本発明の化合物 I を、粉末状シリカゲル 92 重量部、及びこのシリカゲルの表面上に吹きつけられた液状パラフィン 8 重量部よりなる混合物と密に混和し、

50

良好な接着性を有する有効物質の製剤が得られる。

V I I I . 4 0 重量部の本発明の化合物 I をフェノールスルホン酸 - 尿素 - ホルムアルデヒド - 縮合物のナトリウム塩 1 0 重量部、シリカゲル 2 重量部及び水 4 8 重量部と混和し、安定な水性分散液を得る。この分散液は更に水で希釈することができる。

I X . 2 0 重量部の本発明の化合物 I を、ドデシルベンゼンスルホン酸のカルシウム塩 2 重量部、脂肪アルコールポリグリコールエーテル 8 重量部、フェノールスルホン酸 - 尿素 - ホルムアルデヒド - 縮合物のナトリウム塩 2 重量部及びパラフィン系鉱油 6 8 重量部と混和し、安定な油状分散液を得る。

X . 1 0 重量部の本発明の化合物 I を、ジイソブチル - ナフタリン - スルホン酸のナトリウム塩 4 重量部、亜硫酸 - 廃液よりのリグニンスルホン酸のナトリウム塩 2 0 重量部、珪酸ゲル 3 8 重量部及びカオリン 3 8 重量部と十分に混和し、かつハンマーミル中において磨砕する。この混合物を水 1 0 0 0 0 重量部に細分布することにより有効物質 0 . 1 重量% を含有する噴霧液が得られる。

化合物 I を用いて、細菌または細菌による被害から保護されるべき種子、植物、資材または土壌を有効成分の細菌活性有効量で処理する。

化合物は資材、植物または種子が細菌により被害を受ける前または後に使用される。

有効物質の使用量は所望の効果に応じて、1ヘクタールあたり 0 . 0 2 - 3 k g 、好ましくは 0 . 1 - 1 k g とする。

種子の処理に際し、1 k g の種子に対して一般的に 0 . 0 0 1 - 5 0 g 、好ましくは 0 . 0 1 - 1 0 g の量の有効物質が必要とされる。

露天栽培地条件下における害虫を防除するための有効物質の使用量は、1ヘクタールあたり 0 . 0 2 - 1 0 k g 、好ましくは 0 . 1 - 2 . 0 k g である。

化合物 I は、単独でまたは他の除草剤または殺菌剤と、また更なる植物保護剤と組み合わせ、混合し、例えば殺害虫剤または植物細菌剤または殺バクテリア剤と共に施用することができる。苗栄養不足、希元素欠乏などの症状治癒のために肥料またはミネラル塩溶液と混合し得ることも重要である。

植物保護剤および肥料は本発明の薬剤に対して 1 : 1 0 - 1 0 : 1 の重量比で使用することが可能であり、必要に応じて使用直前に調製することが可能である(タンクミックス)。

殺菌剤または殺虫剤と混合することにより、殺菌作用範囲を拡大することが多い。本発明の化合物と併用可能な殺菌剤の例を以下に挙げる。この例は組み合わせの可能性を述べるためのものであって、使用に関して制限を加えるためのものではない。

