

(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 特 許 公 報(B2)

(11) 特許番号

特許第6685280号  
(P6685280)

(45) 発行日 令和2年4月22日(2020.4.22)

(24) 登録日 令和2年4月2日(2020.4.2)

(51) Int.Cl.

F 1

<b>C07D 471/04</b>	<b>(2006.01)</b>	C07D 471/04	1 O 6 H
<b>C07D 487/04</b>	<b>(2006.01)</b>	C07D 487/04	C S P
<b>A01N 43/90</b>	<b>(2006.01)</b>	C07D 487/04	1 4 1
<b>A01P 7/02</b>	<b>(2006.01)</b>	A01N 43/90	1 O 4
<b>A01P 7/04</b>	<b>(2006.01)</b>	A01N 43/90	1 O 5

請求項の数 8 (全 112 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2017-506756 (P2017-506756)
(86) (22) 出願日	平成27年7月31日 (2015.7.31)
(65) 公表番号	特表2017-523997 (P2017-523997A)
(43) 公表日	平成29年8月24日 (2017.8.24)
(86) 國際出願番号	PCT/EP2015/067677
(87) 國際公開番号	W02016/020286
(87) 國際公開日	平成28年2月11日 (2016.2.11)
審査請求日	平成30年7月30日 (2018.7.30)
(31) 優先権主張番号	14180130.8
(32) 優先日	平成26年8月7日 (2014.8.7)
(33) 優先権主張国・地域又は機関	歐州特許庁 (EP)
(31) 優先権主張番号	14186737.4
(32) 優先日	平成26年9月29日 (2014.9.29)
(33) 優先権主張国・地域又は機関	歐州特許庁 (EP)

(73) 特許権者	300091441 シンジエンタ パーティシペーションズ アーゲー
	スイス国 4 O 5 8 バーゼル、シュバルツ バルトアレー 2 1 5
(74) 代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(74) 代理人	100088694 弁理士 弟子丸 健
(74) 代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(74) 代理人	100084663 弁理士 稲田 篤
(74) 代理人	100093300 弁理士 浅井 賢治

最終頁に続く

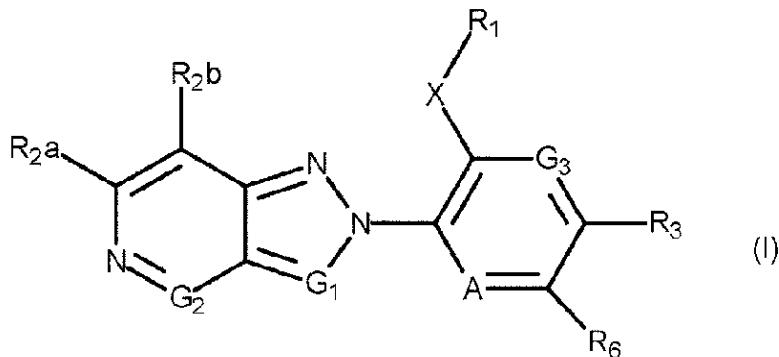
(54) 【発明の名称】硫黄含有置換基を有する殺有害生物的に活性な複素環式誘導体

## (57) 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 I の化合物

## 【化 1】



(式中、

A が、 C H、 N または C R<sub>7</sub> であり； R<sub>7</sub> が、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル

、シアノ、ニトロまたはハロゲンであり；

X が、 S、 SO または SO<sub>2</sub> であり；

20

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであるか、またハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；または

R<sub>1</sub>が、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；または

R<sub>1</sub>が、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルであり；

R<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルであるか、またはヒドロキシル、メトキシおよびシアノからなる群から選択される1つまたは2つの置換基で置換されているC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；または

R<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>が、互いに独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、または-C(O)(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル)であり；または

R<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>が、互いに独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換ができるC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり、または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または二置換されているC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；または

R<sub>3</sub>が、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、および-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換ができるフェニルであり；または

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル、またはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルおよび-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換ができるピリミジニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>

ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルおよび-C(=O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されていることができるピリジニルであり；または

R<sub>3</sub>が、置換基G<sub>3</sub>を含有する環に窒素原子を介して連結された5員～6員の、芳香族の、部分的に飽和したまたは完全に飽和した環系であり、前記環系は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、-C(=O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルおよび-C(=O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されていることができ；前記環系は、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有し；前記環系は、2個以上の酸素原子および1個以下の硫黄原子を含有していなくてもよく；

R<sub>6</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、ハロゲンまたはシアノであり；

G<sub>1</sub>が、CR<sub>4</sub>であり、R<sub>4</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲンであり；

G<sub>2</sub>が、NまたはCR<sub>5</sub>であり、R<sub>5</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノ、ニトロまたはハロゲンであり；

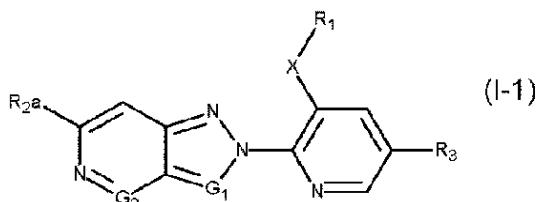
G<sub>3</sub>が、NまたはCR<sub>8</sub>であり、R<sub>8</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、ハロゲンまたはシアノである）

ならびに式Iの前記化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシド。

### 【請求項2】

式I-1の化合物

### 【化2】



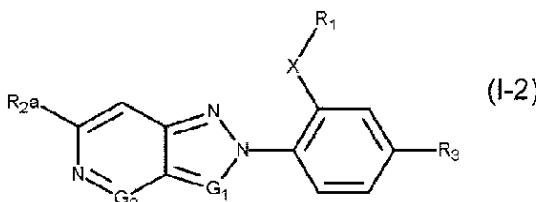
(式中、X、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、R<sub>1</sub>およびR<sub>2a</sub>が、上記式Iで定義されるとおりであり；R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである）

によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

### 【請求項3】

式I-2の化合物

### 【化3】



(式中、X、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、R<sub>1</sub>およびR<sub>2a</sub>が、上記式Iで定義されるとおりであり；R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである）

によって表される、請求項1に記載の式Iの化合物。

### 【請求項4】

10

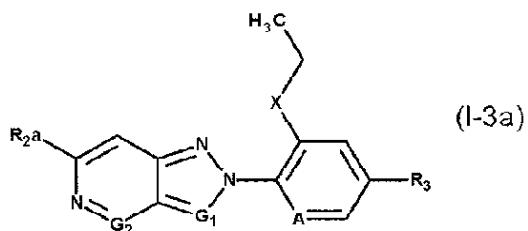
20

30

40

50

式 I - 3 a の化合物  
【化 4】



10

(式中、

X が、S、SO または SO<sub>2</sub> であり；R<sub>2a</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルまたはハロゲンであり；R<sub>3</sub> が、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルで一置換されていることができるフェニルであり；

G<sub>1</sub> が CR<sub>4</sub> であり、R<sub>4</sub> が、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、シアノまたはハロゲンであり；G<sub>2</sub> が、CH または N であり；および

A が、CH または N である)

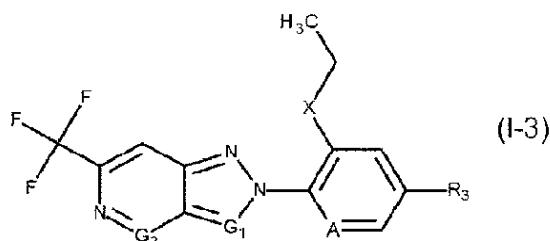
によって表される、式 I の化合物。

## 【請求項 5】

20

式 I - 3 の化合物

## 【化 5】



(式中、

30

X が、S、SO または SO<sub>2</sub> であり；

R<sub>3</sub> が、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>ハロアルキルで一置換されていることができるフェニルであり；

G<sub>1</sub> が CR<sub>4</sub> であり、R<sub>4</sub> が、水素、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub>アルキル、シアノまたはハロゲンであり；

G<sub>2</sub> が、CH または N であり；および

A が、CH または N である)

によって表される、請求項 1 に記載の式 I の化合物。

## 【請求項 6】

40

活性成分として、それぞれ遊離形態または農芸化学的に利用可能な塩形態の、請求項 1 に記載の少なくとも 1 つの式 I の化合物または適切な場合にその互変異性体と、少なくとも 1 つの助剤とを含む殺有害生物組成物。

## 【請求項 7】

有害生物を防除するための方法であって、請求項 6 に記載の組成物を、前記有害生物またはその環境に施用する工程を含むが、手術または療法による人の身体の治療方法および人の身体において実施される診断方法を除く、方法。

## 【請求項 8】

有害生物による攻撃から植物繁殖材料を保護するための方法であって、前記繁殖材料または前記繁殖材料が植えられた場所を、請求項 6 に記載の組成物で処理する工程を含む、方法。

## 【発明の詳細な説明】

50

## 【技術分野】

## 【0001】

本発明は、硫黄置換基を含有する殺有害生物的に活性な、特に、殺虫的に活性な複素環式誘導体、それらの化合物を含む組成物、および動物有害生物（animal pest）（節足動物、特に、昆虫またはダニ目（Acariina）の代表例を含む）を防除するためのそれらの使用に関する。

## 【背景技術】

## 【0002】

殺有害生物作用を有する複素環化合物は、公知であり、例えば、国際公開第2012/086848号パンフレット、国際公開第2013/018928号パンフレット、国際公開第2013/191112号パンフレットおよび国際公開第2013/191113号パンフレットに記載されている。10

## 【発明の概要】

## 【発明が解決しようとする課題】

## 【0003】

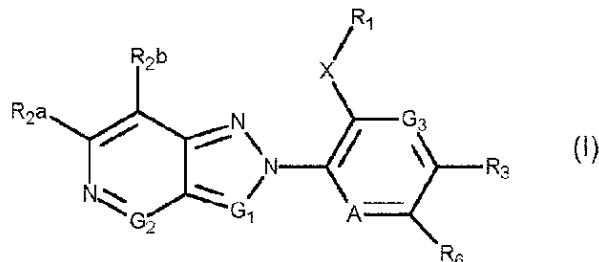
ここで、硫黄を含有するフェニルおよびピリジル置換基を有する新規な殺有害生物的に活性な複素環式誘導体が発見された。

## 【課題を解決するための手段】

## 【0004】

したがって、本発明は、式I20

## 【化1】



(式中、

30

Aが、CH、NまたはCR<sub>7</sub>であり；ここで、R<sub>7</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノ、ニトロまたはハロゲンであり；

Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；または

R<sub>1</sub>が、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；または

R<sub>1</sub>が、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルであり；

40

R<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルまたはヒドロキシリル、メトキシおよびシアノからなる群から選択される1つまたは2つの置換基で置換されるC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルであり；または

R<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>が、互いに独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、または-C(O)(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル)であり；または

R<sub>2a</sub>およびR<sub>2b</sub>が、互いに独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～

50

$C_6$ シクロアルキルであり；

$R_3$ が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル -  $C_1 \sim C_4$ アルキルであり、または

$R_3$ が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または二置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；または

$R_3$ が、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルであり；または

$R_3$ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、および -  $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るフェニルであり；または

$R_3$ が、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルコキシ、 -  $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、または $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルであり；または

$R_3$ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルおよび -  $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るピリミジニルであり；または

$R_3$ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、または $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルおよび -  $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るピリジニルであり；または

$R_3$ が、置換基 $G_3$ を含有する環に窒素原子を介して連結された5員～6員の、芳香族の、部分的に飽和または完全に飽和した環系であり、前記環系は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルおよび -  $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得；前記環系は、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有し；前記環系は、2個以上の酸素原子および1個以下の硫黄原子を含有することができず；

$R_6$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲンまたはシアノであり；

$G_1$ が $CR_4$ であり、ここで、 $R_4$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、シアノまたはハロゲンであり；

$G_2$ が、Nまたは $CR_5$ であり、ここで、 $R_5$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハ

10

20

30

40

50

ロアルキル、シアノ、ニトロまたはハロゲンであり；

$G_3$ が、 $N$ または $CR_8$ であり、ここで、 $R_8$ が、水素、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、ハロゲンまたはシアノである）

の化合物、ならびに式Iの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシドに関する。

#### 【0005】

少なくとも1つの塩基性中心 (basic centre) を有する式Iの化合物は、例えば酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉛酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸またはハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和または不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸またはフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リノゴ酸、酒石酸またはクエン酸、または例えば安息香酸との酸付加塩、または有機スルホン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカン-またはアリールスルホン酸、例えばメタン-またはp-トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式Iの化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩またはマグネシウム塩、またはアンモニアまたは有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-またはトリ-低級アルキルアミン、例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-またはジメチルプロピルアミン、またはモノ-、ジ-またはトリヒドロキシ-低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-またはトリエタノールアミンを形成することができる。

10

#### 【0006】

置換基の定義中に存在するアルキル基は、直鎖状または分枝鎖状であり得、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソ-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ノニル、デシルおよびそれらの分枝鎖状異性体である。アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル基は、挙げられたアルキル基から誘導される。アルケニルおよびアルキニル基は、一価または多価不飽和であり得る。

20

#### 【0007】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。これは、対応して、ハロアルキルまたはハロフェニルなどの、他の意味と組み合わされたハロゲンにも適用される。

30

#### 【0008】

ハロアルキル基は、好ましくは、1~6個の炭素原子の鎖長を有する。ハロアルキルは、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-フルオロエチル、2-クロロエチル、ペンタフルオロエチル、1,1-ジフルオロ-2,2,2-トリクロロエチル、2,2,3,3-テトラフルオロエチルおよび2,2,2-トリクロロエチルである。

40

#### 【0009】

アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、sec-ブトキシおよびtert-ブトキシ、さらに異性体ペンチルオキシおよびヘキシルオキシ基である。

#### 【0010】

アルコキシアルキル基は、好ましくは、1~6個の炭素原子の鎖長を有する。アルコキシアルキルは、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、n-プロポキシメチル、n-プロポキシエチル、イソプロポキシメチルまたはイソプロポキシエチルである。

#### 【0011】

50

アルコキシカルボニルは、例えば、メトキシカルボニル（C<sub>1</sub>アルコキシカルボニルである）、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、n-ペントキシカルボニルまたはヘキソキシカルボニルである。

## 【0012】

シクロアルキル基は、好ましくは、3～6個の環炭素原子、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルを有する。

## 【0013】

本発明に関して、5員～6員の、芳香族の、部分的に飽和または完全に飽和した環系の例は、ピラゾール、ピロール、ピロリジン、ピロリジン-2-オン、イミダゾール、トリアゾールおよびピリジン-2-オンである。 10

## 【0014】

本発明に関して、置換基の定義中の「一置換ないし多置換される」は、典型的に、置換基の化学構造に応じて、一置換または7回置換され、好ましくは、一置換または5回置換され、より好ましくは、一置換、二置換または三置換されることを意味する。

## 【0015】

本発明に関して、R<sub>3</sub>としてのピリミジンまたはピリジンはいずれも、任意の炭素原子を介して置換基G<sub>3</sub>を含有する環に連結され得る。

## 【0016】

本発明に係る式Iの化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。 20

## 【発明を実施するための形態】

## 【0017】

好ましくは、R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、ハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；またはR<sub>1</sub>が、ハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであり；または

R<sub>1</sub>が、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニルまたはC<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニルであり； 30

R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルであるか、またはハロゲンおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または二置換されるC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；またはR<sub>3</sub>が、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、および-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るフェニルであり；または 40

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルおよび-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るピリミジンであり；または 50

$R_3$ が、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルおよび- $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るピリジンであり；または

$R_3$ が、置換基 $G_3$ を含有する環に窒素原子を介して連結された5員～6員の、芳香族の、部分的に飽和または完全に飽和した環系であり、前記環系は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルおよび- $C(O)C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルおよび- $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得；前記環系は、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有し、前記環系は、2個以上の酸素原子および1個以下の硫黄原子を含有することができない。  
10

#### 【0018】

より好ましくは、 $R_3$ が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、またはハロゲンおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または二置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；または $R_3$ が、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルであり；または

$R_3$ が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、および- $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で置換され得るフェニルであり；または

$R_3$ が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、- $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、または $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニルであり；または

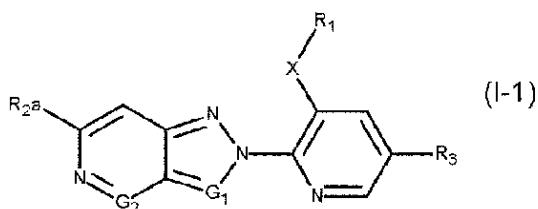
$R_3$ が、ピリミジン、またはハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニルおよび- $C(O)C_1 \sim C_4$ ハロアルキルからなる群から選択される置換基で置換されるピリミジンである。

#### 【0019】

式Iの化合物の好ましい群は、式I-1

#### 【化2】

40



(式中、 $G_1$ 、 $G_2$ 、 $R_1$ および $R_{2a}$ が、上の式Iで定義されるとおりであり、 $X$ が、 $S$ 、 $SO$ または $SO_2$ ；好ましくは、 $S$ または $SO_2$ であり； $R_3$ が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、特に、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである)

の化合物、ならびにそれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性  
50

体、互変異性体およびN - オキシドによって表される。

【0020】

式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がC - Hであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I - 1で定義されるとおりである)の化合物が好ましい。

【0021】

式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がC - Hであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、好ましくは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。10

【0022】

式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がC - Hであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノまたはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物も好ましい。

【0023】

式I - 1 のさらなる好ましい化合物において、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がC - Hであり；R<sub>1</sub>がエチルであり、R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。20

【0024】

式I - 1 の他の好ましい化合物は、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I - 1で定義されるとおりであるものである。

【0025】

式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。30

【0026】

さらなる好ましいものは、式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物である。

【0027】

さらなる好ましいものは、式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がC - Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>がエチルであり；R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物である。40

【0028】

式I - 1 の他の好ましい化合物において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC - Hであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I - 1で定義されるとおりである。

【0029】

式I - 1 (式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC - Hであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル - C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、50

水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。

【0030】

式I-1の化合物のさらなる好ましい群において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

【0031】

さらなる好ましいものは、式I-1(式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>がエチルであり；R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物である。10

【0032】

さらなる好ましいものは、式I-1(式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり、ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がNであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I-1で定義されるとおりである)の化合物である。

【0033】

式I-1(式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノであるか、またはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。20

【0034】

式I-1の化合物の別の好ましい群において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり、R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

【0035】

さらなる好ましいものは、式I-1(式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>がエチルであり；R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物である。30

【0036】

式I-1(式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノであるか、またはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルから選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。40

【0037】

式I-1の別の好ましい化合物において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。式I-1のさらなる好ましい化合物は、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>がエチルであり、R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルであるものである。50

## 【0038】

式I-1(式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。

## 【0039】

式I-1の化合物の別の好ましい群において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノまたはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

## 【0040】

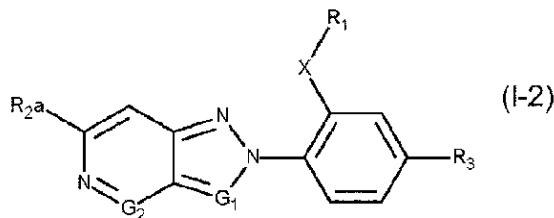
式I-1の化合物の別の好ましい群において；G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり、G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>がエチルであり、R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

## 【0041】

式Iの化合物の別の好ましい群は、式I-2

## 【化3】

20



(式中、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、R<sub>1</sub>およびR<sub>2a</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり、Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>；好ましくは、SまたはSO<sub>2</sub>であり；R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、特に、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)

30

の化合物、ならびにそれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシドによって表される。

## 【0042】

式I-2(式中、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I-2で定義されるとおりである)の化合物が好ましい。

## 【0043】

式I-2(式中、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、好ましくは、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)の化合物も好ましい。

40

## 【0044】

式I-2(式中、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノまたはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物も好ましい。

## 【0045】

式I-2のさらなる好ましい化合物において、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり

50

; R<sub>1</sub>がエチルであり、R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

【0046】

式I-2の他の好ましい化合物は、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I-2で定義されるとおりであるものである。

【0047】

式I-2（式中、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである）の化合物も好ましい。  
10

【0048】

さらなる好ましいものは、式I-2（式中、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである）の化合物である。

【0049】

さらなる好ましいものは、式I-2（式中、G<sub>1</sub>がC-Hであり；G<sub>2</sub>がNであり；R<sub>1</sub>がエチルであり；R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである）の化合物である。  
20

【0050】

式I-2の他の好ましい化合物において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I-2で定義されるとおりである。

【0051】

式I-2（式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル-C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよびC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得るC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである）の化合物も好ましい。  
30

【0052】

式I-2の化合物のさらなる好ましい群において、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり；R<sub>2a</sub>が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

【0053】

さらなる好ましいものは、式I-2（式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がC-Hであり；R<sub>1</sub>がエチルであり；R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである）の化合物である。  
40

【0054】

さらなる好ましいものは、式I-2（式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり、ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりであり；G<sub>2</sub>がNであり；およびR<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>およびR<sub>3</sub>が、上の式I-2で定義されるとおりである）の化合物である。

【0055】

式I-2（式中、G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり；ここで、R<sub>4</sub>が、上の式Iで定義されるとおりで  
50

あり； $G_2$ がNであり； $R_1$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり； $R_{2a}$ が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、シアノであるか、またはハロゲン、シアノおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得る $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；および $R_3$ が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである)の化合物も好ましい。

#### 【0056】

式I-2の化合物の別の好ましい群において、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、上の式Iで定義されるとおりであり； $G_2$ がNであり； $R_1$ が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり、 $R_{2a}$ が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；および $R_3$ が、水素またはトリフルオロメチルである。

10

#### 【0057】

さらなる好ましいものは、式I-2(式中、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、上の式Iで定義されるとおりであり； $G_2$ がNであり； $R_1$ がエチルであり； $R_{2a}$ がトリフルオロメチルであり；および $R_3$ が、水素またはトリフルオロメチルである)の化合物である。

#### 【0058】

式I-2(式中、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり； $G_2$ がC-Hであり； $R_1$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり； $R_{2a}$ が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、シアノであるか、またはハロゲン、シアノおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルから選択される置換基で一置換または多置換され得る $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；および $R_3$ が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである)の化合物も好ましい。

20

#### 【0059】

式I-2の別の好ましい化合物において、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり； $G_2$ がC-Hであり； $R_1$ が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり； $R_{2a}$ が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノであるか、またはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；および $R_3$ が、水素またはトリフルオロメチルである。

#### 【0060】

30

式I-2のさらなる好ましい化合物は、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり； $G_2$ がC-Hであり； $R_1$ がエチルであり、 $R_{2a}$ がトリフルオロメチルであり、および $R_3$ が、水素またはトリフルオロメチルであるものである。

#### 【0061】

式I-2(式中、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり； $G_2$ がNであり； $R_1$ が、 $C_1 \sim C_4$ アルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり； $R_{2a}$ が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキル、シアノまたはハロゲン、シアノおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換され得る $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；および $R_3$ が、水素、ハロゲンまたは $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである)の化合物も好ましい。

40

#### 【0062】

式I-2の化合物の別の好ましい群において、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり； $G_2$ がNであり； $R_1$ が、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピルまたはシクロプロピルメチルであり； $R_{2a}$ が、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノまたはシアノで一置換され得るシクロプロピルであり；および $R_3$ が、水素またはトリフルオロメチルである。