#### 硫黄

ジチオカルバメート及びその誘導体、例えば

鉄ジメチルジチオカルバメート、

亜鉛ジメチルジチオカルバメート、

亜鉛エチレンビスジチオカルバメート、

マンガンエチレンビスジチオカルバメート、

マンガン - 亜鉛 - エチレンジアミン - ビス - ジチオカルバメート、

テトラメチルチウラムジスルフィド、

亜鉛 - ( N , N - エチレン - ビス - ジチオカルバメート ) のアンモニア錯化合物、

亜鉛 - ( N , N - プロピレン - ビス - ジチオカルバメート ) のアンモニア錯化合物、

亜鉛 - ( N , N - プロピレン - ビス - ジチオカルバメート ) 、

N ' N - ポリプロピレン - ビス - ( チオカルバモイル ) - ジスルフィド、

ニトロ誘導体、例えば

ジニトロ - ( 1 - メチルヘプチル ) - フェニルクロトナート、

2 - s e c - プチル - 4 , 6 - ジニトロフェニル - 3 , 3 - ジメチルアクリレート、

2 - s e c - プチル - 4 , 6 - ジニトロフェニル - イソプロピルカルボナート、

5 - ニトロ - イソフタル酸 - ジ - イソプロピルエステル、

複素環式物質、例えば

2 - ヘプタデシル - 2 - イミダゾリン - アセテート、

10

20

30

40

50

- 2, 4 - ジクロル - 6 - ( o - クロルアニリノ ) - s - トリアジン、  
 O, O - ジエチル - フタルイミドホスホノチオエート、  
 5 - アミノ - 1 - [ ビス - ( ジメチルアミノ ) - ホスフィニル ] - 3 - フェニル - 1, 2, 4 - トリアゾール、  
 2, 3 - ジシアノ - 1, 4 - ジチオアントラキノン、  
 2 - チオ - 1, 3 - ジチオ - ( 4, 5 - b ) - キノキサリン、  
 1 - ( ブチルカルバモイル ) - 2 - ベンゾイミダゾール - カルバミン酸メチルエステル、  
 2 - メトキシカルボニルアミノ - ベンゾイミダゾール、  
 2 - ( フリル - ( 2 ) ) - ベンゾイミダゾール、  
 2 - ( チアゾリル - ( 4 ) ) - ベンゾイミダゾール、  
 N - ( 1, 1, 2, 2 - テトラクロルエチルチオ ) - テトラヒドロフタルイミド、  
 N - トリクロルメチルチオ - テトラヒドロフタルイミド、  
 N - トリクロルメチルチオ - フタルイミド、  
 N - ジクロルフルオルメチルチオ - N , N - ジメチル - N - フェニル - 硫酸ジアミド、  
 5 - エトキシ - 3 - トリクロルメチル - 1, 2, 3 - チアジアゾール、  
 2 - ロダンメチルチオベンゾチアゾール、  
 1, 4 - ジクロル - 2, 5 - ジメトキシベンゾール、  
 4 - ( 2 - クロルフェニルヒドラゾノ ) - 3 - メチル - 5 - イソキサゾロン、  
 ピリジン - 2 - チオ - 1 - オキサイド、  
 8 - ヒドロキシキノリン又はその銅塩、  
 2, 3 - ジヒドロ - 5 - カルボキシアニリド - 6 - メチル - 1, 4 - オキサチイン、  
 2, 3 - ジヒドロ - 5 - カルボキシアニリド - 6 - メチル - 1, 4 - オキサチイン - 4, 4 - ジオキサイド、  
 2 - メチル - 5, 6 - ジヒドロ - 4 H - ピラン - 3 - カルボン酸アニリド、  
 2 - メチル - フラン - 3 - カルボン酸アニリド、  
 2, 5 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸アニリド、  
 2, 4, 5 - トリメチル - フラン - 3 - カルボン酸アニリド、  
 2, 5 - ジメチルフラン - 3 - カルボン酸シクロヘキシルアミド、  
 N - シクロヘキシル - N - メトキシ - 2, 5 - ジメチル - フラン - 3 - カルボン酸アミド、  
 2 - メチル - 安息香酸 - アニリド、  
 2 - ヨード - 安息香酸 - アニリド、  
 N - ホルミル - N - モルホリン - 2, 2, 2 - トリクロルエチルアセタール、  
 ピペラジン - 1, 4 - ジイルビス - ( 1 - ( 2, 2, 2 - トリクロル - エチル ) - ホルムアミド )、  
 1 - ( 3, 4 - ジクロルアニリノ ) - 1 - ホルミルアミノ - 2, 2, 2 - トリクロルエタン、  
 2, 6 - ジメチル - N - トリデシル - モルホリン又はその塩、  
 2, 6 - ジメチル - N - シクロドデシル - モルホリン又はその塩、  
 N - [ 3 - ( p - t e r t - ブチルフェニル ) - 2 - メチルプロピル ] - シス - 2, 6 - ジメチルモルホリン、  
 N - [ 3 - ( p - t e r t - ブチルフェニル ) - 2 - メチルプロピル ] - ピペリジン、  
 1 - [ 2 - ( 2, 4 - ジクロルフェニル ) - 4 - エチル - 1, 3 - ジオキサラン - 2 - イル - エチル ] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、  
 1 - [ 2 - ( 2, 4 - ジクロルフェニル ) - 4 - n - プロピル - 1, 3 - ジオキサラン - 2 - イル - エチル ] - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、  
 N - ( n - プロピル ) - N - ( 2, 4, 6 - トリクロルフェノキシエチル ) - N - イミダゾール - イル - 尿素、  
 1 - ( 4 - クロルフェノキシ ) - 3, 3 - ジメチル - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾ

10

20

30

40

50

ール - 1 - イル) - 2 - ブタノン、  
 1 - ( 4 - クロルフェノキシ) - 3 , 3 - ジメチル - 1 - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾ  
 ール - 1 - イル) - 2 - ブタノール  
 - ( 2 - クロルフェニル) - ( 4 - クロルフェニル) - 5 - ピリミジン - メタノ  
 ール、  
 5 - ブチル - 2 - ジメチルアミノ - 4 - ヒドロキシ - 6 - メチル - ピリミジン、  
 ビス - ( p - クロルフェニル) - 3 - ピリジンメタノール、  
 1 , 2 - ビス - ( 3 - エトキシカルボニル - 2 - チオウレイド) - ベンゾール、  
 1 , 2 - ビス - ( 3 - メトキシカルボニル - 2 - チオウレイド) - ベンゾール及び他の殺  
 菌剤、例えば 10  
 ドデシルグアニジンアセテート、  
 3 - ( 3 - ( 3 , 5 - ジメチル - 2 - オキシシクロヘキシル) - 2 - ヒドロキシエチル)  
 - グルタルイミド、  
 ヘキサクロルベンゾール、  
 DL - メチル - N - ( 2 , 6 - ジメチル - フェニル) - N - フロイル ( 2 ) - アラニナー  
 ト、  
 DL - N - ( 2 , 6 - ジメチル - フェニル) - N - ( 2 - メトキシアセチル) - アラニ  
 ン - メチルエステル、  
 N - ( 2 , 6 - ジメチルフェニル) - N - クロルアセチル - D , L - 2 - アミノブチロラ  
 クトン、 20  
 DL - N - ( 2 , 6 - ジメチルフェニル) - N - ( フェニルアセチル) - アラニンメチル  
 エステル、  
 5 - メチル - 5 - ピニル - 3 - ( 3 , 5 - ジクロルフェニル) - 2 , 4 - ジオキソ - 1 ,  
 3 - オキサゾリジン、  
 3 - ( 3 , 5 - ジクロルフェニル) - 5 - メチル - 5 - メトキシメチル - 1 , 3 - オキサ  
 ザリジン - 2 , 4 - ジオン、  
 3 - ( 3 , 5 - ジクロルフェニル) - 1 - イソプロピルカルバモイルヒダントイン、  
 N - ( 3 , 5 - ジクロルフェニル) - 1 , 2 - ジメチルシクロプロパン - 1 , 2 - ジカル  
 ボン酸イミド、  
 2 - シアノ - [ N - ( エチルアミノカルボニル) - 2 - メトキシイミノ] - アセトアミノ 30  
 、  
 1 - [ 2 - ( 2 , 4 - ジクロルフェニル) - ペンチル] - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾ  
 ール、  
 2 , 4 - ジフルオル - ( 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾリル - 1 - メチル) - ベンゾヒ  
 ドリルアルコール、  
 N - ( 3 - クロル - 2 , 6 - ジニトロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル) - 5 - トリフ  
 ルオルメチル - 3 - クロル - 2 - アミノピリジン、  
 1 - ( ( ビス - ( 4 - フルオルフェニル) - メチルシニル) - メチル) - 1 H - 1 , 2 ,  
 4 - トリアゾール。

#### 合成実施例

以下の合成実施例において反覆される処理は、式 ( I ) で表わされるさらに他の化合物を  
 得るための出発化合物の転化に使用された。このようにして得られた目的化合物 ( I ) を  
 その物性と共に下表に掲記した。 40

( 1 ) N - ( 2 - ( N - ( p - メチルフェニル) - 4 - クロロピラゾリル - 3 - オ  
 キシメチル) - フェニル) - N - メトキシカルバミン酸メチルエステル ( 表中の番号 1 9  
 )