#### 【0063】

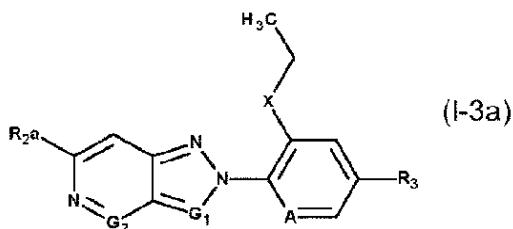
式I-2の化合物の別の好ましい群において、 $G_1$ が $CR_4$ であり；ここで、 $R_4$ が、水素、メチル、シアノ、クロロまたはブロモであり； $G_2$ がNであり； $R_1$ がエチルであり；

50

R<sub>2a</sub>がトリフルオロメチルであり、およびR<sub>3</sub>が、水素またはトリフルオロメチルである。

## 【0064】

式Iの化合物のさらなる好ましい群は、式I-3a  
【化4】



(式中、

Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>；好ましくは、SまたはSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>2a</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルまたはハロゲン；特に、プロモまたはCF<sub>3</sub>であり；

R<sub>3</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルで一置換され得るフェニルであり；

G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり、ここで、R<sub>4</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シアノまたはハロゲンであり；特に、R<sub>4</sub>が水素であり；

G<sub>2</sub>が、CHまたはN；特に、CHであり；および

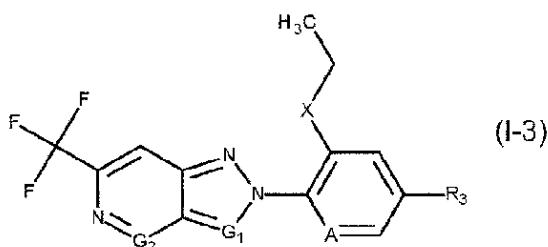
Aが、CHまたはNである)

の化合物、ならびにこれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシドによって表される。

## 【0065】

式Iの化合物のさらなる好ましい群は、式I-3

## 【化5】



(式中、

Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>；好ましくは、SまたはSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>3</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルで一置換され得るフェニルであり；

G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり、ここで、R<sub>4</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シアノまたはハロゲンであり；

G<sub>2</sub>がCHであり；および

Aが、CHまたはNである)

の化合物、ならびにこれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体およびN-オキシドによって表される。

## 【0066】

式Iの化合物のさらなる好ましい群は、式I-3

(式中、

Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>；好ましくは、SまたはSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>3</sub>が、水素、CF<sub>3</sub>またはハロゲンで一置換され得るフェニルであり；

40

50

$G_1$  が  $C R_4$  であり、ここで、 $R_4$  が、水素、 $C_1 \sim C_4$  アルキル、シアノまたはハロゲンであり；

$G_2$  が N であり；および

A が、C H または N である)

の化合物、ならびにそれらの化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体および N - オキシドによって表される。

### 【0067】

式 I の特に好ましい化合物において、

$R_1$  が  $C_1 \sim C_4$  アルキルであり；

$R_2a$  が、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキルまたはハロゲン、好ましくは、 $C_1 \sim C_4$  ハロアルキル 10 であり；

$R_2b$  が水素であり；

$R_3$  が水素であり；

$G_1$  が  $C R_4$  であり；

$R_4$  が水素であり；

$G_2$  が  $C R_5$  であり；

$R_5$  が水素であり；

$G_3$  が  $C R_8$  であり；

$R_8$  が水素であり；

X が、S または  $S O_2$  であり；および

A が、C H または N である。 20

### 【0068】

式 (I) の化合物を調製するための本発明に係る方法は、基本的に、当業者に公知の方法によって、または適切な出発材料を用いて、文献、例えば、国際公開第 2013 / 19 1113 号パンフレットに記載されている方法と類似の方法で行われる。

### 【0069】

より詳細には、式 I (式中、X が、SO (スルホキシド) および / または  $S O_2$  (スルホン) である) の化合物の部分群は、例えば、酸化剤の中でも特に、m - クロロペルオキシ安息香酸 (m C P B A) 、過酸化水素、オキソノン、過ヨウ素酸ナトリウム、次亜塩素酸ナトリウムまたは次亜塩素酸 tert - ブチルなどの試薬を必要とする、式 I (式中、X が S である) の対応するスルフィド化合物の酸化反応によって得られる。酸化反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。この反応に使用される溶媒の例としては、ジクロロメタンおよびクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；酢酸；水；およびこれらの混合物が挙げられる。この反応に使用される酸化剤の量は、スルホキシド化合物 I を生成するために、1 モルのスルフィド化合物 I に対して一般に 1 ~ 3 モル、好ましくは 1 ~ 1 . 2 モル、スルホン化合物 I を生成するために、1 モルのスルフィド化合物 I に対して好ましくは 2 ~ 2 . 2 モルの酸化剤である。このような酸化反応は、例えば、国際公開第 2013 / 018928 号パンフレットに記載されている。 30

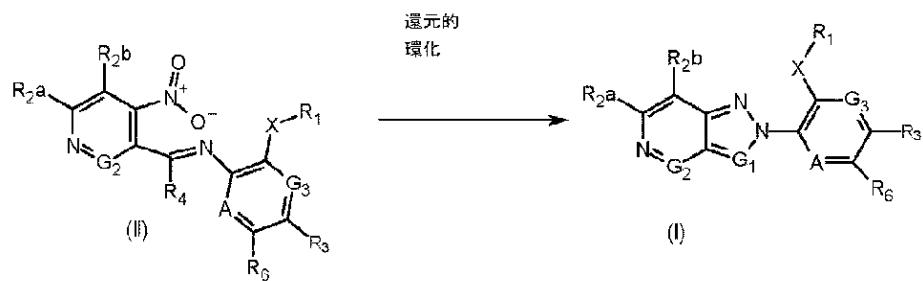
### 【0070】

インダゾール、アザ - インダゾールおよび / またはジアザ - インダゾールが、例えば、国際公開第 2013 / 191113 号パンフレット；Synlett (2013), 24 (12), 1573 - 1577; Journal of the Chemical Society, Chemical Communications (1991), (20), 1466 - 7; Organic Letters (2014), 16 (11), 31 14 - 3117 に記載されている周知の方法を用いて作製されてもよく；またはこのタイプの誘導体のより一般的な合成についての概説については、例えば、Science of Synthesis (2002), 12, 227 - 324 および European Journal of Organic Chemistry (2008), (24), 4073 - 4095 を参照されたい。これらの方法の全ては、インダゾール誘導体を評価 40

するのに使用され得る。1つの可能な方法が、式Iの化合物のためのスキーム1にまとめられている。

【化6】

スキーム1

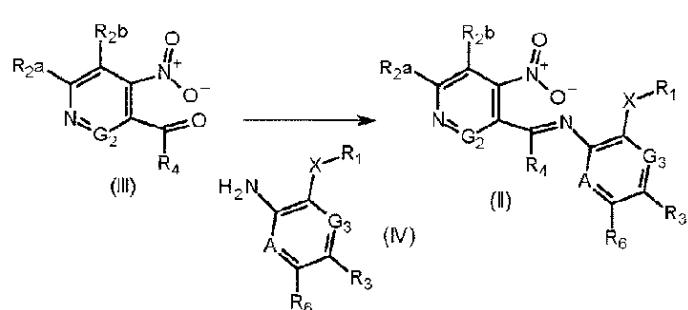


式(I)の化合物は、亜リン酸トリアルキル(より詳細には、例えば亜リン酸トリエチル)、トリアルキルホスフィンまたはトリフォニルホスフィンなどの還元剤を用いて、還元的環化条件下における式(II)の化合物の反応によって調製され得る。この還元的環化の原理は、公知の Cadogan 反応に類似している。あるいは、この反応は、金属触媒、例えば  $\text{MoO}_2\text{Cl}_2(\text{dmf})_2$  などのモリブデン(VI)触媒 [モリブデニルクロリド-ビス(ジメチルホルムアミド)] の存在下で、またはより一般的に、亜リン酸トリエチル、トリフォニルホスフィンまたは CO などの還元剤と組み合わせて遷移金属錯体を用いて行われ得る。好適な溶媒は、任意選択的にマイクロ波条件下で、室温から 200 、好ましくは、50 ~ 160 の温度で、過剰な還元剤(亜リン酸トリエチルなど)、または例えばトルエンまたはキシレンの使用を含み得る。

【0071】

【化7】

スキーム2



式(II)の化合物は、通常、加熱しながら、任意選択的にマイクロ波条件下で、式(I)のアルデヒドまたはケトン誘導体と、式(IV)のアミン誘導体との反応によって調製され得る(スキーム2)。式(II)の化合物の形成は、共沸蒸留によるか、または例えば  $\text{TiCl}_4$  などの乾燥剤または分子篩を用いた、水の除去を必要とし得る。式(I)のシップ塩基の形成は、当業者に非常によく知られており、方法は、文献(例えば、Molbank (2006), M514 or March's Advanced Organic Chemistry: Reactions, Mechanisms, and Structure, 5th Edition p 1185 - 1187 およびその中の引用文献を参照)に十分に説明されている。好適な溶媒は、室温から 200 、好ましくは、50 ~ 160 の温度で、例えばトルエンまたはキシレンを含み得る。

【0072】

式(III)の化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方

20

40

50

50

法によって作製され得る。

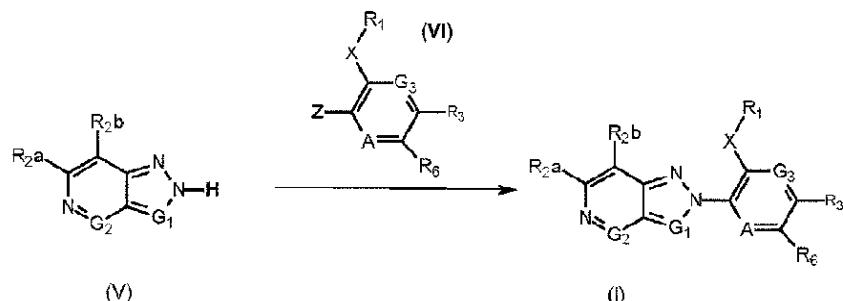
**【0073】**

式(IV)の化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。

**【0074】**

**【化8】**

**スキーム3**



10

スキーム2に示される代替的な方法において、式Iの化合物は、式V(式中、R<sub>2a</sub>、R<sub>2b</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>が、式Iにおいて定義される値を有する)の化合物を、式(VI)(式中、Zが、例えば、フッ素、塩素、臭素もしくはヨウ素、またはアリールスルホネートもしくはアルキルスルホネート、または任意の他の同様の脱離基のような脱離基である)の化合物と反応させることによって調製することもできる。例えば、S<sub>N</sub>A r反応(芳香族求核置換反応)と呼ばれるこの反応は、マイクロ波照射を用いてまたは用いずに、室温から200の温度で、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中で、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウムまたは炭酸リチウムなどの塩基の存在下で行うことができる。このタイプの反応の例が、国際公開第2007/113596号パンフレットおよびJournal of Medicinal Chemistry, 52(22), 7170-7185, 2009に記載されている。代替的な方法において、式(VI)(式中、Zが、塩素、臭素もしくはヨウ素、または任意の他の適切な脱離基である)の化合物は、例えば炭酸カリウムなどの塩基の存在下で、L-プロリンまたはN,N'-ジメチルエチレンジアミンなどの添加剤を用いてまたは用いずに、銅触媒カップリング条件を用いて、例えば銅触媒としてヨウ化銅(I)を用いて、式Vの化合物とカップリングされ得る。前記代替的な方法は、例えば、国際公開第2006/107771号パンフレットおよび国際公開第2012/083105号パンフレットに記載されている。

20

**【0075】**

式(V)の化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。

**【0076】**

式(VI)の化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によって作製され得る。1つの特定の例が、スキーム4に記載されている。

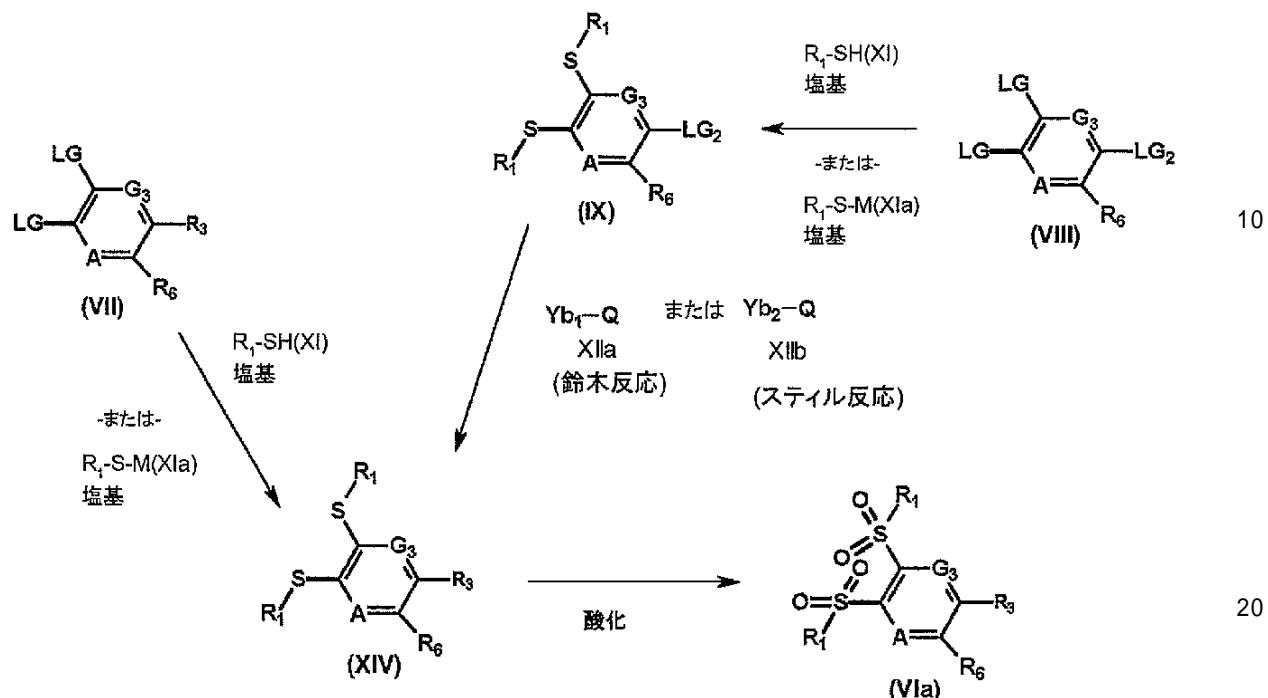
30

**【0077】**

40

【化9】

スキーム4



式(VIa)（式中、 $R_3$ 、 $R_6$ 、 $R_1$ 、Aおよび $G_3$ が、式Iにおいて定義される値を有する）の化合物は、式(XIV)の化合物の酸化によって調製され得る（スキーム4）。この反応は、例えば過酢酸もしくはm-クロロ過安息香酸のような過酸、または例えば過酸化水素もしくはtert-ブチルヒドロペルオキシドのようなヒドロペルオキシド、またはモノペルオキソ二硫酸塩もしくは過マンガン酸カリウムのような無機酸化剤、優先的に、メタ-クロロ過安息香酸のような試薬を用いて行うことができる。

【0078】

30

式(XIV)（式中、 $R_3$ 、 $R_6$ 、 $R_1$ 、Aおよび $G_3$ が、式Iにおいて定義される値を有する）の化合物は、好ましくは25~120の温度で、不活性溶媒中で、任意選択的に、アルカリ金属炭酸塩、例えば炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウム、または水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物、または水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物などの好適な塩基の存在下で、式XI

 $R_1\text{-SH(XI)}$ 

（式中、 $R_1$ が、式Iにおいて定義されるおりである）の化合物またはその塩との反応による、式(VII)（LGが、例えばClまたはフッ素である）の化合物の2つの脱離基（LG）の置換によって調製され得る（スキーム4）。使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素、アセトニトリルなどのニトリルまたはN,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-2-ピロリドンもしくはジメチルスルホキシドなどの極性非プロトン性溶媒が挙げられる。式Xの化合物の塩の例としては、式XIa

 $R_1\text{-S-M(XIa)}$ 

（式中、 $R_1$ が、上に定義されるとおりであり、Mが、例えば、ナトリウムまたはカリウムである）の化合物が挙げられる。

【0079】

同様の条件下で、式(IX)の化合物は、式(VIII)（式中、LGが、例えばClまたはフッ素であり、LG<sub>2</sub>が、臭化物またはヨウ素である）の化合物から調製され得る

40

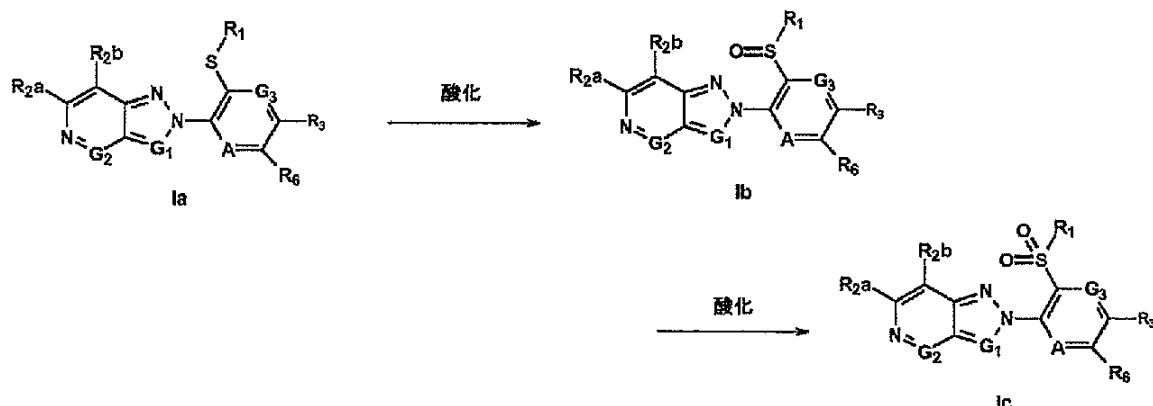
50

。 L G<sub>2</sub>から R<sub>3</sub>への変換による式(IX)の化合物から式(XIV)の化合物への変換は、当業者に周知の方法によって行うことができる。例えば、式(XIV)(式中、R<sub>6</sub>、R<sub>1</sub>、AおよびG<sub>3</sub>が、式Iにおいて定義される値を有し、R<sub>3</sub>が、例えば、シクロプロパン、アルケニル、アルキニル、アリールまたはヘテロアリールである)の化合物は、式XIb(式中、Y<sub>b2</sub>が、トリアルキルスズ誘導体、好ましくはトリ-n-ブチルスズである)の化合物と、式XIVの化合物とのスタイル反応によって調製され得る。このようなスタイル反応は、通常、任意選択的に、フッ化セシウム、または塩化リチウムなどの添加剤の存在下で、および任意選択的に、さらなる触媒、例えばヨウ化銅(I)の存在下で、DMF、アセトニトリル、またはジオキサンなどの不活性溶媒中で、パラジウム触媒、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(0)、または(1,1'ビス(ジフェニルホスフィノ)-フェロセン)ジクロロパラジウム-ジクロロメタン(1:1錯体)の存在下で行われる。このようなスタイルカップリングはまた、当業者に周知であり、例えば、J.Org.Chem., 2005, 70, 8601-8604, J.Org.Chem., 2009, 74, 5599-5602、およびAngew.Chem.Int.Ed., 2004, 43, 1132-1136に記載されている。あるいは、式(XIV)(式中、R<sub>6</sub>、R<sub>1</sub>、AおよびG<sub>3</sub>が、式Iにおいて定義される値を有し、R<sub>3</sub>が、例えば、シクロプロパン、アルケニル、アルキニル、アリールまたはヘテロアリールである)の化合物は、式IX(式中、LGが、脱離基、例えば、塩素、臭素またはヨウ素である)の化合物を、式XIa(式中、Y<sub>b1</sub>が、例えばB(OH)<sub>2</sub>またはB(OR<sub>b1</sub>)<sub>2</sub>のようなホウ素に由来する官能基であり得、ここで、R<sub>b1</sub>が、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基であり得、または2つの基OR<sub>b1</sub>が、ホウ素原子と一緒に、例えばピナコールボロン酸エステルのような5員環を形成することができる)の化合物と反応させることを含む鈴木反応によって調製され得る。この反応は、好ましくは不活性雰囲気下で、例えば、1,2-ジメトキシエタンと水との混合物、またはジオキサンと水との混合物のような、溶媒または溶媒混合物中で、炭酸ナトリウムまたはフッ化セシウムのような塩基の存在下で、パラジウム系触媒、例えばテトラキス(トリフェニルホスフィン)-パラジウムまたは(1,1'ビス(ジフェニルホスフィノ)-フェロセン)ジクロロパラジウム-ジクロロメタン(1:1錯体)によって触媒され得る。反応温度は、優先的に、室温から反応混合物の沸点の範囲であり得る。このような鈴木反応は、当業者に周知であり、例えば、J.Orgmet.Chem. 576, 1999, 147-168において概説されている。

【0080】

【化10】

## スキーム5



式Ib(式中、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>、R<sub>2b</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>6</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>およびG<sub>3</sub>が、式Iにおいて定義される値を有する)の化合物は、式Ia(式中、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>、R<sub>2b</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>6</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>およびG<sub>3</sub>が、式Iにおいて定義される値を有する)の化合物の酸化によって調製され得る(スキーム12)。この反応は、例えば過酢酸もしくはm-クロロ過安息香酸

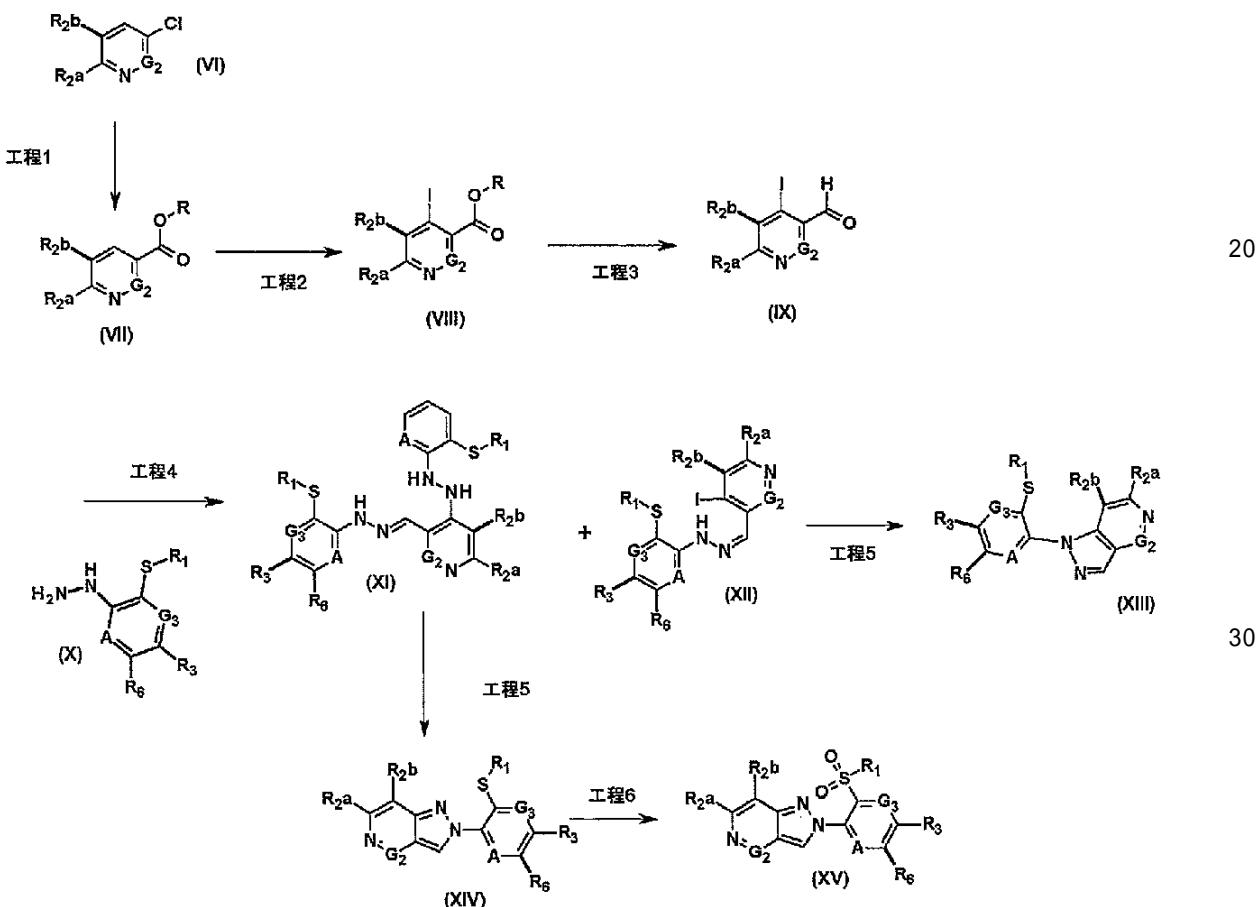
のような過酸、または例えば過酸化水素もしくはtert-ブチルヒドロペルオキシドのようなヒドロペルオキシド、またはモノペルオキソニ硫酸塩もしくは過マンガン酸カリウムのような無機酸化剤、優先的に、メタ-クロロ過安息香酸のような試薬を用いて行うことができる。同様に、式Ic(式中、A、R<sub>1</sub>、R<sub>2a</sub>、R<sub>2b</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>6</sub>、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>およびG<sub>3</sub>が、式Iにおいて定義される値を有する)の化合物は、式Ibの化合物の酸化によって調製され得る。これらの反応は、0未満から溶媒系の沸点までの温度および硫黄の酸化度を決定する酸化剤の当量数(例えば2当量以上の酸化剤を用いる)によって、これらの条件に適合する様々な有機溶媒または水性溶媒中で行うことができ、式Icの化合物は、式Iaの化合物から直接調製され得る。

【0081】

10

【化11】

スキーム6



式(XV)の化合物は、例えば、スキーム6に記載されるように調製され得る：1)任意選択的に、リガンド(例えば：1,1'-フェロセンジイル-ビス(ジフェニルホスフィン))の存在下で、および任意選択的に、塩基(例えば：N,N-ジエチルエタンアミン)の存在下で、メタノールまたはエタノールなどのアルコール中で、パラジウム触媒(例えば：酢酸パラジウム(I))などの金属触媒の存在下で、式(VII)の化合物を一酸化炭素と反応させることによる。これらの反応は、「ハロゲン化アリールのカルボニル化交差カップリング」という名称で文献において周知である。このような反応の例としては、Angewandte Chemie, International Edition (2009), 48(23), 4114-4133またはOrganometallics, 2008, 27, 5402を参照されたい。2)まず、ブチルリチウムなどの有機金属の存在下で、低温で式(VII)の化合物から誘導される有機金属を生成するための式(VIII)の化合物の脱プロトン的金属化(deprotonative metalation)による、式(VIII)の化合物のハロゲン化、次に、それに続くヨウ素または

40

50

臭化物などのハロゲン求電子剤との反応による。この変換は、当業者によって周知であり、多くの試薬が、式(VII)の化合物から誘導される有機金属を生成するための様々な有機金属および条件を用いてこの変換を実現することができ、こうしたタイプの反応のいくつかの例としては: Journal of the American Chemical Society 1999, 121(14), 3539 - 3540 または Angewandte Chemie, International Edition (2014), 53(30), 7928 - 7932 を参照されたい。<sup>10</sup> 3) 式(IX)の化合物を得るための、標準条件下: 例えば、ジクロロメタンなどの溶媒中で、水素化ジイソブチルアルミニウムなどの還元剤の存在下での還元による、式(VIII)の化合物のエステルのアルデヒドへの還元。このような反応は、当業者によって周知である(この変換の例については、Comprehensive Organic Transformations A Guide to Functional Group Preparations by Larock, R. C. 1989, p 619 (Publisher VCH Weinheim, Germany) を参照されたい)。<sup>11</sup> 4) メタノールなどの溶媒中での、式(IX)の化合物と式(X)の化合物との反応により、式(XI)の化合物および任意選択的に、式(XII)の化合物が得られた。<sup>12</sup> 5) マイクロ波中でのまたはマイクロ波中でない、ジメチルホルムアミドなどの溶媒中での、式(XI)の化合物の加熱により、式(XIV)の化合物が得られた。<sup>13</sup> 6) スキーム5に記載されるのと同様の条件における式(XIV)の化合物の硫黄基の酸化により、式(XV)の所望の化合物が得られた。<sup>14</sup>

#### 【0082】

式(X)の化合物は、公知であるか、市販されているか、または当業者に公知の方法によつて作製され得る。

#### 【0083】

反応剤は、塩基の存在下で反応され得る。好適な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属ジアルキルアミドまたはアルカリ金属またはアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離またはN-アルキル化飽和または不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウムおよび炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシリルアミン、N-シクロヘキシリル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウムおよび1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。<sup>30</sup>

#### 【0084】

反応剤は、そのまで、すなわち、溶媒または希釈剤を加えずに、互いに反応され得る。しかしながら、ほとんどの場合、不活性溶媒または希釈剤またはこれらの混合物を加えることが有利である。反応が塩基の存在下で行われる場合、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリンまたはN,N-ジエチルアニリンなどの過剰に用いられる塩基は、溶媒または希釈剤としても働き得る。

#### 【0085】

反応は、約-80 ~ 約+140、好ましくは約-30 ~ 約+100 の温度範囲、多くの場合、周囲温度から約+80 の範囲で行われるのが有利である。

#### 【0086】

10

20

30

40

50

式Iの化合物は、式Iの出発化合物の1つ以上の置換基を、慣例的な方法で、本発明に係る他の置換基で置換することによって、式Iの別の化合物へと、それ自体公知の方法で転化され得る。

#### 【0087】

それぞれ好適な反応条件および出発材料の選択に応じて、例えば、1つの反応工程において、1つの置換基を、本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であり、または複数の置換基が、同じ反応工程において、本発明に係る他の置換基で置換され得る。

#### 【0088】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。したがって、例えば、式Iの化合物の酸付加塩が、好適な酸または好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩が、好適な塩基または好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

10

#### 【0089】

式Iの化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物または好適なイオン交換試薬による処理によって、遊離化合物Iの酸付加塩へと、および例えば、好適な酸または好適なイオン交換試薬による処理によって、塩基による塩へと、慣例的な方法で転化され得る。

#### 【0090】

式Iの化合物の塩は、例えば塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、したがって反応混合物から沈殿する好適な溶媒中で、例えば、塩酸塩などの無機酸塩を、酸のナトリウム塩、バリウム塩または銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することによって、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば、他の酸付加塩へと、それ自体公知の方法で転化され得る。

20

#### 【0091】

手順または反応条件に応じて、塩形成特性を有する式Iの化合物が、遊離形態または塩の形態で得られる。

#### 【0092】

式Iの化合物および必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対および相対配置に応じて、および/または分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば、対掌体および/またはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態で、あるいは鏡像異性体混合物、例えば、ラセミ体、ジアステレオマー混合物またはラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態でまたはこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能な全ての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記および下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

30

#### 【0093】

式Iの化合物のジアステレオマー混合物またはラセミ混合物は、どの出発材料および手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態または塩形態で、例えば、分別結晶化、蒸留および/またはクロマトグラフィーによって、成分の物理化学的差異に基づいて、純粋なジアステレオマーまたはラセミ体へと、公知の方法で分離され得る。

#### 【0094】

40

同様の方法で得られるラセミ体などの鏡像異性体混合物は、公知の方法によって、例えば、光学活性溶媒からの再結晶化によって、キラル吸着剤におけるクロマトグラフィー、例えば、好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィー(HPLC)によって、例えば、1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂によって、またはジアステレオマー塩への転化によって、例えば、塩基性最終生成物ラセミ体を、カルボン酸、例えばショウノウ酸、酒石酸またはリンゴ酸、またはスルホン酸、例えばカンファースルホン酸などの光学活性酸と反応させ、このように得られるジアステレオマー混合物を、例えば、異なる溶解度に基づく分別結晶によって分離して、好適な物質、例えば塩基性物質の作用によって、所望の鏡像異性体がそれから放出され得るジアステレオマーを得る

50

ことによって、光学対掌体へと分解され得る。

**【0095】**

純粹なジアステレオマーまたは鏡像異性体は、本発明にしたがって、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、ジアステレオ選択的またはエナンチオ選択的合成の一般に知られている方法によつても、例えは、立体化学特性を有する出発材料を用いて、本発明に係る方法を行うことによつても得られる。

**【0096】**

N - オキシドは、酸無水物、例えは無水トリフルオロ酢酸の存在下で、式 I の化合物を、好適な酸化剤、例えは  $H_2O_2$  / 尿素付加物と反応させることによつて調製され得る。このよな酸化は、例えは、J . M e d . C h e m . , 32 ( 12 ) , 2561 - 73 , 1989 または国際公開第 00 / 15615 号パンフレットといった文献から公知である。

**【0097】**

個々の成分が異なる生物学的活性を有する場合、それぞれ、生物学的により有効な異性体、例えは鏡像異性体またはジアステレオマー、または異性体混合物、例えは鏡像異性体混合物またはジアステレオマー混合物を単離または合成することが有利である。

**【0098】**

式 I の化合物および必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、必要に応じて、水和物の形態で得ることもでき、および / または他の溶媒、例えは、固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

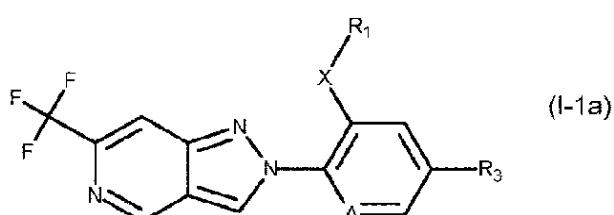
**【0099】**

以下の表 1 ~ 3 に表される化合物は、上述される方法にしたがつて調製され得る。以下に続く例は、本発明を例示し、式 I の好ましい化合物を示すことが意図される。「Ph」はフェニル基を表す。

**【0100】**

表 1 : この表は、式 I - 1a :

**【化 12】**



の 10 種の化合物および表 1 の化合物の N - オキシドを開示する。

**【0101】**

10

20

30

【表1】

表1:

化合物番号	X	R <sub>1</sub>	R <sub>3</sub>	A
1.001	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
1.002	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
1.003	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
1.004	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
1.005	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1.006	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
1.007	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
1.008	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
1.009	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-Ph-	N
1.010	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-Ph-	N

10

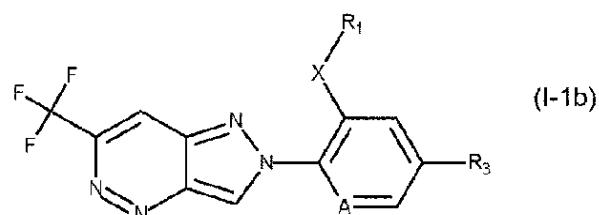
20

30

【0102】

表2：この表は、式I-1b：

【化13】



40

の10種の化合物および表2の化合物のN-オキシドを開示する。

【0103】

## 【表2】

表2:

化合物番号	X	R <sub>1</sub>	R <sub>3</sub>	A
2.001	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
2.002	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH
2.003	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
2.004	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N
2.005	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2.006	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	CH
2.007	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
2.008	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N
2.009	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-Ph-	N
2.010	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-Ph-	N

10

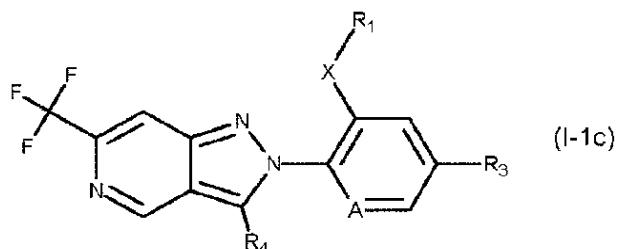
20

30

## 【0104】

表3：この表は、式I-1c：

## 【化14】



40

の12種の化合物および表3の化合物のN-オキシドを開示する。

## 【0105】

## 【表3】

表3:

化合物番号	X	R <sub>1</sub>	R <sub>3</sub>	A	R <sub>4</sub>
3.001	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	Br
3.002	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	Br
3.003	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	CN
3.004	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	CN
3.005	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>
3.006	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>
3.007	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	Br
3.008	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	Br
3.009	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	CN
3.010	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	CN
3.011	S	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	CH <sub>3</sub>
3.012	S(O) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	CH <sub>3</sub>

10

## 【0106】

本発明に係る式Iの化合物は、低い施用量でも有害生物防除の分野で予防的におよび／または治療的に有益な活性成分であり、これは、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類および植物によって良好な耐容性を示される。本発明に係る活性成分は、昆虫またはダニ目(Acarina)の代表例などの、通常の感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物の全てまたは個々の発育段階に対しても作用する。本発明に係る活性成分の殺虫または殺ダニ活性は、直接、すなわち、直ちにまたはいくらかの時間が経過してから初めて、例えば脱皮中に起こる有害生物の破壊として、または間接的に、例えば、減少した産卵および／または孵化率として現れることがある。

20

## 【0107】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

ダニ目(Acarina)から、例えば、アカリツス属(Acalitus spp.)、アカルス属(Aculus spp.)、アカリカルス属(Acaricalus spp.)、アセリア属(Aceria spp.)、アシプトコナダニ(Acarus sirro)、キララマダニ属(Amblyomma spp.)、ナガヒメダニ属(Argas spp.)、ウシマダニ属(Boophilus spp.)、ブレビバルパス属(Brevipalpus spp.)、ブリオビア属(Bryobia spp.)、カリビトリメルス属(Calipitrimerus spp.)、ショクヒヒゼンダニ属(Chorioptes spp.)、ワクモ(Dermanyssus gallinace)、デルマトファゴイデス属(Dermatophagooides spp.)、エオテラニカス属(Eotetranychus spp.)、エリオフィエス属(Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス属(Hemitarsonemus spp.)、イボマダニ属(Hyalomma spp.)、タネガタマダニ属(Ixodes spp.)、オリゴニクス属(Olygonychus spp.)、カズキダニ属(Ornithodoros spp.)、ポリファゴタルソネ・ラタス(Polyphagotarsone latus)、パノニクス属(Panonychus spp.)、ミカンサビダニ(Phyllocoptrus oleivora)、フィトネムス属(Phytonemus spp.)、ポリファゴタロソネムス属(Polyphagotarsonemus spp.)、キュウセンヒゼンダニ属(Psoroptes spp.)、コイタマダニ属(Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス属(Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス属(Sarcopetes spp.)、ステネオタルソネムス属(Steneotarsonemus spp.)、ホコリダニ属(Tarsonemus spp.)およびテトラニクス属(Tetranychus s

30

40

50

p p . ) ;

シラミ目 (*Anoplura*) から、例えば、ブタジラミ属 (*Haematopinus spp.*)、リノグナツス属 (*Linognathus spp.*)、ペディクルス属 (*Pediculus spp.*)、ペムフィグス属 (*Pemphigus spp.*) およびフィロキセラ属 (*Phylloxera spp.*)；

鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えば、アグリオテス属 (*Agrionotus spp.*)、アンフィマロン・マジャレ (*Amphimallon majale*)、セマダラコガネ (*Anomala orientalis*)、アントノムス属 (*Anthonomus spp.*)、マグソコガネ属 (*Aphodius spp.*)、アスチラス・アトロマクラタス (*Astylus atromaculatus*)、アテニウス属 (*Ataenius spp.*)、アトマリア・リネアリス (*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス (*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属 (*Cerotoma spp.*)、コノデルス属 (*Conoderus spp.*)、コスマポリテス属 (*Cosmopolites spp.*)、コチニス・ニチダ (*Cotinis nitida*)、クルクリオ属 (*Curculio spp.*)、シクロセファラ属 (*Cyclocephala spp.*)、デルメステス属 (*Dermestes spp.*)、ジアブロチカ属 (*Diabrotica spp.*)、アブデルスツノカブトムシ (*Diloboderus abderus*)、エピラクナ属 (*Epilachna spp.*)、エレムヌス属 (*Eremnus spp.*)、ヘテロニクス・アラトル (*Heteronychus arator*)、コーヒーノミキクイムシ (*Hypothemus hampei*)、ラグリア・フィロサ (*Lagria villosa*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソルホプトルス属 (*Lissorrhopterus spp.*)、リオゲニス属 (*Liogenys spp.*)、マエコラスピス属 (*Maecolaspis spp.*)、アカビロウドコガネ (*Maladera castanea*)、メガセルיס属 (*Megascelis spp.*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属 (*Melolontha spp.*)、マイオクロウス・アルマツス (*Myochrous armatus*)、オリカエフィルス属 (*Orycaephilus spp.*)、オチオリンクス属 (*Otiorrhynchus spp.*)、フィロファガ属 (*Phyllophaga spp.*)、フリクチヌス属 (*Phlyctinus spp.*)、ポピリア属 (*Popillia spp.*)、ブシリオデス属 (*Psylliodes spp.*)、リゾマツス・アウブチリス (*Rhyssomatus aubtilis*)、リゾペルタ属 (*Rhizopertha spp.*)、コガネムシ科 (*Scarabaeidae*)、シトフィルス属 (*Sitophilus spp.*)、シトルガ属 (*Sitotroga spp.*)、ソマチカス属 (*Somaticus spp.*)、スフェノフォラス属 (*Sphenophorus spp.*)、ステルネクススブ・シグナツス (*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属 (*Tenebrio spp.*)、トリボリウム属 (*Tribolium spp.*) およびトロゴデルマ属 (*Trogoderma spp.*)；

双翅目 (*Diptera*) から、例えば、ヤブカ属 (*Aedes spp.*)、ハマダラカ属 (*Anopheles spp.*)、アンテリゴナ・ソカタ (*Antherigon a soccata*)、オリーブミバエ (*Bactrocera oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属 (*Bradyisia spp.*)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属 (*Ceratitidis spp.*)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia spp.*)、イエカ属 (*Culex spp.*)、クテレブラ属 (*Cuterebra spp.*)、ダクス属 (*Dacus spp.*)、デリア属 (*Delia spp.*)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia spp.*)、ガストロフィラス属 (*Gastrophilus spp.*)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、

ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属 (*Hippobosca* spp.)、リリオミザ属 (*Liriomyza* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属 (*Orseolia* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frict*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.) 10、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) およびガガンボ属 (*Tipula* spp.);

半翅目 (Hemiptera) から、例えば、アカントコリス・スカブラトル (*Acanthocoris scabrador*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカスミカメムシ (*Adelphocoris lineolatus*)、アンブリペルタ・ニチダ (*Amblypelta nitida*)、バチコエリア・タラシナ (*Bathycoelia thalassina*)、ブリサス属 (*Blissus* spp.)、トコジラミ属 (*Cimex* spp.)、クラビグララ・トメントイシコリス (*Clavigralla tomentosicollis*)、クレオンチアデス属 (*Creontiades* spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ (*Distantiella theobroma*)、ジケロプス・フルカツス (*Dichelops furcatus*)、ジスデルクス属 (*Dysdercus* spp.)、エデッサ属 (*Edessa* spp.)、ユーキスツス属 (*Euchistus* spp.)、ヒメナガメ (*Eurydema pulchrum*)、エウリガステル属 (*Eurygaster* spp.)、クサギカメムシ (*Halyomorpha halys*)、ホルシアス・ノビレルス (*Horcius nobilellus*)、レプトコリサ属 (*Leptocoris* spp.)、メクラカメムシ属 (*Lygus* spp.)、マルガロデス属 (*Margarodes* spp.)、ムルガンチア・ヒストリオニク (*Murgantia histrionica*)、ネオメガロトムス属 (*Neomegalotomus* spp.)、タバコカスミカメムシ (*Nesidiocoris tenuis*)、ネザラ属 (*Nezara* spp.)、ニシウス・シムランス (*Nysius simulanus*)、オエバルス・インスラリス (*Oebalus insularis*)、ピエスマ属 (*Piesma* spp.)、ピエゾドルス属 (*Piezodorus* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノファラ属 (*Scotinophara* spp.)、チアンタ属 (*Thyanta* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ヴァチガ・イルデンス (*Vatiga illudens*);

アシルトシウム・ピスム (*Acyrtosium pisum*)、アダルゲス属 (*Adalgis* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalihana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属 (*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属 (*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロッコスス (*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ (*Aleyrodes brasiliace*)、フタテンミドリヨコバイ (*Amarasca biguttula*)、アムリトズス・アトキンソニ (*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、アリマキ科 (Aphididae)、ワタアブラムシ属 (*Aphis* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バク 50

テリセラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属 (*Bemisia spp.*)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus spp.*)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属 (*Cacopsylla spp.*)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavarieilla aegopodii Scop.*)、セロプラスター属 (*Ceroplastes spp.*)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyospermum*)、シカデラ属 (*Cicadella spp.*)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus spp.*)、シカデユリナ属 (*Cicadulina spp.*)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレウロデス属 (*Dialeurodes spp.*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*Dysaphis spp.*)、エンポアスカ属 (*Empoasca spp.*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythroneura spp.*)、ガスカルジア属 (*Gascardia spp.*)、グリカスピス・ブリンプレコンベイ (*Glycaspis brimblecombei*)、ヒアダフィス・シードブラシカエ (*Hyadaphis pseudo brassicae*)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus spp.*)、ヒペロミズス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバイ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jacobiasca lybica*)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax spp.*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes spp.*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi*)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフム属 (*Macrosiphum spp.*)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva spp.*)、メタカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus spp.*)、ネオトキソプテラ属 (*Neotoxoptera spp.*)、ツマグロヨコバイ属 (*Nephrotettix spp.*)、ニラバルバタ属 (*Nilaparvata spp.*)、ナシミドリオオアブラムシ (*Nippolachnus piri Mats*)、オドナスピス・ルタエ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニグラ・ゼンター (*Orgama lanigera Zehnter*)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属 (*Parlatoria spp.*)、ペムフィグス属 (*Pemphigus spp.*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella spp.*)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera spp.*)、プランコッカス属 (*Planococcus spp.*)、シューダウラカスピス属 (*Pseudaulacaspis spp.*)、シードコッカス属 (*Pseudococcus spp.*)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis seriatus*)、ブシラ属 (*Psylla spp.*)、ブルビナリア・エチオピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズビジオツス属 (*Quadrastichus spp.*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum spp.*)、サイセチア属 (*Saissetia spp.*)、スカホイデウス属 (*Scaphoideus spp.*)、スチザフィス属 (*Schizaphis spp.*)、シトビオン属 (*Sitobion spp.*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*S*

*pissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ(*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属(*Toxoptera spp.*)、トリアレウロデス属(*Trialeurodes spp.*)、トリジスカス・スポロボリ(*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属(*Trionymus spp.*)、ミカントガリキジラミ(*Trioz erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ(*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ(*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス(*Zyginidia scutellaris*)；