1 . 7 g の N - ( 2 - プロモメチルフェニル) - N - メトキシカルバミン酸メチルエス  
 テル ( 純度ほぼ 7 5 % , 約 4 . 6 ミリモル、WO 9 3 / 1 5 0 4 6 参照)、1 g ( 4 . 8 ミ  
 リモル) の N - ( p - メチルフェニル) - 4 - クロロ - 3 - ヒドロキシピラゾールおよび  
 1 g ( 7 . 2 ミリモル) の K<sub>2</sub>C O<sub>3</sub> から成る混合物を、1 5 ミリリットルのジメチルホル 50

ムアミド中において、室温で1夜攪拌した。次いで、この反応混合物を水で希釈し、水性相をメチル - t - ブチルエーテルで3回抽出した。この合併有機相を水で抽出し、MgSO<sub>4</sub>で乾燥し、濃縮した。この残渣を、メチレンクロリドを使用してAl<sub>2</sub>O<sub>3</sub>クロマトグラフィーおよびシクロヘキサン/酢酸エステル混合液を使用してシリカゲルクロマトグラフィーで処理した。これにより1.4g(68%)の表記化合物が、淡黄色油状体として得られた。

<sup>1</sup>H-NMR(CDC1<sub>3</sub>)、 $\delta$  = 7.75(s, 1H、ピラゾリル)、7.70(m, 1H、フェニル)、7.5(m, 5H、フェニル)、7.2(d, 2H、フェニル)、5.4(s, 2H、OCH<sub>2</sub>)、3.75、3.8(2s、それぞれ3H、2XOCH<sub>3</sub>)、2.35(s, 3H、CH<sub>3</sub>) ppm。

10

(2) N - メチル - N - メトキシ - N - (2 - ((N - ピラジニル) - ピラゾリル - 3 - オキシメチル) - フェニル) - 尿素 (表中の番号32)

(a) N - ヒドロキシ - N - (2 - メチルフェニル) - カルバミン酸フェニルエステル 350gのN - (2 - メチルフェニル) - ヒドロキシルアミン(純度約80%、2.3モル、Anm. Chem. 316(1901)、278におけるバンバーガーらの方法と同様に製造)と、286.8g(3.4モル)のNaHCO<sub>3</sub>の混合物に、700mlのCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>中において、-10の温度で烈しく攪拌しつつ、447g(2.85モル)のフェニルクロリドホルミートを添加し、この-10で約1時間攪拌してから、600mlの水を滴下、添加した。これにより反応混合物の温度は5-10に上昇し、烈しいガス生起がもたらされる。水性相を分離し、CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>でさらに1回抽出し、合併有機相を水で抽出し、MgSO<sub>4</sub>で乾燥し、濃縮した。残渣を、シクロヘキサンで晶出させた。これにより407g(72%)の表記化合物を、無色固体として得た。

20

<sup>1</sup>H-NMR(CDC1<sub>3</sub>)、 $\delta$  = 8.6(s、広幅、1H、OH)、7.07-7.4(m、9H、フェニル)、2.4(s、3H、CH<sub>3</sub>) ppm。

(b) N - メトキシ - N - (2 - メチルフェニル)カルバミン酸フェニルエステル 407g(1.6モル)のN - ヒドロキシ - N - (2 - メチルフェニル) - カルバミン酸フェニルエステル(実施例2a)と、277g(2.0モル)のK<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>の700mlのCH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>中における混合物に、211g(1.67モル)のジメチルスルファートを滴下、添加した。これにより、反応混合物の温度は約40に上昇した。室温で1夜攪拌し、次いで反応混合物を珪藻土で濾過し、濾液を、NH<sub>3</sub>溶液と水で洗浄し、MgSO<sub>4</sub>で乾燥し、濃縮した。残渣をヘキサンで晶出させた。これにより324g(75%)の表記化合物が無色の固体として得られた。

30

(c) N - メトキシ - N - (2 - ブロムメチルフェニル) - カルバミン酸フェニルエステル

1lのCCl<sub>4</sub>中、324g(1.3モル)のN - メトキシ - N - (2 - メチルフェニル) - カルバミン酸フェニルエステル(実施例2b)、258g(1.45モル)のN - ブロムスクシンイミドおよび1gのアゾイソブチロジニトリルの混合物を、約6時間300W紫外線ランプで照射し、これにより反応混合物温度は、沸点まで上昇した。次いで、13gのN - スクシンイミドを添加し、照射をさらに8時間継続した。反応混合物を室温まで冷却し、析出スクシンイミドを濾別し、有機相を水で抽出し、MgSO<sub>4</sub>で乾燥し、濃縮した。残渣をヘキサンで晶出させ、300g(68%)の表記化合物をベージュ色の固体として得た。