膜翅目(*Hymenoptera*)から、例えば、ヒメハキリアリ属(*Acromyrmex*)、アルゲ属(*Arge spp.*)、ハキリアリ属(*Atta spp.*)、セフス属(*Cephus spp.*)、ジブリオン属(*Diprion spp.*)、マツハバチ科(*Diprionidae*)、シマトウヒハバチ(*Gilpinia polytoma*)、ホプロカンパ属(*Hoplocampa spp.*)、ケアリ属(*Lasiurus spp.*)、イエヒメアリ(*Monomorium pharaonis*)、ネオジブリオン属(*Neodiprion spp.*)、シュウカクアリ属(*Pogonomyrmex spp.*)、スレノブシス・インビクタ(*Solenopsis invicta*)、ソレノブシス属(*Solenopsis spp.*)およびベスパ属(*Vespa spp.*)；

等翅目(*Isoptera*)から、例えば、コプトテルメス属(*Coptotermes spp.*)、コルニテルネス・クムランス(*Cornitermes cumulans*)、インシシテルメス属(*Incisitermes spp.*)、マクロテルメス属(*Macrotermes spp.*)、マストテルメス属(*Mastotermes spp.*)、ミクロテルメス属(*Microtermes spp.*)、ヤマトシロアリ属(*Reticulitermes spp.*)；ソレノブシス・ゲミナテ(*Solenopsis geminata*)

鱗翅目(*Lepidoptera*)から、例えば、アクレリス属(*Acleris spp.*)、アドキソフィエス属(*Adoxophyes spp.*)、アエゲリア属(*Aegeria spp.*)、アグロティス属(*Agrotis spp.*)、アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アミロイス属(*Amylois spp.*)、アンチカルシア・ゲマタリス(*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属(*Archips spp.*)、アルギレスチア属(*Argyresthia spp.*)、アルギロタエニア属(*Argyrotaenia spp.*)、アウトグラファ属(*Autographa spp.*)、ブックラトリクス・ツルベリエラ(*Bucculatrix thurberiella*)、アフリカズイム(*Busseola fusca*)、スジマラダメイガ(*Cadra cautella*)、モモシンクイガ(*Carposina nipponensis*)、チロ属(*Chilo spp.*)、コリストネウラ属(*Choristoneura spp.*)、クリソテウチア・トビアリア(*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ(*Clysia ambigua*)、クナファロクロシス属(*Cnaphalocrocis spp.*)、クネファシア属(*Cnephasia spp.*)、コチリス属(*Cochylis spp.*)、コレオフォラ属(*Coleophora spp.*)、コリアス・レスビア(*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ(*Cosmophila flava*)、クラムバス属(*Crambus spp.*)、ケブカノメイガ(*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア・ロイコトレタ(*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ベルスペクタリス(*Cydalima perspectalis*)、シジア属(*Cydia spp.*)、ジアファニア・ペルスペクタリス(*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属(*Diatraea spp.*)、ジパロブシス・カスタネア(*Diparopsis castanea*)、エアリアス属(*Earias spp.*)、エルダナ・サッカリナ(*Eldana saccharina*)、エフェスチア属(*Epeorus spp.*)；

*hestia* spp.)、エピノチア属(*Epinotia* spp.)、エスチグメネ・アクレア(*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ(*Etiella zinckinella*)、ユーコスマ属(*Eucosma* spp.)、ブドウホソハマキ(*Eupoecilia ambiguella*)、ユープロクチス属(*Euproctis* spp.)、ユークソア属(*Euxoa* spp.)、フェルチア・ジャクリフェリア(*Feltia jaculifera*)、グラホリタ属(*Grapholita* spp.)、ヘディア・ヌビフェラナ(*Hedya nubiferana*)、ヘリオティス属(*Heliothis* spp.)、ハイマダラノメイガ(*Helula undalis*)、ヘルペトグラマ属(*Herpetogramma* spp.)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ(*Lasmopalpus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ(*Leucoptera scitella*)、リトコレチス属(*Lithocolethis* spp.)、ホソバヒメハマキ(*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ビフィダリス(*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属(*Lymantria* spp.)、リオネチア属(*Lyonetia* spp.)、マラコソマ属(*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ(*Manduca sexta*)、ミチムナ属(*Mythimna* spp.)、ノクツニア属(*Noctua* spp.)、オペロフテラ属(*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ(*Orniodes indica*)、アワノメイガ(*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属(*Pammene* spp.)、パンデミス属(*Pandemis* spp.)、マツキリガ(*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス(*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ(*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニブンクタ(*Pseudaleitia unipuncta*)、ジャガイモガ(*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae*)、ピエリス属(*Pieris* spp.)、コナガ(*Plutella xylostella*)、プレイス属(*Prays* spp.)、シュードブルシア属(*Pseudoplusia* spp.)、ラキブルシア・ヌ(*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ(*Richia albicosta*)、シリポファガ属(*Scirpophaga* spp.)、セサミア属(*Sesamia* spp.)、スバルガノチス属(*Sparaganothis* spp.)、スボドプテラ属(*Spodoptera* spp.)、シレブタ・デロガテ(*Sylepta derogata*)、シナンテドン属(*Synanthedon* spp.)、タウメトポエア属(*Thaumetopoea* spp.)、トルトリックス属(*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ(*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ(*Tuta absoluta*)、およびスガ属(*Yponomeuta* spp.);

食毛目(*Mallrophaga*)から、例えば、ダマリネア属(*Damalinea* spp.)およびケモノハジラミ属(*Trichodectes* spp.);

直翅目(*Orthoptera*)から、例えば、ゴキブリ属(*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属(*Blattella* spp.)、ケラ属(*Gryllota lpa* spp.)、マデラゴキブリ(*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属(*Locusta* spp.)、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ(*Neocurtilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属(*Periplaneta* spp.)、スカプテリスカス属(*Scapteriscus* spp.)、およびコオロギ属(*Schistocerca* spp.);

チャタテムシ目(*Psocoptera*)から、例えば、リポセリス属(*Liposcelis* spp.);

ノミ目(*Siphonaptera*)から、例えば、ナガノミ属(*Ceratophy*

10

20

30

30

40

40

50

*l l u s spp.*)、イヌノミ属(*Ctenocephalides spp.*)およびケオプスネズミノミ(*Xenopsylla cheopis*)；

総翅目(*Thysanoptera*)から、例えば、カリオトリップス・ファセオリ(*Calliothrips phaseoli*)、ハナアザミウマ属(*Frankliniella spp.*)、ヘリオトリップス属(*Heliothrips spp.*)、ヘルシノトリップス属(*Hercinothrips spp.*)、パルテノトリップス属(*Parthenothrips spp.*)、シルトトリップス・アウランチイ(*Scirototrips aurantii*)、ダイズアザミウマ(*Sericothrips variabilis*)、タエニオトリップス属(*Taeniothrips spp.*)、アザミウマ属(*Thrips spp.*)；10

シミ目(*Thysanura*)から、例えば、セイヨウシミ(*Lepisma saccharinum*)。

#### 【0108】

本発明に係る活性成分は、特に植物、特に有用な植物および農業、園芸および森林における観賞植物、またはこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎または根などの器官において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち、抑制または破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

#### 【0109】

好適な標的作物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシまたはソルガムなどの穀物；テンサイまたは飼料用ビートなどのビート；果実、例えば、リンゴ、セイヨウナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボまたは液果類、例えばイチゴ、ラズベリーまたはブラックベリーなどの、仁果類、核果類または柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメまたはダイズなどのマメ科作物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオまたはアメリカホドイモ(*ground nut*)などの油脂作物；カボチャ、キュウリまたはメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻またはジュートなどの纖維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツまたはタンジェリンなどの柑橘類の果物；ホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモまたはピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモンまたはショウノウなどのクスノキ科(*Lauraceae*)の植物；およびさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物、およびラテックス植物である。20

#### 【0110】

本発明の組成物および／または方法は、花、低木、広葉樹および常緑樹を含む、任意の観賞植物および／または野菜作物に使用することもできる。

#### 【0111】

例えば、本発明は、以下の観賞植物種のいずれかに使用され得る：カッコウアザミ属(*Ageratum spp.*)、アロンソア属(*Alonsoa spp.*)、イチリンソウ属(*Anemone spp.*)、アニソドンティア・カベンシス(*Anisodon tea capsensis*)、アンセミス属(*Antennaria spp.*)、キンギョソウ属(*Antirrhinum spp.*)、シオン属(*Aster spp.*)、ベゴニア属(*Begonia spp.*)（例えば、エラチオールベゴニア(*B. elatior*)、シキザキベゴニア(*B. semperflorens*)、*B.チュベレウクス*(*B. tubereux*)）、ブーゲンビリア属(*Bougainvillea spp.*)、ブラキスコメ属(*Brachycome spp.*)、アブラナ属(*Brassica spp.*)（観賞植物）、カルセオラリア属(*Calceolaria spp.*)、トウガラシ(*Capsicum annuum*)、ニチニチソウ(*Catharanthus roseus*)、カンナ属(*Canna spp.*)、ヤグルマギク属(*Centaurea spp.*)、キク属(*Chrysanthemum spp.*)、シネラリア属(*Cineraria spp.*)（シロタエギク(*C. maritime*40

50

）、ハルシャギク属（*Coreopsis* spp.）、クラッスラ・コッキネア（*Crassula coccinea*）、クフェア・イグネア（*Cuphea ignea*）、ダリア属（*Dahlia* spp.）、デルフィニウム属（*Delphinium* spp.）、ケマンソウ（*Dicentra spectabilis*）、ドロテアンツス属（*Dorotheanthus* spp.）、トルコギキョウ（*Eustoma grandiflorum*）、レンギョウ属（*Forsythia* spp.）、フクシア属（*Fuchsia* spp.）、ゼラニウム・グナファリウム（*Geranium gnaphalium*）、ガーベラ属（*Gerbera* spp.）、センニチコウ（*Gomphrena globosa*）、キダチルリソウ属（*Heliotropium* spp.）、ヒマワリ属（*Helianthus* spp.）、フヨウ属（*Hibiscus* spp.）、アジサイ属（*Hortensia* spp.）、アジサイ属（*Hydrangea* spp.）、ソバカスソウ（*Hypoestes phyllostachya*）、ツリフネソウ属（*Impatiens* spp.）（アフリカホウセンカ（*I. Walleriana*））、イレシネ属（*Iresines* spp.）、カランコエ属（*Kalanchoe* spp.）、ランタナ（*Lantana camara*）、ハナアオイ（*Lavatera trimestris*）、カエンキセワタ（*Leonotis leonurus*）、ユリ属（*Lilium* spp.）、メセンブリアンテマ属（*Mesembryanthemum* spp.）、ミヅホオズキ属（*Mimulus* spp.）、ヤグルマハッカ属（*Monarda* spp.）、ネメシア属（*Nemesia* spp.）、タゲテス属（*Tagetes* spp.）、ナデシコ属（*Dianthus* spp.）（カーネーション）、カンナ属（*Canna* spp.）、カタバミ属（*Oxalis* spp.）、ヒナギク属（*Bellis* spp.）、テンジクアオイ属（*Pelargonium* spp.）（アイビーゼラニウム（*P. peltatum*））、モンテンジクアオイ（*P. Zonale*））、スミレ属（*Viola* spp.）（パンジー）、ペチュニア属（*Petunia* spp.）、フロックス属（*Phlox* spp.）、プレクトランサス属（*Plectranthus* spp.）、ポインセチア種（*Poinsettia* spp.）、ツタ属（*Parthenocissus* spp.）（アメリカヅタ（*P. quinquefolia*）、ツタ（*P. tricuspidata*））、サクラソウ属（*Primula* spp.）、キンポウゲ属（*Ranunculus* spp.）、ツツジ属（*Rhododendron* spp.）、バラ属（*Rosa* spp.）（バラ）、オオハンゴンソウ属（*Rudbeckia* spp.）、セントポーリア属（*Saintpaulia* spp.）、アキギリ属（*Salvia* spp.）、ブルーファンフラワー（*Scaevola aemula*）、コチョウソウ（*Schizanthus wisetonensis*）、マンネングサ属（*Sedum* spp.）、ナス属（*Solanum* spp.）、サフィニア种（*Surfinia* spp.）、タゲテス属（*Tagetes* spp.）、タバコ属（*Nicotinia* spp.）、バーベナ种（*Verbena* spp.）、ヒヤクニチソウ属（*Zinnia* spp.）および他の花壇用の植物。

## 【0112】

例えは、本発明は、以下の野菜種のいずれかに使用され得る：ネギ属（*Allium* spp.）（ニンニク（*A. sativum*）、タマネギ（*A. cepa*）、エシャロット（*A. oschaninii*）、リーキ（*A. Porrum*）、シャロット（*A. ascalonicum*）、ネギ（*A. fistulosum*））、チャービル（*Anthriscus cerefolium*）、セロリ（*Apium graveolus*）、アスパラガス（*Asparagus officinalis*）、テンサイ（*Beta vulgaris*）、アブラナ属（*Brassica* spp.）（ヤセイカンラン（*B. Oleracea*）、ハクサイ（*B. Pekinensis*）、カブ（*B. rapa*））、トウガラシ（*Capsicum annum*）、ヒヨコマメ（*Cicer arietinum*）、エンダイブ（*Cichorium endivia*）、キクニガナ属（*Cichorium* spp.）（チコリー（*C. intybus*）、エンダイブ（*C. e* 40 50

ndivia) )、スイカ (Citrillus lanatus)、キュウリ属 (Cucumis spp.) (サフラン (C. sativus)、メロン (C. melo))、カボチャ属 (Cucurbita spp.) (ペポカボチャ (C. pepo)、西洋カボチャ (C. maxima))、チョウセンアザミ属 (Cyanara spp.) (アーティチョーク (C. scolymus)、カルドン (C. cardunculus))、黒人参 (Daucus carota)、フェンネル (Foeniculum vulgare)、オトギリソウ属 (Hypericum spp.)、レタス (Lactuca sativa)、トマト属 (Lycopersicon spp.) (トマト (L. esculentum)、トマト (L. lycopersicum))、ハツカ属 (Mentha spp.)、バジル (Ocimum basilicum)、パセリ (Petroselinum crispum)、インゲンマメ属 (Phaseolus spp.) (インゲンマメ (P. vulgaris)、ベニバナインゲン (P. coccineus))、エンドウ (Pisum sativum)、ハツカダイコン (Raphanus sativus)、マルバダイオウ (Rheum rhaponticum)、マンネンロウ属 (Rosmarinus spp.)、アキギリ属 (Salvia spp.)、キバナバラモンジン (Scorzonera hispanica)、ナス (Solanum melongena)、ホウレンソウ (Spinacea oleracea)、ノヂシヤ属 (Valerianella spp.) (ノヂシヤ (V. locusta)、イタリアンコーンサラダ (V. eriocarpa)) およびソラマメ (Vicia faba)。

10

## 【0113】

好ましい観賞植物種としては、セントポーリア (African violet)、ベゴニア属 (Begonia)、ダリア属 (Dahlia)、ガーベラ属 (Gerbera)、アジサイ属 (Hydrangea)、クマツヅラ属 (Verbenae)、バラ属 (Rosa)、カラシコエ属 (Kalanchoe)、ポインセチア (Poinsettia)、シオン属 (Aster)、ヤグルマギク属 (Centaurea)、ハルシャギク属 (Coreopsis)、デルフィニウム属 (Delphinium)、ヤグルマハッカ属 (Monarda)、フロックス属 (Phlox)、オオハンゴンソウ属 (Rudbeckia)、マンネングサ属 (Sedum)、ペチュニア属 (Petunia)、スミレ属 (Viola)、ツリフネソウ属 (Impatiens)、フウロソウ属 (Geranium)、キク属 (Chrysanthemum)、キンポウゲ属 (Ranunculus)、フクシア属 (Fuchsia)、アキギリ属 (Salvia)、アジサイ属 (Hortensia)、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリ (St. Johnswort)、ミント、ピーマン、トマトおよびキュウリが挙げられる。

20

## 【0114】

本発明に係る活性成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネおよびダイズ作物におけるマメアブラムシ (Aphis craccivora)、ディアブロチカ・バルテアタ (Diabrotica balteata)、ニセアメリカタバコガ (Heliothis virescens)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)、コナガ (Plutella xylostella) およびエジプトヨトウ (Spodoptera littoralis) を防除するのに特に好適である。本発明に係る活性成分はさらに、マメストラ属 (Mamestra) (好ましくは、野菜中)、コドリンガ (Cydia pomonella) (好ましくは、リンゴ中)、エンポアスカ属 (Empoasca) (好ましくは、野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (Leptinotarsa) (好ましくは、ジャガイモ中) およびニカメイガ (Chilo suppressalis) (好ましくは、イネ中) を防除するのに特に好適である。

30

## 【0115】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫 (内部寄生性、半内部寄生性および外部寄生性線虫)、特に、ネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ (Meloiodogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ (Meloiodogyne inc

40

50

ognita)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloiodogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloiodogyne arenaria*) および他のメロイドギネ属 (*Meloiodogyne*) 種；シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ (*Globodera rostochiensis*) および他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種；ムギシストセンチュウ (*Heteroderaavenae*)、ダイズシストセンチュウ (*Heterodera glycines*)、テンサイシストセンチュウ (*Heterodera schachtii*)、クローバシストセンチュウ (*Heterodera trifolii*)、および他のヘテロデラ属 (*Heterodera*) 種；タネコブセンチュウ、アンギナ属 (*Anguina*) 種；クキセンチュウおよびハセンチュウ、アフェレンコイデス属 (*Aphelenchoides*) 種；刺毛センチュウ (*Sting nematode*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス (*Belonolaimus longicaudatus*) および他のベロノライムス属 (*Belonolaimus*) 種；マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ (*Bursaphelenchus xylophilus*) および他のバーサフェレンカス属 (*Bursaphelenchus*) 種；ワセンチュウ (*Ring nematode*)、クリコネマ属 (*Criconema*) 種、クリコネメラ属 (*Criconemella*) 種、クリコネモイデス属 (*Criconemoïdes*) 種、メソクリコネマ属 (*Mesocriconema*) 種；クキおよびリンクイセンチュウ、イモグサレセンチュウ (*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ (*Ditylenchus dipsaci*) および他のジチレンクス属 (*Ditylenchus*) 種；キリセンチュウ (*Awl nematode*)、ドリコドルス属 (*Dolichodorus*) 種；ラセンセンチュウ (*Spiral nematode*)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス (*Helicotylenchus multicinctus*) および他のヘリオコチレンクス属 (*Helicotylenchus*) 種；サヤセンチュウおよびサヤワセンチュウ (*Sheath and sheathoid nematode*)、ヘミシクリオホラ属 (*Hemicycliophora*) 種およびヘミクリコネモイデス属 (*Hemicriconemoïdes*) 種；ヒルスマニエラ属 (*Hirshmanniella*) 種；ヤリセンチュウ (*Lance nematode*)、ホプロライムス (*Hoploaimus*) 種；ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (*Nacobbus*) 種；ハリセンチュウ (*Needle nematode*)、ロンギドルス・エロンガツス (*Longidorus elongatus*) および他のロンギドルス属 (*Longidorus*) 種；ピンセンチュウ (*Pin nematode*)、プラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種；ネグサレセンチュウ (*Lesion nematode*)、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・カービタツス (*Pratylenchus curvitatus*)、プラチレンクス・ゴオディ (*Pratylenchus goodeyi*) および他のプラチレンクス属 (*Pratylenchus*) 種；ネモグリセンチュウ (*Burrowing nematode*)、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) および他のラドホルス属 (*Radopholus*) 種；ニセフクロセンチュウ (*Reniform nematode*)、ロチレンクス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・レニフォルミス (*Rotylenchus reniformis*) および他のロチレンクス属 (*Rotylenchus*) 種；スクテロネマ属 (*Scutellonema*) 種；ミハリセンチュウ (*Stubby root nematode*)、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitus*) および他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種；イシュクセンチュウ (*Stunt nematode*)、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・デュビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) および他のチレンコリンクス属 (*Tylenchorhynchus*) 種；

s) 種；ミカンセンチュウ (*Citrus nematode*)、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) 種；オオハリセンチュウ (*Dagger nematode*)、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫；ならびにスバンギナ属 (*Subanguina spp.*)、ヒプソペリン属 (*Hypsoperine spp.*)、マクロポストニア属 (*Macroposthonia spp.*)、メリニウス属 (*Melinius spp.*)、プンクトデラ属 (*Punctodera spp.*)、およびキニスルシウス属 (*Quinislucus spp.*) などの他の植物寄生性線虫種による植物および植物の部分への被害を防除する方法にも関する。

## 【0116】

本発明の化合物は、軟体動物に対しても活性を有し得る。軟体動物の例としては、例えば、スクミリンゴガイ科 (*Ampullariidae*)；アリオン属 (*Arion*) (コウラクロナメクジ (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーファス* (*A. rufus*))；オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (ブラジバエナ・フルチクム (*Bradybaena fruticum*))；オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (ニワノオウシュウマイマイ (*C. hortensis*)、モリマイマイ (*C. Nemoralis*))；オクロジナ (*Ochlodina*)；デロセラス属 (*Deroceras*) (D. アグレスチス (*D. agrestis*)、D. エムピリコルム (*D. empiricorum*)、D. ラエヴェ (*D. laeve*)、D. レチクラツム (*D. reticulatum*))；ディスクス属 (*Discus*) (D. ロツンダツス (*D. rotundatus*))；ユーオムファリア属 (*Euomphalia*)；ガルバ属 (*Galba*) (G. トルンクラタ (*G. trunculata*))；ヘリセリア属 (*Helicelia*) (H. イタラ (*H. itala*)、H. オブヴィア (*H. obvia*))；マイマイ科 (*Helicidae*) ヘリシゴナ・アルブストルム (*Helicigona arbustorum*))；ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*)；ヘリクス属 (*Helix*) (H. アペルタ (*H. aperta*))；リマックス属 (*Limax*) (L. シネレオニゲル (*L. cinereoniger*)、キイロナメクジ (*L. flavus*)、チャコウラナメクジ (*L. marginatus*)、マダラコウラナメクジ (*L. maximus*)、L. テネルス (*L. tenellus*))；モノアライガイ属 (*Lymnaea*)；ミラックス属 (*Milax*) (ニワコウラナメクジ (*M. gagates*)、M. マルギナツス (*M. marginatus*)、M. ソウェルビイ (*M. sowerbyi*))；オペアス属 (*Opeas*)；リンゴガイ属 (*Pomacea*) (スクミリンゴガイ (*P. canaliculata*))；ミジンマイマイ属 (*Vallonia*) およびザニトイデス属 (*Zanitooides*) が挙げられる。

## 【0117】

「作物」という用語は、例えば、毒素産生細菌、特に、バチルス属 (*Bacillus*) の細菌に由来する公知のような 1 つまたは複数の選択的に作用する毒素を合成することができるよう、組み換え DNA 技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。

## 【0118】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) またはバチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*) に由来する殺虫タンパク質；または - エンドトキシン、例えば *Cry1Ab*、*Cry1Ac*、*Cry1F*、*Cry1Fa2*、*Cry2Ab*、*Cry3A*、*Cry3Bb1* または *Cry9C* などの、バチルス・チューリングンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫タンパク質、または植物性殺虫タンパク質 (*Vip*)、例えば、*Vip1*、*Vip2*、*Vip3* または *Vip3A*；または細菌コロニー形成線虫、例えば、フォトラブダス・ルミネセンス (*Photorhabdus luminescens*)、キセノラブダス・ネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などのフォトラブダス属 (*Photorhabd*

10

20

30

30

40

40

50

u s s p p . またはキセノラブダス属 (*Xenorhabdus spp.*) の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素および他の昆虫に特有の神経毒素などの、動物によって產生される毒素；ストレプトマイセス属 (*Streptomyces*) 毒素などの、真菌によって產生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチンまたはユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ - R I P 、アブリン、ルフィン、サポリンまたはブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (R I P) ; 3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド - U D P - グリコシリ - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、H M G - C O A - レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャネルまたはカルシウムチャネルの遮断薬などのイオンチャネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