40

(d) N - メトキシ - N - (2 - ((N - ピラジニル) - 3 - オキシメチル) - フェニル) - カルバミン酸フェニルエステル

10mlのDMF中における、3.1g(9.2ミリモル)のN - メトキシ - N - (2 - ブロムメチルフェニル) - カルバミン酸フェニルエステル(実施例2c)、1.5g(9.2ミリモル)のN - ピラジニル - 3 - ヒドロキシピラゾールおよび2g(14.5ミリモル)のK<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>の混合物を、室温において1夜攪拌した。次いで反応混合物を水で希釈し、メチル - t - ブチルエーテルで3回抽出した。合併有機相を水で抽出し、MgSO<sub>4</sub>で乾燥し、濃縮した。残渣をカラムクロマトグラフィー(シクロヘキサン/酢酸エステル混

50



合液)で精製して2.4 g (63%)の表記混合物を、黄色油状体として得た。

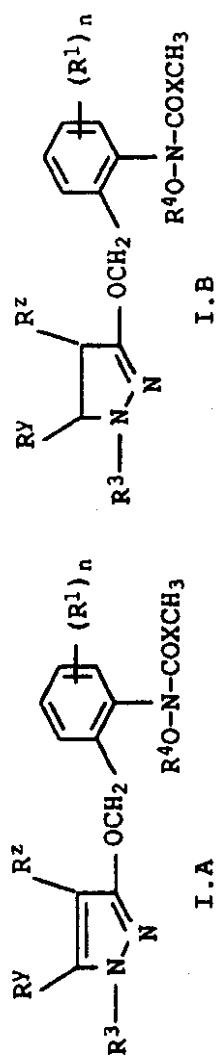
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )、 $\delta$  = 9.15 (d, 1H、ピラゾリル)、8.3 (m, 3H、ピラジニル)、7.7 (m, 1H、フェニル)、7.1 - 7.6 (m, 8H、フェニル)、6.0 (1H、ピラゾリル)、5.5 (s, 2H、 $\text{OCH}_2$ )、3.85 (s, 3H、 $\text{OCH}_3$ ) ppm。

(e) N-メチル-N-メトキシ-N-(2-(N-ピラジニル)-ピラゾリル-3-オキシメチル)-フェニル)-尿素

1.9 g (4.6ミリモル)のN-メトキシ-N-(2-(N-ピラジニル)-ピラゾリル-3-オキシムエチル)-フェニル)-カルバミン酸フェニルエステル(実施例2d)と、15mlのメチルアミン水溶液(40%濃度)を、1夜室温で撹拌した。次いで水を添加し、水性相をメチレンクロリドで2回抽出し、合併有機相を水で洗浄し、 $\text{MgSO}_4$ で乾燥し、濃縮した。残渣をシクロヘキサンで晶出させて、0.9 g (55%)の表記化合物を、ベージュ色の固体として得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )、 $\delta$  = 9.15 (d, 1H、ピラゾリル)、8.3 (m, 3H、ピラジニル)、7.6 (m, 1H、フェニル)、7.35 (m, 3H、フェニル)、6.0 (m, 2H、NH、ピラジニル)、5.45 (s, 2H、 $\text{OCH}_2$ )、3.7 (s, 3H、 $\text{OCH}_3$ )、2.9 (d, 3H、 $\text{NCH}_3$ ) ppm。

表



No.	構造	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>Y</sup>	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	融点 (°C), IR [cm <sup>-1</sup> ]
1	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1737, 1600, 1493, 1480, 1456, 1358, 1332, 755
2	I.A	H	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1737, 1547, 1503, 1480, 1457, 1441, 1350, 1094, 1030, 936
3	I.A	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1739, 1547, 1492, 1475, 1457, 1440, 1356, 1107, 1058, 1027
4	I.A	H	H	H	2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1739, 1710, 1542, 1482, 1457, 1440, 1358, 1052, 1030, 763
5	I.A	H	H	H	3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1738, 1593, 1545, 1494, 1483, 1457, 1441, 1357, 1056, 1032
6	I.A	H	H	H	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1738, 1544, 1519, 1482, 1456, 1440, 1393, 1358, 1243, 1031,