#### 【0119】

本発明に関して、 - エンドトキシンは、例えば *Cry1Ab* 、 *Cry1Ac* 、 *Cry1F* 、 *Cry1Fa2* 、 *Cry2Ab* 、 *Cry3A* 、 *Cry3Bb1* または *Cry9C* 、または植物性殺虫タンパク質 (*Vip*) 、例えば *Vip1* 、 *Vip2* 、 *Vip3* または *Vip3A* 、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素 (*truncated toxin*) および改変毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより產生される（例えば、国際公開第02/15701号パンフレットを参照）。切断毒素、例えば、切断 *Cry1Ab* が公知である。改変毒素の場合、天然毒素の1つまたは複数のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が、毒素に挿入され、例えば、*Cry3A055* の場合、カテプシン - G - 認識配列が、*Cry3A* 毒素に挿入される（国際公開第03/018810号パンフレットを参照）。

#### 【0120】

このような毒素またはこのように毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第A0374753号明細書、国際公開第93/07278号パンフレット、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A0427529号明細書、欧州特許出願公開第A451878号明細書および国際公開第03/052073号パンフレットに開示されている。

#### 【0121】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。*CryI* 型のデオキシリボ核酸およびそれらの調製が、例えば、国際公開第95/34656号パンフレット、欧州特許出願公開第A0367474号明細書、欧州特許出願公開第A0401979号明細書および国際公開第90/13651号パンフレットから公知である。

#### 【0122】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、甲虫（鞘翅目 (*Coleoptera*) ）、双翅昆虫（双翅目 (*Diptera*) ）および蛾（鱗翅目 (*Lepidoptera*) ）において特に一般的に見られる。

#### 【0123】

殺虫剤耐性 (*insecticidal resistance*) をコードし、1つまたは複数の毒素を発現する1つまたは複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、*Yield Guard* (登録商標) (*Cry1Ab* 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; *Yield Guard Rootworm* (登録商標) (*Cry3Bb1* 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; *Yield Guard Plus* (登録商標) (*Cry1Ab* および *Cry3Bb1* 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; *Starlink* (登録商標) (*Cry9C* 毒素を発現す

10

20

30

40

50

るトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (Cry1Fa2毒素、および除草剤グルホシネットアンモニウムに対する耐性を得るために酵素ホスフィノトリシンN-アセチルトランスフェラーゼ(PAT)を発現するトウモロコシ品種) ; NuCOT N 33B (登録商標) (Cry1Ac毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard I (登録商標) (Cry1Ac毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard II (登録商標) (Cry1AcおよびCry2Ab毒素を発現するワタ品種) ; VipCot (登録商標) (Vip3AおよびCry1Ab毒素を発現するワタ品種) ; NewLeaf (登録商標) (Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種) ; NatureGard (登録商標) 10 ; Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート耐性形質) ; Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11アワノメイガ(CB)形質) およびProtecta (登録商標) である。

#### 【0124】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである :

1. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製のBt11トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。切断Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現によって、ヨーロッパアワノメイガ(アワノメイガ(Ostrinia nubilalis) およびセサミア・ノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、除草剤グルホシネットアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。 20

#### 【0125】

2. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製のBt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現によって、ヨーロッパアワノメイガ(アワノメイガ(Ostrinia nubilalis) およびセサミア・ノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides))による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt176トウモロコシは、除草剤グルホシネットアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。 30

#### 【0126】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France) 製のMIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。変異Cry3A毒素のトランスジェニック発現によって、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテーテン-G-プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾されたCry3A055である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第03/018810号パンフレットに記載されている。

#### 【0127】

4. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のMON 863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON 863は、Cry3Bb1毒素を発現し、特定の鞘翅目(Coleoptera)昆虫に対する耐性を有する。 40

#### 【0128】

5. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のIPC 531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

#### 【0129】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウ 50

モロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目(*Lepidoptera*)昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1Fおよび除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。

【0130】

7. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のNK603×MON810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え品種NK603およびMON810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603×MON810トウモロコシは、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサートを含有する)に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属(*Agrobacterium* sp.)菌株CP4から得られるタンパク質CP4EPSPS、およびヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目(*Lepidoptera*)に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングンシス亜種クルスターキ(*Bacillus thuringiensis* subsp.*kurstakii*)から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。  
10

【0131】

昆虫耐性植物のトランスジェニック作物は、BATS(Zentrum fuer Biosticherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003, (<http://bats.ch>)にも記載されている。  
20

【0132】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば、欧州特許出願公開第A0392225号明細書を参照)などの、選択的作用を有する抗病原性物質(antipathogenic substance)を合成することができるよう、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質およびこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第A0392225号明細書、国際公開第95/33818号パンフレットおよび欧州特許出願公開第A0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。  
30

【0133】

作物はまた、真菌(例えばフザリウム属(*Fusarium*)、炭疽病、またはエキビヨウキン(*Phytophthora*))、細菌(例えばショードモナス属(*Pseudomonas*))またはウイルス(例えばジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊死ウイルス、キュウリモザイクウイルス)病原体に対する向上した耐性のために改質され得る。

【0134】

作物は、ダイズシストセンチュウなどの線虫に対する向上した耐性を有する作物も含む。  
40

【0135】

非生物的ストレスに対して耐性がある作物は、例えばNF-YBまたは当該技術分野において公知の他のタンパク質の発現を介して、乾燥、高い塩分、高温、寒気、霜、または光放射に対する向上した耐性を有する作物を含む。

【0136】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャネルまたはカルシウムチャネルの遮断薬などのイオンチャネル遮断薬、例えばウイルス性KP1、KP4またはKP6毒素；スチルベンシンターゼ；ビベンジルシンターゼ；キチナーゼ；グルカナーゼ；いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP  
50

; 例えば、欧州特許出願公開第 A 0 3 9 2 2 2 5 号明細書を参照) ; 微生物によって産生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質または複素環式抗生物質(例えば、国際公開第 9 5 / 3 3 8 1 8 号パンフレットを参照)または植物病原体防御に関するタンパク質またはポリペプチド因子(国際公開第 0 3 / 0 0 0 9 0 6 号パンフレットに記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」)が挙げられる。

#### 【0137】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品および貯蔵室の保護および原料(木材および織物など)、床仕上げ材および建築物の保護、および衛生分野において、特に、上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜および生産性家畜(*productive livestock*)の保護である。 10

#### 【0138】

本発明は、有害生物(蚊および他の病原媒介動物など; [http://www.who.int/malaria/vector\\_control/irs/en/](http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/)も参照)を防除するための方法も提供する。一実施形態において、有害生物を防除するための方法は、本発明の組成物を、標的有害生物に、その生息地に、または表面もしくは基材に、ブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布または浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井または床面などの表面の IRS(屋内残留噴霧)施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、このような組成物を、網、衣類、寝具、カーテンおよびテントの形態(またはこれらの製造に使用され得る形態)の不織布または布帛材料などの基材に施用することが想定されている。 20

#### 【0139】

一実施形態において、このような有害生物を防除するための方法は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面または基材に与えるように、殺有害生物的に有効な量の本発明の組成物を、標的有害生物に、その生息地に、または表面もしくは基材に施用する工程を含む。このような施用は、本発明の殺有害生物組成物をブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布または浸漬することによって行われ得る。例として、壁、天井または床面などの表面における IRS 施用は、有効な残存性の有害生物防除活性を表面に与えるように、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態において、網、衣類、寝具、カーテンおよびテントの形態(またはこれらの製造に使用され得る形態)の布帛材料などの基材における有害生物の残存性防除のためにこのような組成物を施用することが想定されている。 30

#### 【0140】

処理されるべき不織布、布帛または網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布もしくは羊毛などの天然纖維、またはポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成纖維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第 2 0 0 8 / 1 5 1 9 8 4 号パンフレット、国際公開第 2 0 0 3 / 0 3 4 8 2 3 号パンフレット、米国特許第 5 6 3 1 0 7 2 号明細書、国際公開第 2 0 0 5 / 6 4 0 7 2 号パンフレット、国際公開第 2 0 0 6 / 1 2 8 8 7 0 号パンフレット、欧州特許第 1 7 2 4 3 9 2 号明細書、国際公開第 2 0 0 5 / 1 1 3 8 8 6 号パンフレットまたは国際公開第 2 0 0 7 / 0 9 0 7 3 9 号パンフレットから公知である。 40

#### 【0141】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、全ての観賞用樹木ならびにあらゆる種類の果樹および堅果の成る木の樹幹注入/幹処理の分野である。

#### 【0142】

樹幹注入/幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目(*Lepidoptera*)および鞘翅目(*Coleoptera*)の木材穿孔性(*wood-boring*)昆虫に対して、特に、以下の表AおよびBに列挙される木材穿孔性昆虫(*woodborer*)に対して特に好適である。

#### 【0143】

【表4】

表A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主または作物
タマムシ科(Buprestidae)	アオナガタマムシ( <i>Agrilus planipennis</i> )	セイヨウトネリコ
カミキリムシ科(Cerambycidae)	アノプルラ・グラブリペンニス( <i>Anoplura glabripennis</i> )	広葉樹
キクイムシ科(Scolytidae)	サクキクイムシ( <i>Xylosandrus crassiusculus</i> )	広葉樹
	クスノキオオキクイムシ( <i>X. multifilatus</i> )	広葉樹
	マツノキクイムシ( <i>Tomicus piniperda</i> )	針葉樹

10

【0144】

【表5】

表B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主または作物
タマムシ科(Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス( <i>Agrilus anxius</i> )	カバノキ
	アグリルス・ポリツス( <i>Agrilus politus</i> )	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ( <i>Agrilus sayi</i> )	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス( <i>Agrilus vittaticollis</i> )	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、サービスベリー、サンザシ
	クリソボトリス・フェモラタ( <i>Chrysobothris femorata</i> )	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカエデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニレ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナナカマド、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マルメロ、アメリカハナズオウ、サービスベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ
	テキサニア・カンペストリス( <i>Texania campestris</i> )	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ

20

30

40

カミキリムシ科 (Cerambycidae) )	ゴエス・プルベルレンツス ( <i>Goes pulverulentus</i> )	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall l)、ヤナギ、クロガシワ、アメリカキレハガシワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、スズカケノキ	10 20 30 40
	ゴエス・チグリヌス( <i>Goes tigrinus</i> )	オーク	
	ネオクリツス・アクミナツス ( <i>Neoclytus acuminatus</i> )	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オーク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、イースタンホップホーンビーム(Eastern hop hornbeam)、ハナミズキ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハリグワ、サッサフラス、ライラック、マウンテン・マホガニー、セイヨウナシ、サクランボ、プラム、モモ、リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ	
	ネオプチコデス・トリリネツス ( <i>Neoptychodes trilineatus</i> )	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry)	
	オベレア・オセラータ ( <i>Oberea ocellata</i> )	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイヨウナシ、スグリ、ブラックベリー(Blackberry)	
	オベレア・トリpunktタータ ( <i>Oberea tripunctata</i> )	ハナミズキ、ガマズミ属(Viburnum)、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ	
	オンシデレス・シングラータ ( <i>Oncideres cingulata</i> )	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属(Eucalyptus)、オーク、エノキ、カエデ、果樹	
	サペルダ・カルカラタ ( <i>Saperda calcarata</i> )	ボプラ	
	ストロフィオナ・ニテンス ( <i>Strophiona nitens</i> )	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ	

キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コルンビアヌス ( <i>Corthylus columbianus</i> )	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ	10
	デンドロクトヌス・フロンタリス ( <i>Dendroctonus frontalis</i> )	マツ	
	ドリオコエテス・ベツラエ ( <i>Dryocoetes betulae</i> )	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ	
	モナルトルム・ファスシアツム ( <i>Monarthrum fasciatum</i> )	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ	
	フロエオトリブス・リミナリス ( <i>Phloeotribus liminaris</i> )	モモ、サクランボ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クリ、ナナカマド	
スカシバガ科 (Sesiidae)	シュードピチオフトルス・ブルイノスス( <i>Pseudopityophthorus pruinosus</i> )	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム( <i>C hickasaw plum</i> )、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ	20
	パラントレネ・シムラヌス ( <i>Paranthrene simulans</i> )	オーク、アメリカグリ	
	サンニナ・ウロセリフォルミス ( <i>Sannina uroceriformis</i> )	カキ	
	シナンテドン・エキシチオサ ( <i>Synanthedon exitiosa</i> )	モモ、プラム、ネクタリン、サクランボ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ	
	シナンテドン・ピクチペス ( <i>Synanthedon pictipes</i> )	モモ、プラム、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ	
	シナンテドン・ルプロファスシア ( <i>Synanthedon rubrofascia</i> )	アメリカヌマミズキ	
	シナンテドン・シツラ ( <i>Synanthedon scitula</i> )	ハナミズキ、ベカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属( <i>Viburnum</i> )、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ	
【 0 1 4 5 】	ビタセア・ポリスチフォルミス ( <i>Vitacea polistiformis</i> )	ブドウ	30
	本発明はまた、例えば甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ ( g r o u n d p e a r l ) 、ヤステ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、マダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバグ ( s ou t h e r n c h i n c h b u g ) および地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。本発明は、卵、幼虫、若虫および成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。		
【 0 1 4 6 】	特に、本発明は、地虫 (コガネカブト属 ( <i>C y c l o c e p h a l a</i> spp . ) ( 例えれば、マスクドコガネムシ ( m a s k e d c h a f e r ) 、 C . ルリダ ( <i>C . l u r i</i> 50		40

d a ) )、リゾトロゴス属 (*Rhizotrogus spp.*) (例えば、ヨーロピアンコガネムシ、*R. majalis* ) )、コチヌス属 (*Cotinus spp.*) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida* ) )、ポピリア属 (*Popillia spp.*) (例えば、マメコガネ (*Japanese beetle*)、マメコガネ (*P. japonica*) )、フィロファガ属 (*Phyllophaga spp.*) (例えば、コガネムシ (*May / June beetle*) )、アテニウス属 (*Ataenius spp.*) (例えば、ブラック・ターフグラス・アテニウス (*Black turfgrass ataenius*)、*A. spretulus* ) )、マラデラ属 (*Maladera spp.*) (例えば、アカビロウドコガネ、*M. castanea* ) )およびトマルス属 (*Tomarus spp.*) 10 など)、ワタフキカイガラムシ (マルガロデス属 (*Margarodes spp.*) )、ケラ (タウニー (*tawny*)、サウザン (*southern*)、および短翅型; スカプテリスクス属 (*Scapteriscus spp.*)、ケラ (*Gryllotalpa africana*) ) およびレザージャケット (*leather jacket*) (ヨーロピアンクレーンフライ (*European crane fly*)、ガガソボ属 (*Tipula spp.*) ) を含む、芝草の根を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。

## 【0147】

本発明はまた、ヨトウムシ (*Spodoptera frugiperda*)、および一般的なヨトウムシ (*common armyworm*) (プセウダレチア・ウニブンクタ (*Pseudaletia unipuncta*) など)、ネキリムシ、ゾウムシ (スフェノホルス属 (*Sphenophorus spp.*)、シバオサゾウムシ (*S. venatus versitus*) および *S. parvulus* ) など)、およびソッドウェブワーム (*sod webworm*) (クラムブス属 (*Crambus spp.*) および熱帯ソッドウェブワーム (*tropical sod webworm*)、ケナシクロオビクロノメイガ (*Herpetogramma phaeopteralis*) など) を含む、藁に住む芝草の昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。 20

## 【0148】

本発明はまた、ヒメコガネナガカメムシ (サウザンキンクバッグ、ブリスス・インスラリス (*Blissus insularis*) など)、ギヨウギシバ (*Bermudagrass*) のダニ (エリオフィエス・シノドニエンシス (*Eriophyes cynodonensis*) )、アフリカヒゲシバ (*rhodes grass*) のコナカイガラムシ (チガヤシロオカイガラムシ (*Antonina graminis*) )、2本線のあるアワフキムシ (*two-lined spittlebug*) (プロサピア・ビシンクタ (*Propsapia bicincta*) )、ヨコバイ、ネキリムシ (ヤガ科 (*Noctuidae*) )、およびムギミドリアブラムシを含む、地上に生息し、芝草の葉を餌とする昆虫有害生物を防除するのに使用され得る。 30

## 【0149】

本発明はまた、芝生にアリ塚を作製するアカヒアリ (*Solenopsis invicta*) などの、芝草の他の有害生物を防除するのに使用され得る。 40

## 【0150】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (*hard tick*)、ヒメダニ (*soft tick*)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエおよび舐性 (*licking*) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミおよびノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

## 【0151】

このような寄生生物の例は以下のとおりである:

シラミ目 (*Anoplurida*) のうち: ブタジラミ属 (*Haematopinusspp.*)、ホソジラミ属 (*Linognathus spp.*)、ペディクルス属 (50

*Pediculus spp.*) およびケジラミ属 (*Phthirus spp.*)、ソレノポテス属 (*Solenopotes spp.*)。

#### 【0152】

ハジラミ目 (*Mallophagida*) のうち：トリメノポン属 (*Trimenopon spp.*)、タンカクハジラミ属 (*Menopon spp.*)、トリノトン属 (*Trinoton spp.*)、ボビコラ属 (*Bovicola spp.*)、ウェルネッキエラ属 (*Werneckiella spp.*)、レピケントロン属 (*Lepikeptron spp.*)、ダマリナ属 (*Damalina spp.*)、トリコデクテス属 (*Trichodectes spp.*) およびフェリコラ属 (*Felicola spp.*)。 10

#### 【0153】

双翅目 (*Diptera*) ならびにその亜目であるネマトセリナ亜目 (*Nematocerina*) および短角亜目 (*Brachycerina*) のうち、例えば、ヤブカ属 (*Aedes spp.*)、ハマダラカ属 (*Anopheles spp.*)、イエカ属 (*Culex spp.*)、ブヨ属 (*Simulium spp.*)、ツノマユブユ属 (*Eusimulium spp.*)、サシチョウバエ属 (*Phlebotomus spp.*)、ルツォミヤ属 (*Lutzomyia spp.*)、キュリコイデス属 (*Culicoides spp.*)、メクラアブ属 (*Chrysops spp.*)、ヒボミトラ属 (*Hybomitra spp.*)、キイロアブ属 (*Atylotus spp.*)、アブ属 (*Tabanus spp.*)、ゴマフアブ属 (*Haematopota spp.*)、フィリポミア属 (*Philopomyia spp.*)、ブラウラ属 (*Braula spp.*)、イエバエ属 (*Musca spp.*)、トゲアシメマトイ属 (*Hydrotaea spp.*)、サシバエ属 (*Stomoxys spp.*)、ヘマトビア属 (*Haematobia spp.*)、モレリア属 (*Morellia spp.*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia spp.*)、ツェツエバエ属 (*Glossina spp.*)、オオクロバエ属 (*Calliphora spp.*)、キンバエ属 (*Lucilia spp.*)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia spp.*)、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia spp.*)、ニクバエ属 (*Sarcophaga spp.*)、ヒツジバエ属 (*Oestrus spp.*)、ウシバエ属 (*Hypoderma spp.*)、ウマバエ属 (*Gasterophilus spp.*)、シラミバエ属 (*Hippobosca spp.*)、シカシラミバエ属 (*Lipoptena spp.*) およびヒツジシラミバエ属 (*Melophagus spp.*)。 30

#### 【0154】

ノミ目 (*Siphonapterida*) のうち、例えば、ヒトノミ属 (*Pulex spp.*)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides spp.*)、ネズミノミ属 (*Xenopsylla spp.*)、ナガノミ属 (*Ceratophyllus spp.*)。

#### 【0155】

異翅目 (*Heteropterida*) のうち、例えば、トコジラミ属 (*Cimex spp.*)、サシガメ属 (*Triatomae spp.*)、ロドニウス属 (*Rhodnius spp.*)、パンストロギルス属 (*Panstrongylus spp.*)。 40

#### 【0156】

ゴキブリ目 (*Blattaria*) のうち、例えば、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattelagermanica*) およびスペラ属 (*Supella spp.*)。

#### 【0157】

ダニ亜綱 (*Acaria (Acarida)*) ならびにマダニ亜目 (*Metastigmata*) および中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えば、ナガヒメダニ属 (*Argas spp.*)、カズキダニ属 (*Ornithodoros spp.*)。 50

、オトビウス属(*Otobius spp.*)、タネガタマダニ属(*Ixodes spp.*)、キララマダニ属(*Amblyomma spp.*)、ウシマダニ属(*Boophilus spp.*)、カクマダニ属(*Dermacentor spp.*)、チマダニ属(*Haemophysalis spp.*)、イボマダニ属(*Hyalomma spp.*)、コイタマダニ属(*Rhipicephalus spp.*)、デルマニスス属(*Dermanyssus spp.*)、ライリエチア属(*Railletia spp.*)、ニューモニスス属(*Pneumonyssus spp.*)、ステルノストマ属(*Sternostoma spp.*)およびバロア属(*Varroa spp.*)。

## 【0158】

ダニ目(*Actinedida*) (前氣門類(*Prostigmata*)) およびカイチュウ目(*Acaridida*) (コナダニ亜目(*Astigmata*)) のうち、例えば、アカラピス属(*Acarapis spp.*)、ツメダニ属(*Cheyletiella spp.*)、オルニソケイレチア属(*Ornithocheyletia spp.*)、ミオビア属(*Myobia spp.*)、ヒツジツメダニ属(*Psorergates spp.*)、ニキビダニ属(*Demodex spp.*)、ツツガムシ属(*Trombicula spp.*)、リストロホルス属(*Listrophorus spp.*)、コナダニ属(*Acarus spp.*)、チロファグス属(*Tyrophagus spp.*)、ゴミコナダニ属(*Caloglyphus spp.*)、ヒポデクテス属(*Hypodectes spp.*)、pteロリクス属(*Pterolichus spp.*)、キュウセンヒゼンダニ属(*Psoroptes spp.*)、ショクヒヒゼンダニ属(*Chorioptes spp.*)、ミニヒゼンダニ属(*Otodectes spp.*)、ヒゼンダニ属(*Sarcopotes spp.*)、ショウセンコウヒゼンダニ属(*Notoedres spp.*)、クネミドコプテス属(*Knemidocoptes spp.*)、シトジテス属(*Cytodites spp.*) およびラミノシオプテス属(*Laminoсиoptes spp.*)。

## 【0159】

本発明に係る組成物はまた、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙および厚紙、皮革、床仕上げ材および建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのに好適である。

## 【0160】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ(*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス(*Chlorophorus pilosiss*)、アノビウム・ブンクタツム(*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム(*Xestobium rufovillosum*)、ブチリヌスペクチコルニス(*Ptilinus specticornis*)、デンドロビウム・ペルチネクス(*Dendrobiumpertinex*)、マツザイシバンムシ(*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ(*Prionium carpini*)、ヒラタキクイムシ(*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ(*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ(*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ(*Lyctus linearis*)、リクトス・ブベセンス(*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・エクアレ(*Trogoxyylonaequale*)、ミンテスルギコリス(*Minthesrugicollis*)、キシリボルス属種(*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種(*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス(*Apate monachus*)、ボストリクス・カブシニス(*Bostrychus capucinus*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス(*Heterobostrichus brunneus*)、シノキシロン属種(*Sinoxylon spec.*) およびチビタケナガシンクイムシ(*Dinoderus minutus*)などの甲虫、ならびにさらにコルリキバチ(*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ(*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイ

10

20

20

30

40

40

50

グヌス (*Urocerus gigas taignus*) およびウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (*hymenopteran*)、ならびにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kalotermes flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heterotermes indicola*)、キアシシロアリ (*Reticulitermes flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Mastotermes darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) およびイエシロアリ (*Coptotermes formosanus*) などのシロアリ、ならびにセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) などのシミ。  
10

#### 【0161】

本発明に係る化合物は、非修飾形態で有害生物防除剤として使用され得るが、それらは、一般に、担体、溶媒および表面活性物質などの製剤化補助剤を用いて、様々な方法で組成物へと製剤化される。製剤は、様々な物理的形態、例えば粉剤、ゲル、水和剤、水和性粒剤、水分散性錠剤、発泡性ペレット (*effervescent pellet*)、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物 (*microemulsifiable concentrate*)、水中油乳剤、油性フロアブル剤 (*oil-flowable*)、水性分散液、油性分散液、サスペンション (*suspension*)、カプセル懸濁剤、乳化性粒剤、可溶性液体、水溶性濃縮物 (担体として水または水混和性有機溶媒を含む)、含浸ポリマーフィルム (*impregnated polymer film*) の形態または例えば *the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010)* から公知の他の形態であり得る。このような製剤は、直接使用されるかまたは使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量栄養素、生物有機体、油または溶媒を用いて行われ得る。  
20

#### 【0162】

製剤は、微粉化された固体、粒剤、液剤、分散液または乳剤の形態の組成物を得るために、例えば活性成分を製剤化補助剤と混合することによって調製され得る。活性成分はまた、微粉化された固体、鉛油、植物もしくは動物由来の油、植物もしくは動物由来の変性油、有機溶媒、水、表面活性物質またはそれらの組合せなどの他の補助剤とともに製剤化され得る。  
30

#### 【0163】

活性成分はまた、微細なマイクロカプセル中に含有され得る。マイクロカプセルは、多孔質担体中に活性成分を含有する。これにより、活性成分を制御された量で環境中に放出させることができる (例えば持続放出)。マイクロカプセルは、通常、0.1 ~ 500 μm の直径を有する。マイクロカプセルは、カプセル重量の約 25 ~ 95 重量 % の量で活性成分を含有する。活性成分は、モノリシック固体 (*monolithic solid*) の形態、固体もしくは液体分散体中の微粒子の形態または好適な溶液の形態であり得る。封入用の膜は、例えば、天然もしくは合成ゴム、セルロース、スチレン / ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリ尿素、ポリウレタンまたは化学修飾ポリマーおよびデンプンキサンテート (*starch xanthate*) または当業者に公知の他のポリマーを含み得る。あるいは、活性成分が基剤の固体マトリクス中に微粉化された粒子の形態で含まれた微細なマイクロカプセルが形成され得るが、このマイクロカプセル自体は封入されない。  
40

#### 【0164】

本発明に係る組成物の調製に好適な製剤化補助剤はそれ自体公知である。液体担体として、以下のものが使用され得る: 水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセ  
50

トン、メチルエチルケトン、シクロヘキサン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、炭酸ブチレン、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、ジエチレングリコールアビエート、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトル(diproxitol)、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサン、炭酸エチレン、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、-ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、-ブチロラクトン、グリセロール、酢酸グリセロール、二酢酸グリセロール、三酢酸グリセロール、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、酸化メシチル、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、o-キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、乳酸プロピル、炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p-キシレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、ペルクロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、メタノール、エタノール、イソプロパノール、およびアミルアルコール、テトラヒドロフルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノールなどのより高い分子量のアルコール、エチレングリコール、プロピレングリコール、グリセロール、N-メチル-2-ピロリドンなど。

## 【0165】

好適な固体担体は、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石粘土、シリカ、アタパルジャイト粘土、珪藻土、石灰石、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシウムモンモリロナイト、綿実殻、小麦粉、大豆粉、軽石、木粉、粉碎されたクルミ殻、リグニンおよび同様の物質である。

## 【0166】

多くの表面活性物質が、固体および液体製剤の両方中、特に、使用前に担体で希釈され得る製剤中で有利に使用され得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、非イオン性またはポリマーであってもよく、それらは、乳化剤、湿潤剤または懸濁化剤としてまたは他の目的のために使用され得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどの、硫酸アルキルの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどの、アルキルアリールスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなどの、アルキルフェノール／アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどの、アルコール／アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石鹼；ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートなどの、アルキルナフタレンスルホネートの塩；ナトリウムジ(2-エチルヘキシル)スルホスクシネットなどの、スルホコハク酸塩のジアルキルエステル；オレイン酸ソルビトールなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第4級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなどの、脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびにモノ-およびジ-アルキルリン酸エステルの塩；ならびにさらに例えばMcCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981) に記載されて

10

20

30

40

50

いるさらなる物質が挙げられる。

【0167】

殺有害生物製剤に使用され得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整剤、懸濁化剤、染料、酸化防止剤、発泡剤、光吸収剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤またはpH調整物質および緩衝液、腐食防止剤、香料、湿潤剤、吸収向上剤、微量栄養素、可塑剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤、ならびに液体および固体肥料が挙げられる。

【0168】

本発明に係る組成物は、植物もしくは動物由来の油、鉛油、このような油のアルキルエステルまたはこのような油と油誘導体との混合物を含む添加剤を含み得る。本発明に係る組成物中の油添加剤の量は、一般に、施用される混合物を基準にして、0.01~10%である。例えば、油添加剤は、スプレー混合物が調製された後、所望の濃度でスプレータンクに加えられ得る。好ましい油添加剤は、鉛油または植物由来の油、例えばナタネ油、オリーブ油もしくはヒマワリ油、乳化植物油、植物由来の油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体、または魚油もしくは牛脂などの動物由来の油を含む。好ましい油添加剤は、C<sub>8</sub>~C<sub>22</sub>脂肪酸のアルキルエステル、特に、C<sub>12</sub>~C<sub>18</sub>脂肪酸のメチル誘導体、例えばラウリン酸、パルミチン酸およびオレイン酸のメチルエステル（それぞれ、ラウリン酸メチル、パルミチン酸メチルおよびオレイン酸メチル）を含む。多くの油誘導体が、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10<sup>th</sup> Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

【0169】

本発明の組成物は、一般に、0.1~99重量%、特に、0.1~95重量%の、本発明の化合物および1~99.9重量%の製剤化補助剤（これは、好ましくは、0~25重量%の表面活性物質を含む）を含む。市販の製品は、好ましくは、濃縮物として製剤化され得るが、最終使用者は、通常、希釈製剤を用いるであろう。

【0170】

施用量は、広い範囲内で変化し、土壤の性質、施用方法、作物植物、防除される有害生物、そのときの気候条件、ならびに施用方法、施用の時期および標的作物に左右される他の要因に応じて決まる。一般的な指針として、化合物は、1~20001/h a、特に、10~10001/h aの割合で施用され得る。

【0171】

好ましい製剤は、以下の組成を有し得る（重量%）。

【0172】

乳剤：

活性成分：1~95%、好ましくは60~90%

表面活性剤：1~30%、好ましくは5~20%

液体担体：1~80%、好ましくは1~35%

【0173】

ダスト剤：

活性成分：0.1~10%、好ましくは0.1~5%

固体担体：99.9~90%、好ましくは99.9~99%

【0174】

懸濁濃縮物：

活性成分：5~75%、好ましくは10~50%

水：94~24%、好ましくは88~30%

表面活性剤：1~40%、好ましくは2~30%

【0175】

水和剤：

活性成分：0.5~90%、好ましくは1~80%

10

20

30

40

50

表面活性剤：0.5～20%、好ましくは1～15%

固体担体：5～95%、好ましくは15～90%

**【0176】**

粒剤：

活性成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体担体：99.5～70%、好ましくは97～85%

**【0177】**

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

**【0178】**

【表6】

水和剤	a)	b)	c)
活性成分	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	-
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	-	5 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	-	6 %	10 %
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7～8 モルのエチレンオキシド)	-	2 %	-
高度に分散したケイ酸	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	-

10

20

**【0179】**

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎され、これにより、水和剤が得られ、これは、水で希釈されて、所望の濃度の懸濁液が得られる。

**【0180】**

【表7】

乾燥種子処理用の粉剤	a)	b)	c)
活性成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高度に分散したケイ酸	5 %	5 %	-
カオリン	65 %	40 %	-
タルカム	-		20

30

**【0181】**

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎され、種子処理に直接使用され得る粉剤が得られる。

**【0182】**

【表 8】

乳剤濃縮物	
活性成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4 ～5モルのエチレンオキシド)	3 %
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	3 %
ヒマシ油ポリグリコールエーテル(35モルのエチレンオ キシド)	4 %
シクロヘキサン	30 %
キシレン混合物	50 %

10

【0183】

植物保護に使用され得る、任意の所要の希釈率の乳剤が、水による希釈によって、この濃縮物から得られる。

【0184】

【表 9】

ダスト剤	a)	b)	c)
活性成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	-	-
カオリン	-	94 %	-
無機充填剤	-	-	96%

20

【0185】

即時使用可能なダスト剤が、担体と組み合わせて混合し、混合物を好適なミルにおいて粉碎することによって得られる。このような粉末は、種子の乾式粉衣 (dry dressing) にも使用され得る。

【0186】

【表 10】

30

押出粒剤	
活性成分	15 %
リグノスルホン酸ナトリウム	2 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
カオリン	82 %

【0187】

この組合せは、補助剤と混合され、粉碎され、混合物は、水で濡らされる。混合物は、押し出され、次に、空気流中で乾燥される。

40

【0188】

【表 11】

被覆粒剤	
活性成分	8 %
ポリエチレングリコール(分子量200)	3 %
カオリン	89 %

【0189】

この微粉化された組合せは、ミキサー中で、ポリエチレングリコールで濡らされたカオ

50

リンに均一に適用される。このように、ほこりのない被覆された粒剤が得られる。

【0190】

【表12】

<u>懸濁濃縮物</u>	
活性成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15モルのエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	1 %
水	32 %

10

【0191】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物ならびに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけまたは浸漬によって、微生物による寄生から保護され得る。

【0192】

【表13】

<u>種子処理用のフロアブル剤</u>	
活性成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマープタノールPO/EO	2 %
10~20モルのEOを含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中20%の溶液の形態)	0.5 %
モノアゾー顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

20

30

【0193】

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物ならびに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけまたは浸漬によって、微生物による寄生から保護され得る。

【0194】

持続放出性カプセル懸濁剤

28部のこの組合せを、2部の芳香族溶媒および7部のトルエンジイソシアネートノボリメチレン-ポリフェニルイソシアネート-混合物(8:1)と混合する。この混合物を、所望の粒度が得られるまで、1.2部のポリビニルアルコールと、0.05部の消泡剤と、5.1.6部の水との混合物中で乳化する。この乳剤に、5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を加える。混合物を、重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁剤を、0.25部の増粘剤および3部の分散剤を加えることによって安定化させる。カプセル懸濁剤製剤は、28%の活性成分を含有する。カプセルの中間直径は8~15μmである。得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に施用する。

【0195】

製剤のタイプとしては、乳剤濃縮物(EC)、懸濁濃縮物(SC)、サスペンション

40

50

ン( S E )、カプセル懸濁剤( C S )、水和性粒剤( W G )、乳化性粒剤( E G )、油中水乳剤( E O )、水中油乳剤( E W )、マイクロエマルション( M E )、油性分散液( O D )、油混和性フロアブル剤( O F )、油混和性液体( O L )、可溶性濃縮物( S L )微量散布用懸濁剤( u l t r a - l o w v o l u m e s u s p e n s i o n )( S U )、微量散布用液剤( u l t r a - l o w v o l u m e l i q u i d )( U L )、工業用濃縮物( t e c h n i c a l c o n c e n t r a t e )( T K )、分散性濃縮物( D C )、水和剤( W P )、可溶性粒剤( S G )または農学的に許容できる補助剤と組み合わされた任意の技術的に実現可能な製剤が挙げられる。

#### 【実施例】

##### 【0196】

###### 調製実施例：

「M p」は、融点( )を意味する。遊離基は、メチル基を表す。<sup>1</sup>H NMR測定を、Brucker 400 MHzまたは300 MHz分光計で記録し、化学シフトを、TMS標準に関して ppmで示す。示されるように、スペクトルを重水素化溶媒中で測定する。

##### 【0197】

###### L CMS方法：

###### 方法A ( HPLC精製)：

カラム：Gemini-NX C18 (75×30 mm - 5 mm、110 Å)

移動相：A(水)-B(アセトニトリル)

流量：50 ml / 分。

##### 【0198】

###### 【表14】

勾配:	時間(分)	A(%)	B(%)
0		60	40
0.1		60	40
6		40	60
7.9		40	60
8		0	100
8.9		0	100
9		60	40
10		60	40

##### 【0199】

###### 分析条件：

###### 方法B - 標準：( SQD-ZDQ-ZCQ )

エレクトロスプレー源(極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30~60 V、抽出装置：2.00 V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0 L / 時、脱溶媒和ガス流：650 L / 時、質量範囲：100~900 Da)を備えた Waters 製の質量分析計(SQD、SQDI I または ZQ シングル四重極質量分析計)およびWaters 製の Acuity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置で、スペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 mm、30×2.1 mm、温度：60、DAD 波長範囲(nm)：210~500、溶媒勾配：A = 水 + 5% の MeOH + 0.05% の HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05% の HCOOH、勾配：1.2 分間で 10~100% の B；流量(m l / 分) 0.85。

##### 【0200】

###### 方法C - 標準長さ：( SQD-ZDQ-ZCQ )

10

20

30

40

50

エレクトロスプレー源（極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出装置：2.00 V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0 L / 時、脱溶媒和ガス流：650 L / 時、質量範囲：100～900 Da）を備えたWaters製の質量分析計（SQD、SQDI IまたはZQシングル四重極質量分析計）およびWaters製のAcuity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置で、スペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 mm、30 × 2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶媒勾配：A = 水 + 5 % の MeOH + 0.05 % の HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05 % の HCOOH、勾配：2.7分間で 10～100 % の B；流量（ml / 分）0.85。  
10

## 【0201】

方法D - 無極性（unpolar）：（SQD-ZDQ-ZCQ）

エレクトロスプレー源（極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出装置：2.00 V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0 L / 時、脱溶媒和ガス流：650 L / 時、質量範囲：100～900 Da）を備えたWaters製の質量分析計（SQD、SQDI IまたはZQシングル四重極質量分析計）およびWaters製のAcuity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置で、スペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8 mm、30 × 2.1 mm、温度：60、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶媒勾配：A = 水 + 5 % の MeOH + 0.05 % の HCOOH、B = アセトニトリル + 0.05 % の HCOOH、勾配：1.2分間で 40～100 % の B；流量（ml / 分）0.85。  
20

## 【0202】

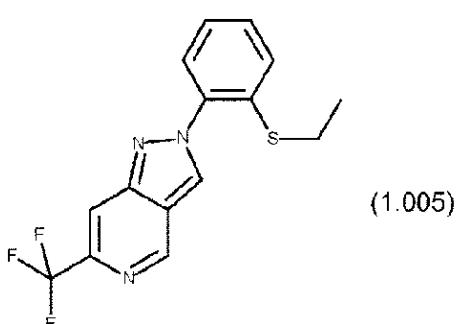
方法E - GCMS方法：標準CI/EI

GCMSを、Thermo、MS：DSQおよびGCで行った：Zebtron phenomenex製のカラムを備えたTRACE GC ULTRA：Phase ZB-5ms 15 m、直徑：0.25 mm、0.25 μm、H<sub>2</sub>流量 1.7 ml / 分、注入器温度（temp injector）：250、検出器温度（temp detector）：220、方法：70 で開始、320 まで 25 / 分、320 で 2 分間保持、合計時間 12 分間。CI試薬ガス：メタン、流量 1 ml / 分。  
30

## 【0203】

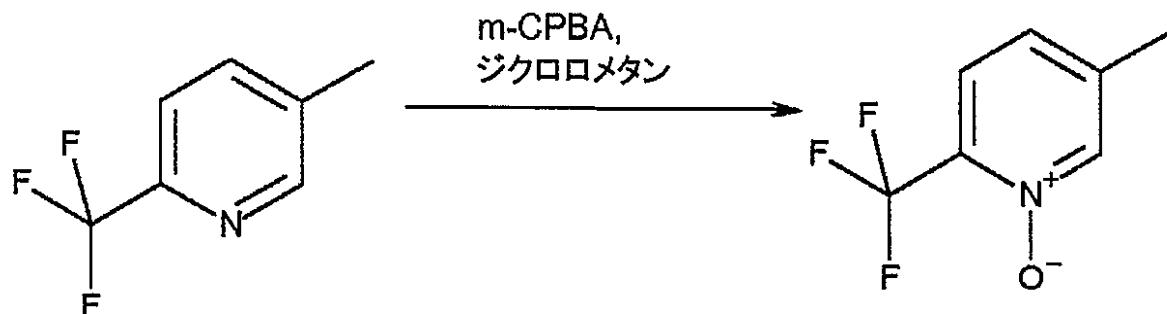
実施例P1：2-(2-エチルスルファニルフェニル)-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-c]ピリジン（化合物1.005）

## 【化15】



工程A：5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ピリジン1-オキシド

## 【化16】



10

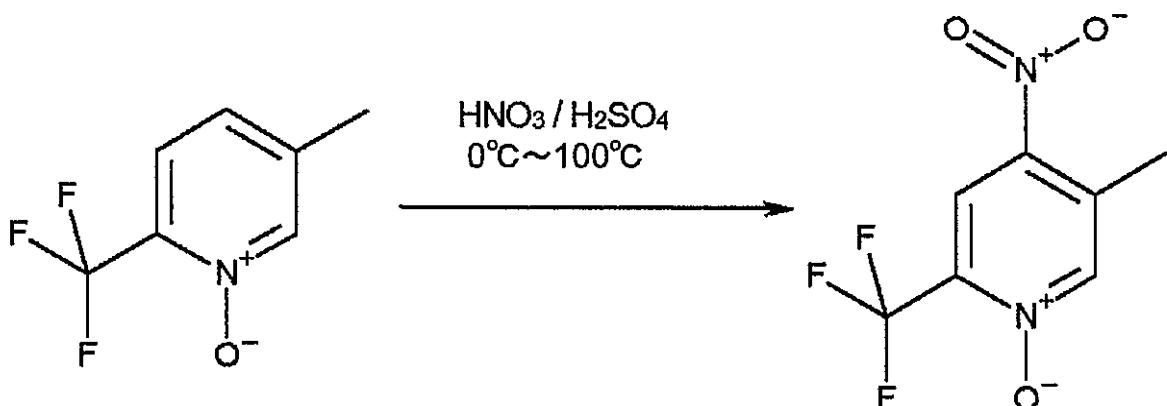
5 - メチル - 2 - トリフルオロメチル - ピリジン（市販されている、0 . 1 6 4 g）を、ジクロロメタン（5 mL）に溶解させた。メタ - クロロペルオキシ安息香酸（*m* - CPBA、0 . 4 8 6 g）を加え、混合物を、周囲温度（室温）で48時間攪拌した。溶媒を減圧下で除去し、粗生成物を、クロマトグラフィー（溶媒：イソヘキサン / ジエチルエーテル7 / 3からジエチルエーテル）によって精製したところ、表題化合物（120 mg）が白色の固体として得られた。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : (ppm) 8 . 1 7 (s, 1 H)、7 . 5 7 (d, 1 H)、7 . 1 6 (d, 1 H)、2 . 3 8 (s, 3 H) ppm.

## 【0204】

20

工程B：5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン1 - オキシド

## 【化17】



30

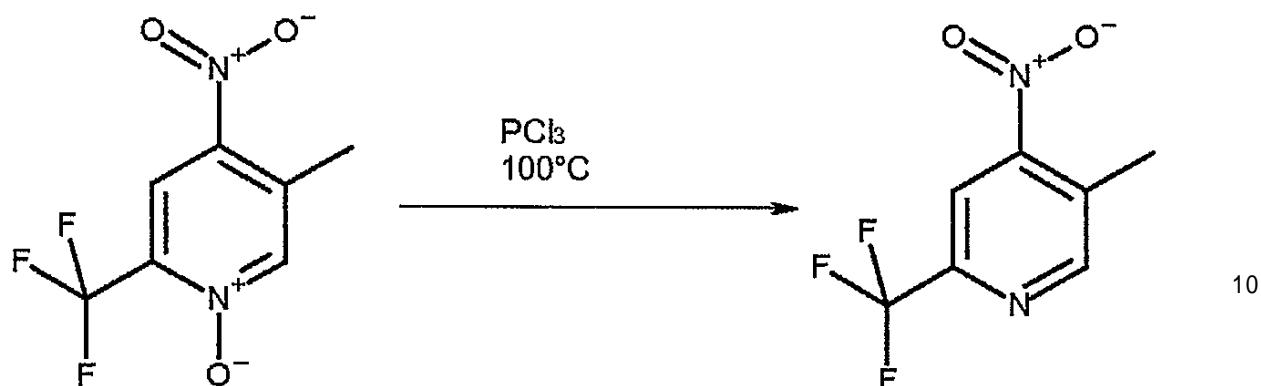
硫酸H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>（3 mL）中の5 - メチル - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン1 - オキシド（工程A、0 . 7 8 7 g）の溶液を、0 で硝酸HNO<sub>3</sub>（4 mL）および硫酸（2 mL）の溶液で処理した。反応物を100 で2時間攪拌した。次に、反応混合物を氷でクエンチし、水酸化ナトリウムNaOH水溶液（4 . 0 M）の添加によって、pHを7に調整した。得られた溶液をジクロロメタンで3回抽出した。組み合わされた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、濃縮した。混合物を、ヘキサンおよびジエチルエーテルで溶離しながらフラッシュクロマトグラフィーによって精製したところ、5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン1 - オキシド（0 . 4 5 g）が得られた。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : (ppm) 8 . 4 2 (s, 1 H)、8 . 2 2 (s, 1 H)、2 . 6 8 (s, 3 H) ppm.

40

## 【0205】

工程C：5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - (トリフルオロメチル)ピリジン

## 【化18】

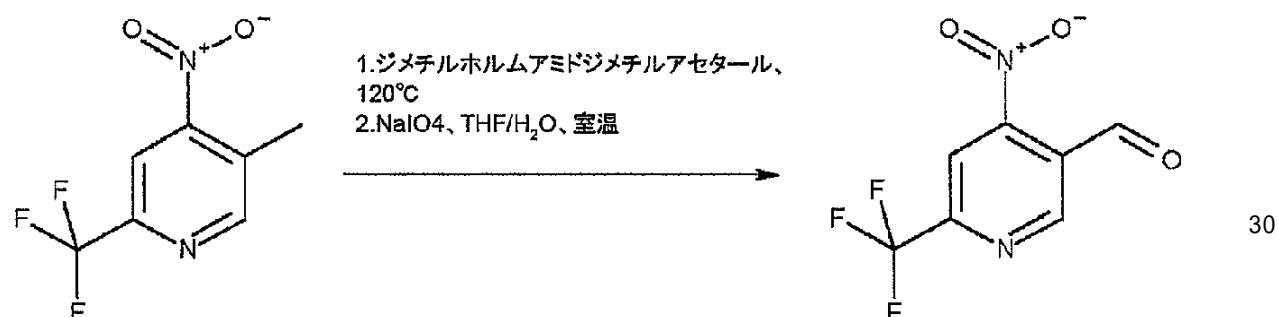


5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - (トリフルオロメチル) ピリジン 1 - オキシド (工程 B、0 . 475 g ) を、三塩化リン (1 . 13 g ) で処理した。混合物を 100 で 20 分間加熱した。残渣を、クロマトグラフィー (イソヘキサン / ジエチルエーテル 7 / 3 ) によって精製したところ、5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - (トリフルオロメチル) ピリジン (0 . 38 g ) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : (ppm) 8 . 85 (s, 1H)、8 . 16 (s, 1H)、2 . 70 (s, 3H) ppm.