10

20

30

40

No.	構造	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>y</sup>	R <sup>z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	融点 (°C), IR [cm <sup>-1</sup> ]
7	I.A	H	H	H	2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1739, 1710, 1546, 1495, 1476, 1453, 1441, 1358, 1027, 757
8	I.A	H	H	H	3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1736, 1597, 1548, 1495, 1476, 1456, 1440, 1357, 1101, 771
9	I.A	H	H	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1727, 1543, 1464, 1445, 1364, 1348, 791, 785, 749,
10	I.A	H	H	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	120
11	I.A	H	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>		O	1737, 1710, 1547, 1489, 1471, 1456, 1437, 1346, 1096, 1027
12	I.A	H	H	H	3,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	85
13	I.A	H	H	H	2-CH <sub>3</sub> , 4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1738, 1710, 1543, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1100, 940
14	I.A	H	H	H	3-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1721, 1558, 1459, 1441, 1368, 1333, 1121, 1067, 793, 764
15	I.A	H	H	H	4-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1737, 1541, 1517, 1483, 1457, 1442, 1359, 1250, 1056, 1032
16	I.A	H	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1739, 1710, 1560, 1504, 1484, 1456, 1440, 1380, 1359, 760
17	I.A	H	H	CH <sub>3</sub> O-CO	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1720, 1702, 1570, 1540, 1446, 1372, 1357, 1285, 1119, 751
18	I.A	H	H	H	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1737, 1546, 1516, 1482, 1457, 1440, 1359, 1233, 1031, 835

No.	構造	R <sup>1n</sup>	RY	R <sup>Z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	融点 (°C), IR [cm <sup>-1</sup> ]
19	I.A	H	H	Cl	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1738, 1554, 1509, 1456, 1440, 1358, 1253, 1118, 940, 760
20	I.A	3-F	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	90
21	I.A	5-F	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	109
22	I.A	H	H	H	3-OCH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1737, 1607, 1597, 1545, 1499, 1482, 1472, 1440, 1358
23	I.A	H	H	Cl	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	110
24	I.A	H	CF <sub>3</sub>	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1739, 1507, 1486, 1457, 1359, 1250, 1190, 1139, 1109, 1092
25	I.A	H	CH <sub>3</sub>	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1738, 1710, 1567, 1561, 1500, 1484, 1456, 1440, 1359, 1104
26	I.A	H	H	Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1729, 1553, 1511, 1497, 1438, 1356, 1332, 1265, 1122, 1112
27	I.A	H	H	H	3,4-(OCF <sub>2</sub> O)-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	0	97
28	I.A	H	H	H	2-ピリジル	CH <sub>3</sub>	0	85
29	I.A	H	H	H	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	CH <sub>3</sub>	0	81
30	I.A	H	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>	0	87
31	I.B	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	0	1739, 1639, 1599, 1501, 1456, 1439, 1411, 1354, 1252, 752
32	I.A	H	H	H	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>	NH	145
33	I.A	H	H	NO <sub>2</sub>	5-CF <sub>3</sub> -ピリジル-2	CH <sub>3</sub>	0	126

No.	構造	R <sup>1</sup> <sub>n</sub>	R <sup>v</sup>	R <sup>z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	融点 (°C), IR [cm <sup>-1</sup> ]
34	I.A	H	CH <sub>3</sub>	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1738, 1561, 1500, 1456, 1440, 1359, 1094, 1010, 764
35	I.A	H	H	H	6-Cl-ピリダジン-3-イル	CH <sub>3</sub>	O	135
36	I.A	H	H	H	5-Cl-ピリジン-2-イル	CH <sub>3</sub>	O	77
37	I.A	H	H	CF <sub>3</sub>	シクロヘキシル	CH <sub>3</sub>	O	1743, 1496, 1456, 1441, 1359, 1272, 1262, 1176, 1124, 1029
38	I.A	H	H	Cl	5-Cl-ピリジン-2-イル	CH <sub>3</sub>	O	92
39	I.A	H	H <sub>3</sub> CO <sub>2</sub> C	H	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	71
40	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	O	1718, 1600, 1545, 1507, 1481, 1458, 1399, 1359, 1032, 757
41	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	1675, 1600, 1545, 1508, 1479, 1462, 1399, 1355, 1054, 756
42	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	-	1680, 1600, 1545, 1507, 1480, 1456, 1359, 1056, 1032, 758
43	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	NH	1653, 1601, 1545, 1707, 1479, 1454, 1414, 1398, 1355, 755
44	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub>	1678, 1600, 1545, 1480, 1456, 1394, 1378, 1358, 1055, 756
45	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	-	1643, 1622, 1601, 1544, 1493, 1480, 1368, 1027, 759, 745
46	I.A	H	H	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	CH <sub>2</sub>	1619, 1600, 1550, 1495, 1482, 1462, 1454, 1358, 765, 753
47	I.A	H	H	H	2,4-Cl <sub>2</sub> -フェニル	CH <sub>3</sub>	NH	130