## 【0206】

工程 D : 4 - ニトロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - カルバルデヒド

## 【化19】

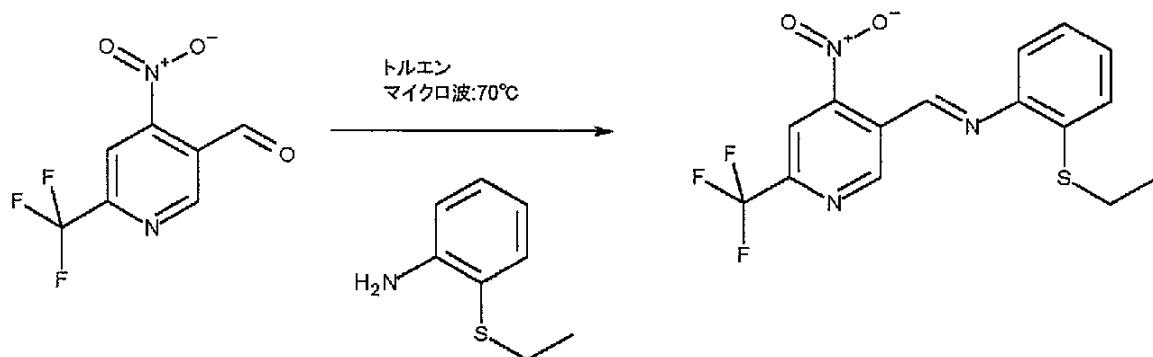


ジメチルホルムアミド (2 ml) 中の、5 - メチル - 4 - ニトロ - 2 - (トリフルオロメチル) ピリジン (工程 C、0 . 399 g ) と、N , N - デジメチル - ホルムアミドジメチルアセタール (0 . 361 g ) との混合物を、120 で 2 時間攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させ、残渣を、テトラヒドロフラン (THF) および水 (25 ml : 25 ml) に溶解されたメタ過ヨウ素酸ナトリウム NaIO<sub>4</sub> (1 . 192 g ) の混合物に注いだ。混合物を 16 時間攪拌した。反応混合物をろ過し、水層を酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を濃縮した。混合物を、フラッシュクロマトグラフィー (ヘキサンおよびジエチルエーテル) によって精製したところ、4 - ニトロ - 6 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 3 - カルバルデヒド (0 . 405 g ) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : (ppm) 10 . 56 (s, 1H)、9 . 32 (s, 1H)、8 . 32 (s, 1H) .

## 【0207】

工程 E : N - (2 - エチルスルファニルフェニル) - 1 - [4 - ニトロ - 6 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] メタンイミン

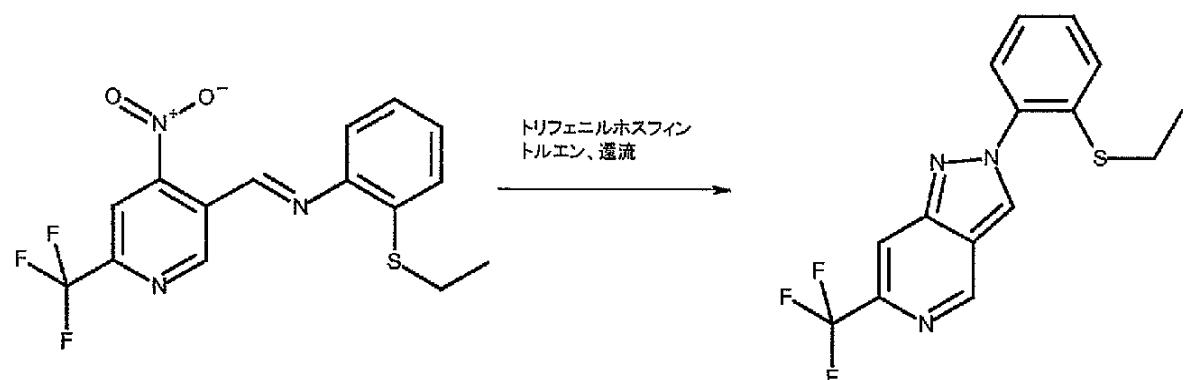
## 【化 2 0】



トルエン中の、4 - ニトロ - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリジン - 3 - カルバルデヒド ( 工程 D 、 0 . 22 g ) と、 2 - ( エチルチオ ) アニリン ( 市販されている、 0 . 142 g ) との混合物を、 40 分間にわたってマイクロ波下で、 70 °C で攪拌した。反応混合物を、フラッショクロマトグラフィー ( イソヘキサンおよびジエチルエーテル ) によって精製したところ、 N - ( 2 - エチルスルファニルフェニル ) - 1 - [ 4 - ニトロ - 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] メタンイミン ( 0 . 319 g ) が得られた。<sup>1</sup>H NMR ( 300 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) : ( ppm ) 9 . 82 ( s , 1 H ) 、 8 . 97 ( s , 1 H ) 、 8 . 25 ( s , 1 H ) 、 7 . 23 ( m , 3 H ) 、 7 . 11 ( m , 1 H ) 、 2 . 99 ( q , 2 H ) 、 1 . 39 ( t , 3 H ) ppm .

【0208】  
工程 F : 2 - ( 2 - エチルスルファニルフェニル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン ( 化合物 1 . 005 )

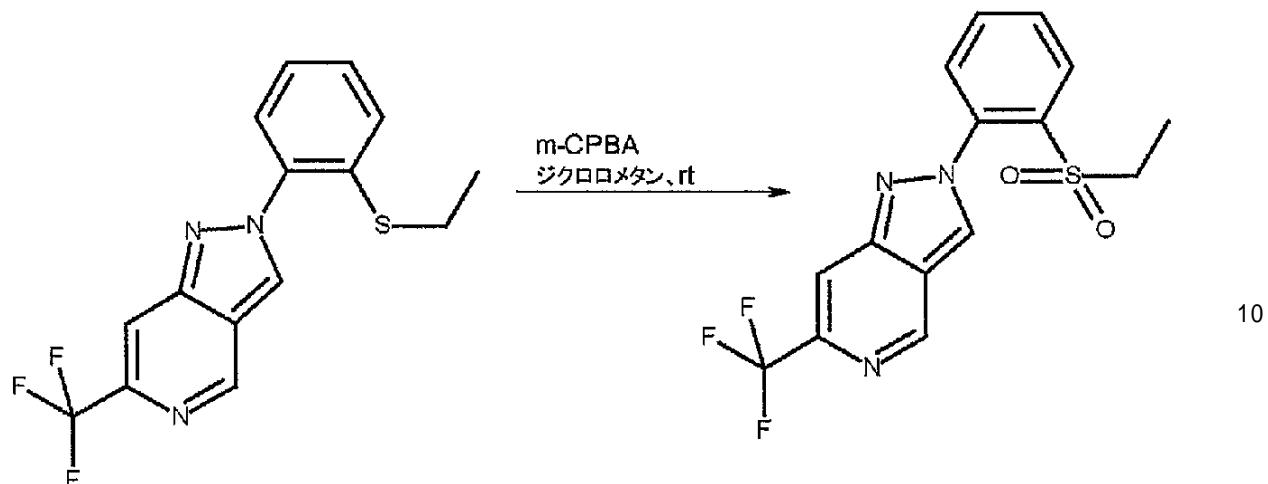
## 【化 2 1】



トルエン ( 10 mL ) 中の、 N - ( 2 - エチルスルファニルフェニル ) - 1 - [ 4 - ニトロ - 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジル ] メタンイミン ( 工程 E 、 0 . 19 g ) と、 トリフェニルホスフィン ( 0 . 54 g ) との混合物を、 30 分間にわたって還流状態で攪拌した。溶媒を減圧下で蒸発させ、残渣を、フラッショクロマトグラフィー ( イソヘキサンおよびジエチルエーテル ) によって精製したところ、 2 - ( 2 - エチルスルファニルフェニル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン ( 表題化合物 1 . 005 、 0 . 165 g ) が得られた。<sup>1</sup>H NMR ( 300 MHz, CDCl<sub>3</sub> ) : ( ppm ) 9 . 36 ( s , 1 H ) 、 8 . 56 ( s , 1 H ) 、 8 . 10 ( s , 1 H ) 、 7 . 54 ( m , 3 H ) 、 7 . 40 ( m , 1 H ) 、 2 . 82 ( q , 2 H ) 、 1 . 21 ( t , 3 H ) ppm .

【0209】  
実施例 P 2 : 2 - ( 2 - エチルスルホニルフェニル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン ( 化合物 1 . 006 )

## 【化22】

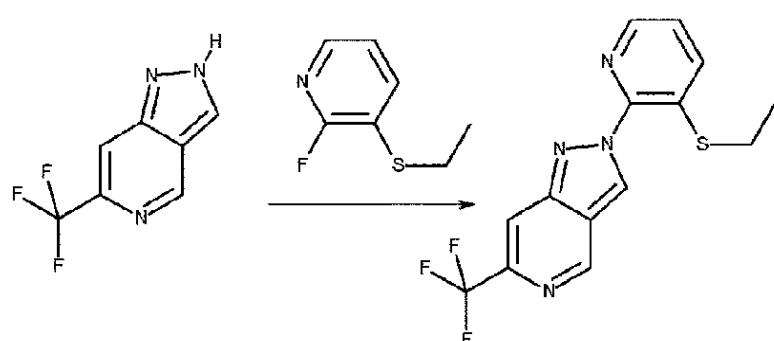


ジクロロメタン（5 mL）中の2 - (2 - エチルスルファニルフェニル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (0 . 085 g) の溶液に、メタ - クロロペルオキシ安息香酸m - C P B A (0 . 107 g) を加えた。得られた黄色の溶液を室温で一晩攪拌した。反応を停止させ、溶媒を蒸発させた。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー (ジエチルエーテル) によって精製したところ、2 - (2 - エチルスルホニルフェニル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (表題化合物 1 . 006、0 . 076 g) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz、CDCl<sub>3</sub>) : 9 . 38 (s, 1 H)、8 . 61 (s, 1 H)、8 . 26 (d, 1 H)、8 . 04 (s, 1 H)、7 . 85 (m, 2 H)、7 . 59 (d, 1 H)、3 . 23 (q, 2 H)、1 . 24 (t, 3 H) ppm.

## 【0210】

実施例P3：2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (b1) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (化合物 1 . 007)

## 【化23】



ジメチルホルムアミド (5 mL) 中の6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (0 . 5 g) および3 - エチルスルファニル - 2 - フルオロ - ピリジン (0 . 4 g、欧洲特許第341011号明細書に記載されるように調製される) の溶液に、二リチウム炭酸 (di lithium carbonic acid) (0 . 2 g、3 mmol) を加えた。得られた溶液を100 °C で一晩攪拌した。水の添加によって反応を停止させ、水層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって精製したところ、2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (化合物 1 . 007、0 . 053 g) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz、CDCl<sub>3</sub>) : 9 . 37 (d, 1 H)、8 . 98 (d, 1 H)、8 . 37 (dd, 1 H)、8 . 14 (s, 1 H) ppm.

10

20

30

40

50

)、7.86 (dd, 1H)、7.43 (dd, 1H)、2.96 (q, 2H)、1.32 (t, 3H) ppm. 反応の主要生成物は、位置異性体 (isomer of position) である。

#### 【0211】

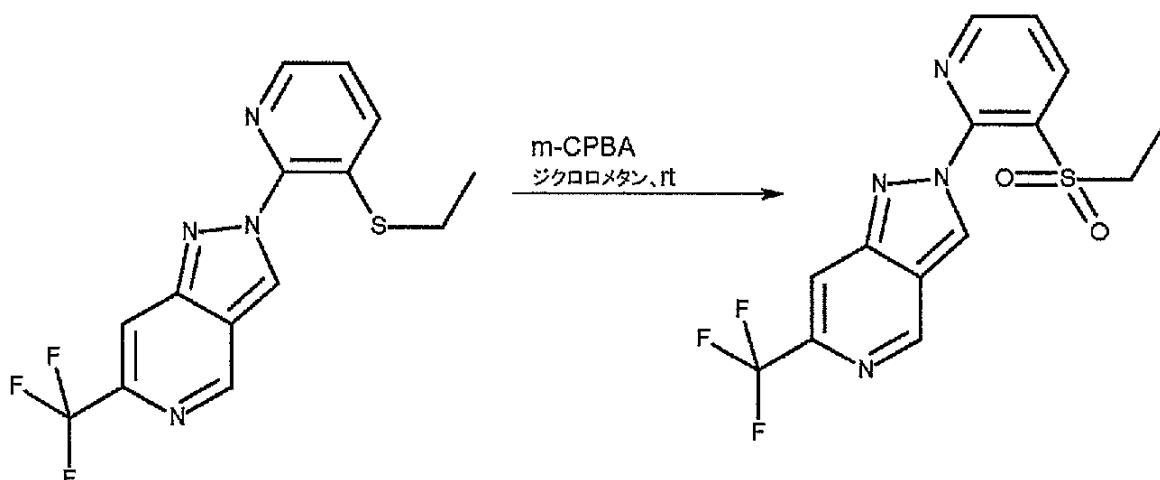
化合物 P5 (6 - ブロモ - 2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン) を、出発材料として 6 - (ブロモ) - 2H - ピラゾロ [4,3-c] ピリジンを用いて、同じ反応を用いて調製した。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 9.09 (s, 1H)、8.89 (s, 1H)、8.36 (d, 1H)、7.93 (s, 1H)、7.84 (dd, 1H)、7.42 (dd, 1H)、2.94 (q, 2H)、1.34 (t, 3H) ppm.

10

#### 【0212】

実施例 P4 : 2 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン (化合物 1.008)

#### 【化24】



20

ジクロロメタン (2.7 mL) 中の 2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン (化合物 1.007) (0.044 g) の溶液に、メタ - クロロペルオキシ安息香酸 (m - C P B A) (0.080 g) を加えた。得られた黄色の溶液を周囲温度で 2 時間攪拌した。水の添加によって反応を停止させ、水層をジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を、NaOH

30

1 M の溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、フランクシクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって精製したところ、2 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン (化合物 1.008、0.048 g) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 9.39 (s, 1H)、8.92 (s, 1H)、8.84 (d, 1H)、8.65 (dd, 1H)、8.04 (s, 1H)、7.76 (dd, 1H)、3.94 (q, 2H)、1.44 (t, 3H) ppm.

40

#### 【0213】

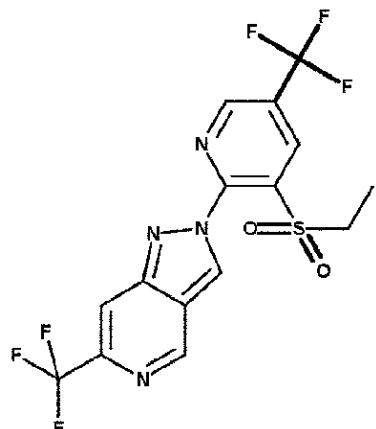
化合物 P6 (6 - ブロモ - 2 - (3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン) を、出発材料として 6 - ブロモ - 2 - (3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジンを用いて、同じ反応を用いて調製した。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 9.10 (s, 1H)、8.82 (m, 2H)、8.64 (dd, 1H)、7.83 (s, 1H)、7.72 (dd, 1H)、3.91 (q, 2H)、1.41 (t, 3H) ppm.

#### 【0214】

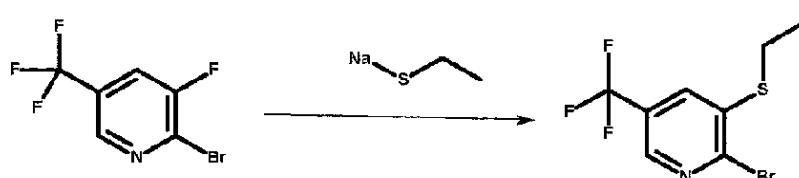
実施例 P7 : 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン

50

## 【化25】



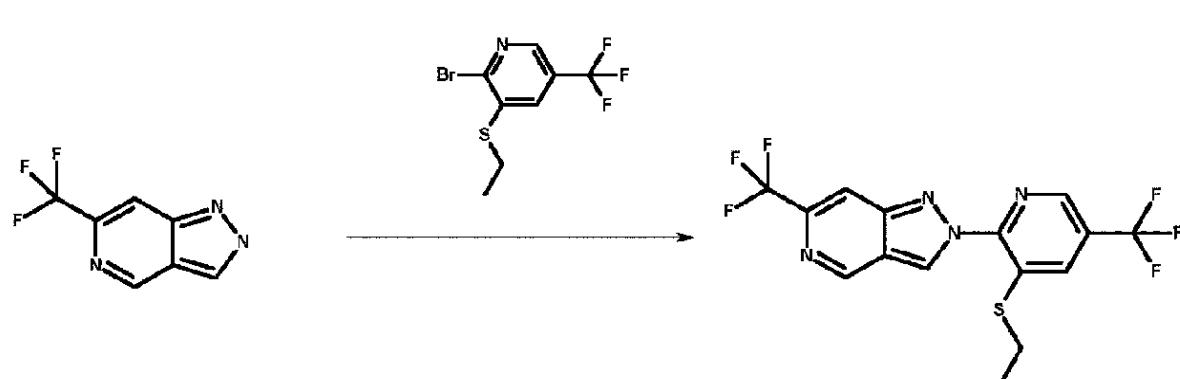
工程A：2 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン  
【化26】



30 ml の THF 中のエチルスルファニルナトリウム (2.70 g、1.1当量) の懸濁液に、テトラブチルアンモニウムプロミド (0.35 g、0.05当量) を加えた。20 ml のテトラヒドロフラン中の2 - ブロモ - 3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン (5 g) の溶液を、20分以内に滴下して加えた。温度は、このとき、20から35に上昇している。混合物をセライト上でろ過し、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって2回精製したところ、2 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン (1.5 g) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 8.38 (s, 1 H)、7.52 (s, 1 H)、3.02 (q, 2 H)、1.44 (m, 3 H) ppm.

## 【0215】

工程B：2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4,3-c] ピリジン  
【化27】



トルエン (9.1 mL) 中の、2 - ブロモ - 3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン (0.2 g、0.699 mmol) と、6 - (トリフルオロメチル) - 2H - ピラゾロ [4,3-c] ピリジン (0.399 g、2.13 mmol) と、リ

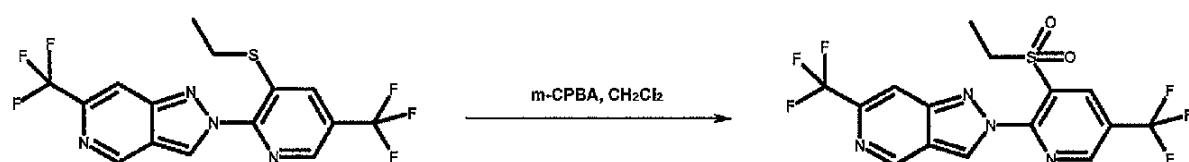
50

ン酸カリウム（0.445 g、2.097 mmol）と、ヨウ化銅（0.033 g、0.175 mmol）と、トランス-*n*,*n'*-ジメチル-1,2-シクロヘキサンジアミン（0.0497 g、0.055 mL、0.35 mmol）との混合物を攪拌し、120で一晩加熱した。冷却した後、150 mg の2-ブロモ-3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)ピリジンおよび同量のCuI、トランス-*n*,*n'*-ジメチル-1,2-シクロヘキサンジアミンおよびリン酸カリウムを混合物に加えた。反応物を120でさらに一晩攪拌した。水および酢酸エチルの溶液の添加によって、反応を停止させた。水層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を、塩水、次に水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー（シクロヘキサン/酢酸エチル）によって精製したところ、2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-*c*]ピリジン（0.091 g）およびその位置異性体が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 9.39 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 3.03 (q, 2H), 1.41 (t, 3H) ppm.

## 【0216】

工程C：2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-*c*]ピリジン

## 【化28】

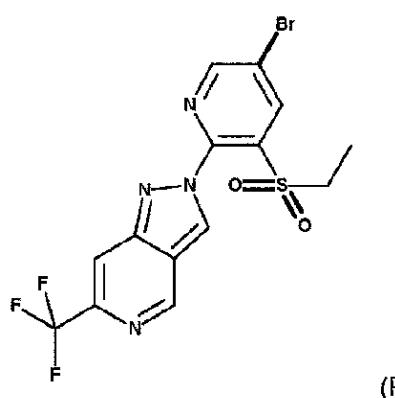


実施例P4に記載されるのと同様の条件を用いて、表題化合物を、2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-*c*]ピリジン（上述されるように調製される）と、ジクロロメタン中のm-CPBAとの反応によって調製した。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 1.51 (t, 3H), 4.10 (q, 2H), 8.05 (s, 1H), 8.89 (d, 1H), 9.04 (d, 1H), 9.09 (s, 1H), 9.42 (s, 1H).

## 【0217】

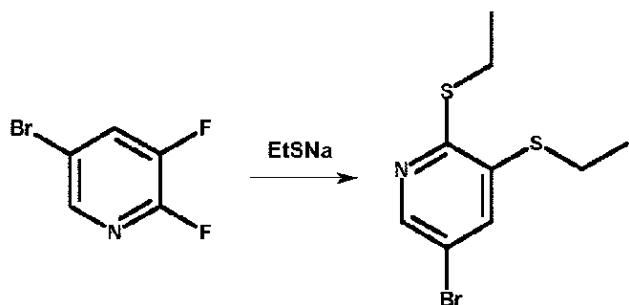
実施例P8：2-(5-ブロモ-3-エチルスルホニル-2-ピリジル)-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-*c*]ピリジン

## 【化29】



工程A：5-ブロモ-2,3-ビス(エチルスルファニル)ピリジン

## 【化30】



10

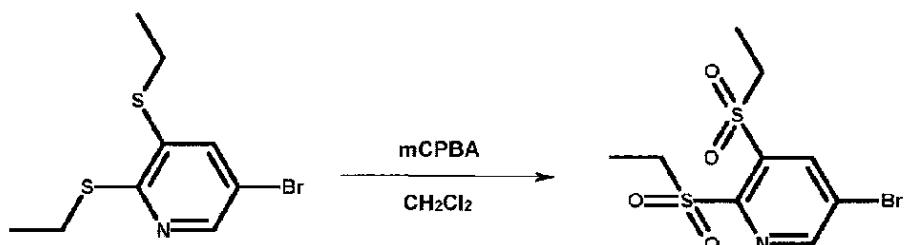
5 - ブロモ - 2 , 3 - ジフルオロ - ピリジン (市販されている、13.61 g、66.65 mmol) およびN , N - ジメチルホルムアミド (94.4 g、100 mL) の溶液に、ナトリウムエタンチオール (18.44 g、173.3 mmol) を3回に分けて加え、反応は発熱性であった。得られた溶液を室温で2時間攪拌した。水および酢酸エチルの溶液の添加によって、反応を停止させた。水層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を、塩水、次に水で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣をさらに精製せずに次の工程に使用した。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 8.32 (s, 1H)、7.56 (s, 1H)、3.18 (q, 2H)、2.95 (q, 2H)、1.40 - 1.32 (m, 6H) ppm.