No.	構造	R <sup>1n</sup>	R <sup>v</sup>	R <sup>z</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	融点 (°C), IR [cm <sup>-1</sup> ]
48	I.A	H	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	O	105
49	I.A	H	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	NH	1653, 1546, 1503, 1480, 1455, 1426, 1390, 1357, 1094, 1071
50	I.A	H	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	NH	1675, 1546, 1503, 1479, 1457, 1425, 1389, 1355, 936, 829
51	I.A	H	H	H	CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1737, 1709, 1537, 1488, 1456, 1439, 1359, 1325, 1032, 733
52	I.A	H	H	H	CH <sub>2</sub> -[4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ]	CH <sub>3</sub>	O	1735, 1709, 1538, 1492, 1456, 1439, 1358, 1323, 1096, 761
53	I.A	H	H	H	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	92
54	I.A	H	H	Cl	2-ピラジニル	CH <sub>3</sub>	O	114
55	I.B	H	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1740, 1639, 1599, 1495, 1456, 1439, 1415, 1355, 1251, 1092
56	I.A	H	H	H	2-Cl, 4-F-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O	1737, 1547, 1505, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1258, 1028

#### 菌類に対する使用実施例

化合物 (I) の殺菌効果を、以下の実験例により実証する。

70重量%のシクロヘキサン、20重量%のNekani1 R LN (Lutensol R AP6、エトキシル化アルキルフェノールを主体とする、乳化、分散作用を有する架橋剤) および10重量%のEmulphor R EL (Emulan R EL、

10

20

30

40

50

エトキシ化脂肪アルコールを主体とする乳化剤)から成る混合液中における有効物質の乳濁液を調製し、これを水で所望濃度に希釈した。

#### Puccinia reconditaに対する効果

小麦菌(カンツラー種)の葉面を、赤さび病原菌(*Puccinia recondita*)の胞子に感染させ、この被験植物を、20-22℃、相対湿度90-95%の条件下に培養し、次いで、有効物質調剤(有効物質63ppm)で処理した。さらに8日間、20-22℃、相対湿度65-70%の条件下に置いてから、菌の成長度を視覚的に観察し、判定した。

この実験において、本発明による化合物2-6、8、11-15、18-20、22、23および26-29で処理された被験植物における病変まん延度は5%より低かったが、公知のPCT特願WO-A、93/15046号公報における化合物(表7、実施例8)で処理した被験植物のそれは25%に達した。なお有効物質で処理されなかった対照被験植物の場合は70%に達した。

なお、対応する実験において、本発明による番号1(表参照)の化合物の250ppm調剤で処理された被験植物まん延度は3%であったが、上記公知化合物(公表表7、番号21)の同じ250ppm調剤で処理された被験植物は、非処理植物と同様に70%のまん延度を示した。

さらに他の対応する実験において、本発明による番号1-8、10-16、18-20、22、23、27-30、34、36-38、41、47および51-56の250ppm調剤で処理された植物は、15%より低い結果を示したのに対して、上記公知化合物(表7、番号71)で処理された植物は、被処理植物と同様に70%に至る結果を示した。

#### Plasmopara viticolaに対する効果

鉢植ぶどう(ミュラー、トゥールガウ種)に液滴のしたたり落ちる程度まで有効物質調剤液を噴霧し、8日後に*Plasmopara viticola*(ツユカビ病原菌)の膨潤遊走子をこの被験植物に施こし、5日間、20-30℃、高湿度条件下に培養した。観察、判定前、さらに16時間、高湿状態下に培養した。判定は視覚的に行なった。

本発明化合物、1-3、5、6、13、15および29で処理した植物の病変範囲は10%より低かったが、前述したヨーロッパ特願公開公報(表7、実施例8)の有効物質で処理した場合には25%、非処理植物の場合には70%に達した。

#### Botrytis cinerea(ボトリチス病原菌、ハイイロカビ菌)に対する効果

4-5葉のピーマン苗(ノイズィードレル、イデアル、エリーテ種)を、有効物質調剤液(500ppm濃度)で液がしたたり落ちる程度で噴霧処理し、乾燥後、ボトリチス病原菌の膨潤分生子を噴霧し、22-24℃、高湿度条件下に5日間培養してから、判定を視覚的に行なった。

この実験の結果、本発明化合物で処理した被験植物には全く病変が認められなかったのに対して、上記公報から公知の化合物(表7、実施例21)で処理した被験植物には70%までの、非処理植物には80%までの病変が認められた。

#### Erysiphe graminis var. triticiに対する効果

小麦(フリーゴルト種)の苗葉面をまず有効物質調剤液(250ppm濃度)で処理し、約24時間後に、小麦ウドンコカビ病原菌(*Erysiphe graminis var. tritici*)の胞子で処理した。次いでこの被験植物を7日間20-22℃、相対湿度75-80%で培養した。次いで病原菌まん延度を視覚的に判定した。

この実験の結果、本発明による番号1の化合物(I)で処理した被験化合物には全く菌のまん延が認められなかったのに対して、上記公知物質(公報中の表7、番号21)で処理した植物には25%までの、非処理植物には70%までのまん延度を認めた。

対応する実験において、本発明化合物1-7、10、13、14、18-20、27-29、34、36、41、50および56の調剤液(250ppm濃度)で処理した被験植物では25%より低いまん延度を示したに止まるが、上記公知化合物(公報の表7、番号21)で処理した植物には65%、非処理植物には70%に達するまん延度が観察された。

。

10

20

30

40

50

害虫に対する効果

本発明化合物（I）の害虫に対する効果を以下の実験で確認した。

有効物質調剤を、

（a）0.1%濃度のアセトン溶液として、

（b）70重量%のシクロヘキサノン、20重量%のNekaniil R LN（Lutensol R AP6、エトキシ化アルキルフェノールを主体とする、乳化分散効果を示す架橋剤）および10重量%のEmulphor R EL（Emulan R EL、エトキシ化脂肪アルコールを主体とする乳化剤）から成る混合液中における10%濃度乳濁液として、それぞれ調製し、（a）の場合にはアセトンで、（b）の場合には水で、それぞれ所望濃度に希釈した。

実験の結果、低濃度の場合にも、非処理の対照実験に対して、80 - 100%の発生抑止ないし致死効果を示した（増量効果ないし最少限濃度効果）。



## フロントページの続き

- (72)発明者 キルストゲン, ラインハルト  
ドイツ国、D - 6 7 4 3 4、ノイシュタット、エルケンブレヒトシュトラーセ、23エー
- (72)発明者 オーベルドルフ, クラウス  
ドイツ国、D - 6 9 1 1 7、ハイデルベルク、ビーネンシュトラーセ、3
- (72)発明者 レール, フランツ  
ドイツ国、D - 6 7 1 0 5、シファーシュタット、ゼバステアアン - クナイプ - シュトラーセ、17
- (72)発明者 ゲツ, ノルベルト  
ドイツ国、D - 6 7 5 4 7、ヴォルムス、シェファーシュトラーセ、25
- (72)発明者 ザウター, フーベルト  
ドイツ国、D - 6 8 1 6 7、マンハイム、ネカルプロメナーデ、20
- (72)発明者 ロレンツ, ギーゼラ  
ドイツ国、D - 6 7 4 3 4、ハムバッハ、エルレンヴェーク、13
- (72)発明者 アーママン, エーベルハルト  
ドイツ国、D - 6 4 6 4 6、ヘペンハイム、フォン - ガーゲルン - シュトラーセ、2

審査官 渡辺 仁

(56)参考文献 国際公開第93/015046(WO, A1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D231/06

C07D231/20

CA(STN)

CAplus(STN)

REGISTRY(STN)