20

## 【0218】

工程B：5 - ブロモ - 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン

## 【化31】



30

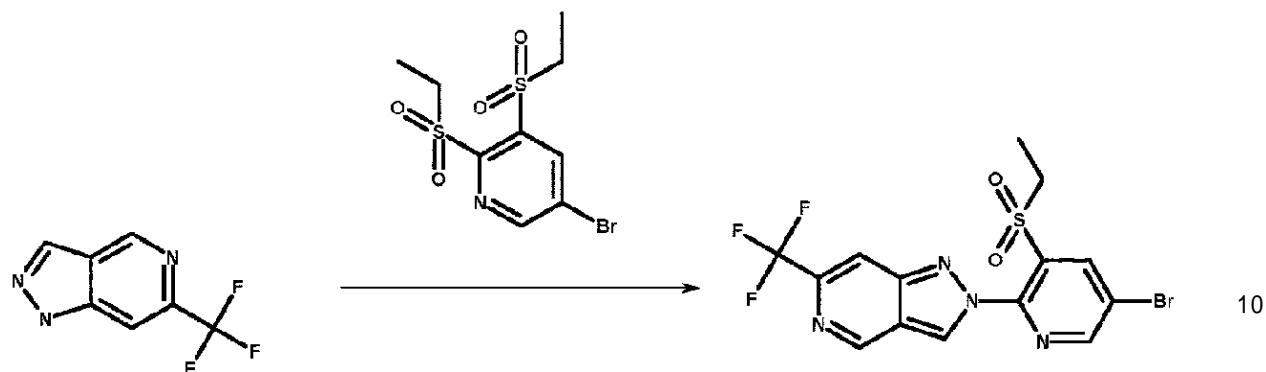
氷浴で冷却されたジクロロメタン (250 mL) 中の5 - ブロモ - 2 , 3 - ビス (エチルスルファニル) ピリジン (13.6 g、48.9 mmol) の溶液に、メタ - クロロペルオキシ安息香酸 (45.6 g、198 mmol) を加えた。得られた溶液を室温で1時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウムの溶液の添加によって、反応を停止させ、水層をジクロロメタンで3回抽出した。組み合わされた有機層を、NaOH 1Mの溶液で洗浄し、硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって精製したところ、5 - ブロモ - 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン (6.54 g) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : 9.00 (s, 1H)、8.76 (s, 1H)、3.78 (q, 2H)、3.64 (q, 2H)、1.44 - 1.34 (m, 6H) ppm.

40

## 【0219】

工程C：2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (P8)

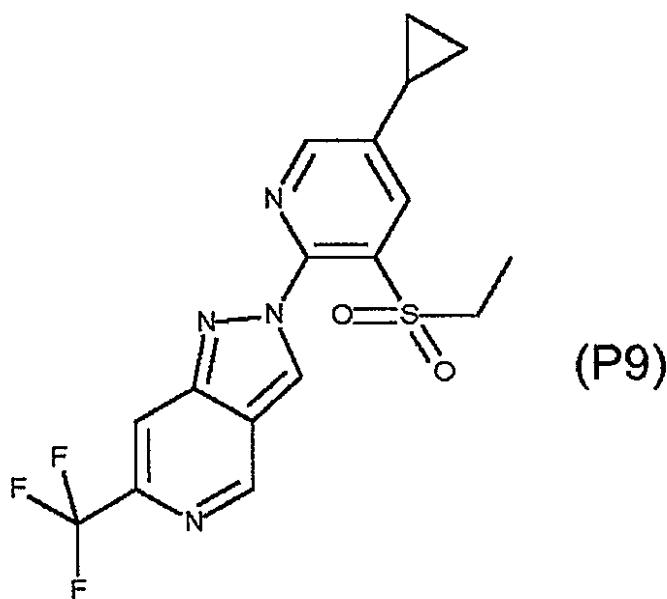
## 【化32】



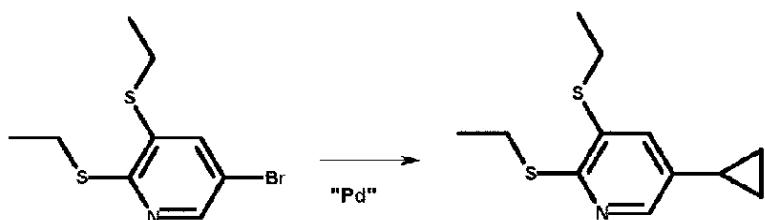
ジメチルホルムアミド (19 mL) 中の 6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (0 . 4679 g、2 . 425 mmol) および 5 - ブロモ - 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン (0 . 83 g、2 . 425 mmol) の溶液に、二リチウム炭酸 (dilithium carbonic acid) (0 . 5523 g、7 . 276 mmol) を加えた。得られた溶液を、130 で 2 時間、次に、110 で一晩搅拌した。水および酢酸エチルの添加によって反応を停止させた。水層を酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、HPLC (方法 A を参照) によって精製したところ、2 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン (化合物 P8、0 . 017 g) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 1 . 47 (t, 3 H)、3 . 99 (q, 2 H) 8 . 03 (s, 1 H) 8 . 76 (d, 1 H) 8 . 88 (d, 1 H) 8 . 91 (d, 1 H) 9 . 40 (s, 1 H)。反応の他の生成物は、位置異性体 (1 - (5 - ブロモ - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン) であり、反応の主要生成物は、臭化物の置換物 (substitution) (1 - [5 , 6 - ビス (エチルスルホニル) - 3 - ピリジル] - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン) である。

【0220】  
実施例 P9 : 2 - (5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c ] ピリジン :

## 【化33】



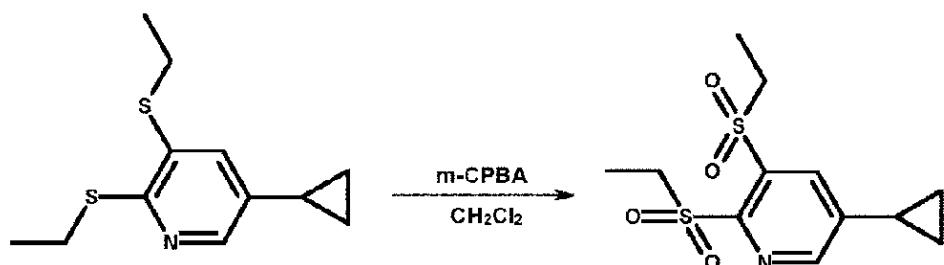
工程 A : 5 - シクロプロピル - 2 , 3 - ビス (エチルスルファニル) ピリジン :  
【化 3 4】



アルゴンでフラッシュした 20 mL の密封されたバイアルに、5 - プロモ - 2 , 3 - ビス (エチルスルファニル) ピリジン (1.00 g、3.59 mmol) 、次に、シクロプロピルボロン酸 (1.16 g、12.9 mmol) 、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (0) (0.416 g、0.359 mmol) 、リン酸三カリウム (4.72 g、1.84 mL、21.6 mmol) 、トルエン (4.33 g、5 mL、46.8 mmol) および水 (5.000 g、5 mL、277.5 mmol) を充填した。次に、混合物を 2 時間にわたって還流させた。水および酢酸エチルの溶液の添加によって、反応を停止させた。水層を酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサン / 酢酸エチル) によって精製したところ、表題化合物 (0.625 mg) が得られた。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ = 8.12 (s, 1H)、7.18 (s, 1H)、3.18 (q, 2H)、2.92 (q, 2H)、1.82 (m, 1H)、1.39 (t, 3H)、1.30 (t, 3H)、0.98 (m, 2H)、0.68 (m, 2H) ppm. 10  
20

【0221】

工程 B : 5 - シクロプロピル - 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン :  
【化 3 5】

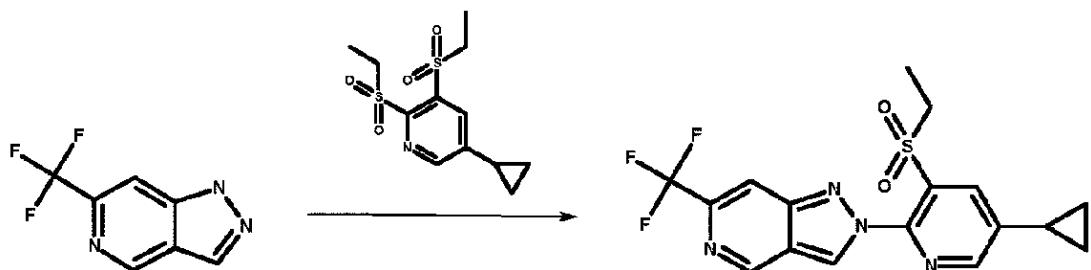


実施例 P 8 (工程 B) に記載されるのと同様の条件を用いて、表題化合物を、5 - シクロプロピル - 2 , 3 - ビス (エチルスルファニル) ピリジン (上述されるように調製される) と、ジクロロメタン中の m - CPBA との反応によって調製した。<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) ppm 0.94 (m, 2H)、1.22 - 1.45 (m, 8H)、2.10 (m, 1H)、3.62 (q, 2H)、3.75 (q, 2H)、8.12 (s, 1H)、8.67 (s, 1H). 30  
40

【0222】

工程 C : 2 - (5 - シクロプロピル - 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル) - 6 - (トリフルオロメチル) ピラゾロ [4 , 3 - c] ピリジン :

## 【化36】

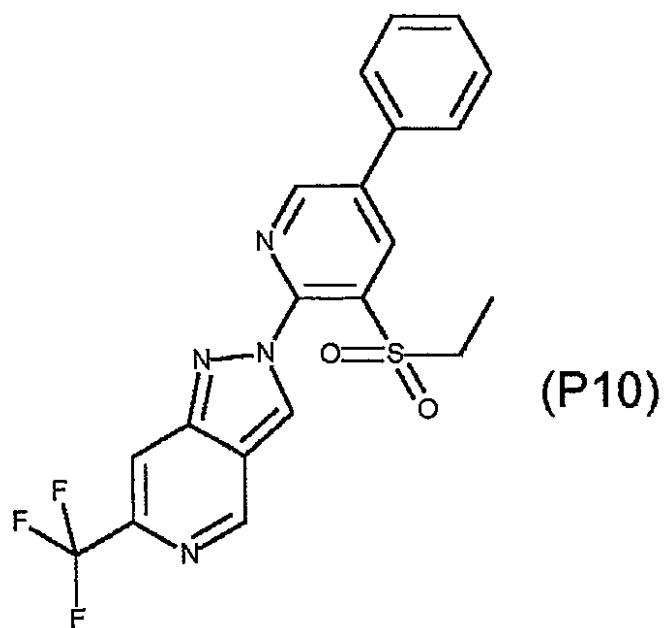


実施例 P 8 (工程 C ) に記載されるのと同様の条件を用いて、化合物 P 9 を、 6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジンと、 5 - シクロプロピルピル - 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン (上述されるように調製される) との反応によって調製した。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , C D C l <sub>3</sub> ) p p m 0 . 9 5 ( m , 2 H ) 、 1 . 2 8 ( m , 2 H ) 、 1 . 4 0 ( t , 3 H ) 、 2 . 1 3 ( m , 1 H ) 、 3 . 8 5 ( q , 2 H ) 、 8 . 0 3 ( s , 1 H ) 、 8 . 1 7 ( d , 1 H ) 、 8 . 5 7 ( d , 1 H ) 、 8 . 8 4 ( d , 1 H ) 、 9 . 3 7 ( s , 1 H ) . 10

## 【0223】

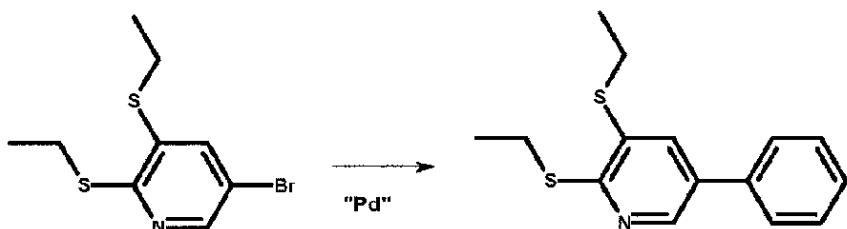
実施例 P 1 0 : 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 5 - フェニル - 2 - ピリジル ) - 6 - ( ト リフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジン :

## 【化37】



工程 A : 2 , 3 - ビス ( エチルスルファニル ) - 5 - フェニル - ピリジン :

## 【化38】



アルゴンでフラッシュした 2 0 m L の密封されたバイアルに、 5 - ブロモ - 2 , 3 - ビス ( エチルスルファニル ) ピリジン ( 1 . 0 0 g 、 3 . 5 9 m m o l ) 、次に、フェニル 50

10

20

30

40

50

ボロン酸（1.63 g、12.9 mmol）、テトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（0）（0.208 g、0.180 mmol）、リン酸三カリウム（4.72 g、1.84 mL、21.6 mmol）、トルエン（4.33 g、5 mL、46.8 mmol）および水（5.000 g、5 mL、277.5 mmol）を充填した。次に、混合物を2時間にわたって還流させた。水および酢酸エチルの溶液の添加によって、反応を停止させた。水層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。残渣を、フラッシュクロマトグラフィー（シクロヘキサン／酢酸エチル）によって精製したところ、表題化合物（0.97 g）が得られた。LC-MS（方法B）RT 1.29 (276, M<sup>+</sup>).

## 【0224】

10

記載されるのと同様の条件を用いて、5-(4-クロロフェニル)-2,3-ビス(エチルスルファニル)ピリジンを調製した。LC-MS（方法B）RT 1.36 (311, M<sup>+</sup>).

## 【0225】

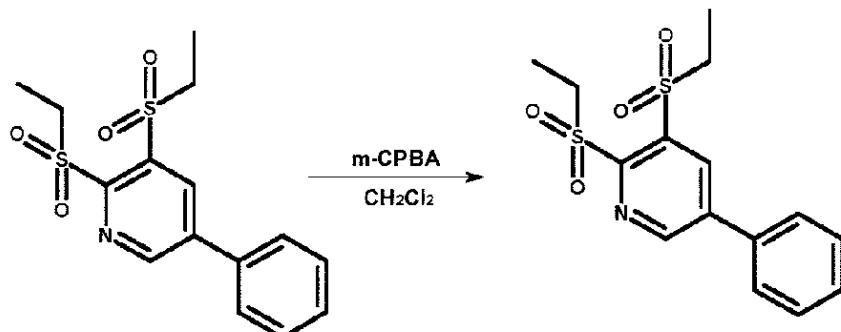
記載されるのと同様の条件を用いて、2,3-ビス(エチルスルファニル)-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリジンを調製した。LC-MS（方法B）RT 1.36 (344, M<sup>+</sup>).

## 【0226】

工程B：2,3-ビス(エチルスルホニル)-5-フェニル-ピリジン：

## 【化39】

20



30

実施例P8（工程B）に記載されるのと同様の条件を用いて、表題化合物（2,3-ビス(エチルスルホニル)-5-フェニル-ピリジン）を、2,3-ビス(エチルスルファニル)-5-フェニル-ピリジン（上述されるように調製される）と、ジクロロメタン中のm-CPBAとの反応によって調製した。LC-MS（方法B）RT 0.92 (340, M<sup>+</sup>).

## 【0227】

実施例P8（工程B）に記載されるのと同様の条件を用いて、5-(4-クロロフェニル)-2,3-ビス(エチルスルホニル)ピリジンを、5-(4-クロロフェニル)-2,3-ビス(エチルスルファニル)ピリジン（上述されるように調製される）と、ジクロロメタン中のm-CPBAとの反応によって調製した。LC-MS（方法B）RT 0.99 (374, M<sup>+</sup>).

40

## 【0228】

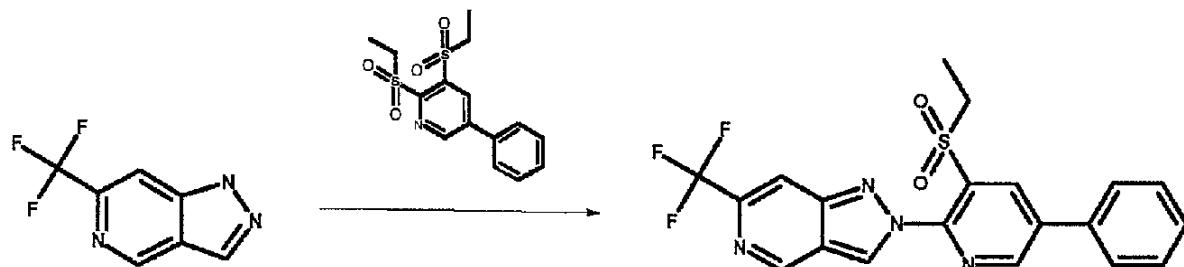
実施例P8（工程B）に記載されるのと同様の条件を用いて、2,3-ビス(エチルスルホニル)-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリジンを、2,3-ビス(エチルスルファニル)-5-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリジン（上述されるように調製される）と、ジクロロメタン中のm-CPBAとの反応によって調製した。LC-MS（方法B）RT 1.02 (408, M<sup>+</sup>).

## 【0229】

工程C：2-(3-エチルスルホニル-5-フェニル-2-ピリジル)-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-c]ピリジン：

50

## 【化40】



実施例 P 8 (工程 C ) に記載されるのと同様の条件を用いて、表題化合物 P 10 を、 6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジンと、 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) - 5 - フェニル - ピリジン (上述されるように調製される)との反応によって調製した。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , C D C l<sub>3</sub> ) p p m 1 . 4 7 ( t , 3 H ) 、 3 . 9 6 ( q , 2 H ) 、 7 . 5 4 - 7 . 6 3 ( m , 3 H ) 、 7 . 6 8 - 7 . 7 6 ( m , 2 H ) 、 8 . 0 6 ( s , 1 H ) 、 8 . 8 0 ( d , 1 H ) 、 8 . 9 5 ( s , 1 H ) 、 9 . 0 2 ( d , 1 H ) 、 9 . 4 1 ( s , 1 H ) .

## 【0230】

実施例 P 8 (工程 C ) に記載されるのと同様の条件を用いて、化合物 P 11 を、 6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジンと、 5 - ( 4 - クロロフェニル) - 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) ピリジン (上述されるように調製される)との反応によって調製した。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , C D C l<sub>3</sub> ) p p m 1 . 4 7 ( t , 3 H ) 、 3 . 9 8 ( q , 2 H ) 、 7 . 5 4 - 7 . 6 0 ( m , 2 H ) 、 7 . 6 2 - 7 . 6 9 ( m , 2 H ) 、 8 . 0 6 ( s , 1 H ) 、 8 . 7 7 ( d , 1 H ) 、 8 . 9 6 ( s , 1 H ) 、 8 . 9 9 ( d , 1 H ) 、 9 . 4 1 ( s , 1 H ) .

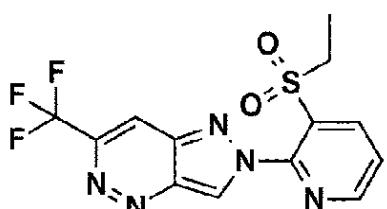
## 【0231】

実施例 P 8 (工程 C ) に記載されるのと同様の条件を用いて、化合物 P 12 を、 6 - (トリフルオロメチル) - 2 H - ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリジンと、 2 , 3 - ビス (エチルスルホニル) - 5 - [ 3 - (トリフルオロメチル) フェニル ] ピリジン (上述されるように調製される)との反応によって調製した。<sup>1</sup>H NMR ( 4 0 0 M H z , C D C l<sub>3</sub> ) p p m 1 . 4 9 ( t , 3 H ) 、 4 . 0 2 ( q , 2 H ) 、 7 . 6 9 - 7 . 7 8 ( m , 1 H ) 、 7 . 7 9 - 7 . 8 6 ( m , 1 H ) 、 7 . 9 1 ( d , 1 H ) 、 7 . 9 4 ( s , 1 H ) 、 8 . 0 6 ( s , 1 H ) 、 8 . 8 1 ( d , 1 H ) 、 8 . 9 8 ( d , 1 H ) 、 9 . 0 4 ( d , 1 H ) 、 9 . 4 1 ( s , 1 H ) .

## 【0232】

実施例 P 11 : 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリダジン P P 1 :

## 【化41】



実施例PP1

工程 A : エチル - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリダジン - 3 - カルボキシレート :

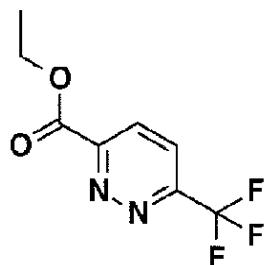
10

20

30

40

【化 4 2】



エタノール(100mL)中の3-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン(4.5g、22mmol、Tetrahedron, 65(21), 4212-4219, 2009に記載されるように調製される)、1,1'-フェロセンジイル-ビス(ジフェニルホスフィン)(0.74g、1.3mmol)、酢酸パラジウム(II)(0.10g、0.44mmol)、N,N-ジエチルエタンアミン(2.7g、3.7mL、27mmol)の溶液を、水素化容器中で、CO(25バール)で加圧し、CO(25バール)で加圧し、120℃で5時間攪拌した。LCMS分析により、この後、反応の完了が示された。次に、反応混合物を冷却し、ろ過し、ろ液を減圧下で濃縮した。粗生成物を、120gのカラムおよびシクロヘキサン+0~70%の酢酸エチルの勾配を用いたCombflashクロマトグラフィーによって精製したところ、表題化合物がベージュ色の固体として得られた。

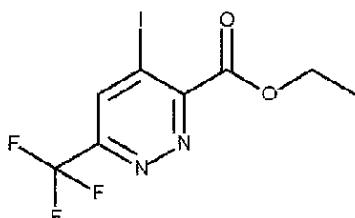
L C M S ( 標準的方法 A ) ; 保持時間 0 . 73 分間、 221 ( MH+ ) 。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) ppm: 1.51 (t, J = 7.15 Hz, 3H); 4.60 (q, J = 6.97 Hz, 2H); 8.00 (d, J = 8.80 Hz, 1H); 8.39 (d, J = 8.80 Hz, 1H).

【 0 2 3 3 】

工程 B : エチル - 4 - ヨード - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリダジン - 3 - カルボキシレート :

【化 4 3】



(2,2,6,6-テトラメチル-1-ピペリジル)リチウム(TMPLi)溶液(THF中0.63M)を、-40で30分間攪拌しながら、-40でTHF(5mL)中の(2,2,6,6-テトラメチル-1-ピペリジル)の溶液へのnBuLi(2.17mL、5.00mmol、ヘキサン中2.3M)のゆっくりとした添加によって調製した。塩化リチウム溶液(THF中0.7M)を、5時間にわたって140で、減圧下で、セプタムを備えたフラスコ中で塩化リチウム(1.2g)を乾燥させることによって調製した。冷却した後、乾燥THF(40mL)を加え、全ての塩が溶解するまで攪拌を続けた。アルゴン下で乾燥した二つ口フラスコ(10mL)中で、エチル-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-カルボキシレート(0.150g、0.681mmol)を、テトラヒドロフラン(3mL、0.681mmol)に溶解させ、THF中の塩化リチウム溶液(2mL、1.50mmol、上述されるように調製される)で処理し、塩化亜鉛(II)(1mL、0.749mmol)で処理した。得られた混合物を-78に冷却し、次に、TMPLi(1.6mL、1.02mmol、上述されるように調製される)を、-78で滴下して加えた(10分間)。反応混合物を-78で1時間攪拌し、次に、1mLのTHFに溶解されたヨウ素分子(0.173g、0.681mmol)50

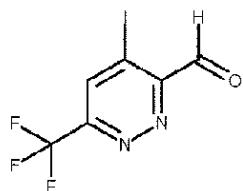
を滴下して加え、得られた混合物を、-78でさらに20分間攪拌した。この後、LC-MSおよびGC-MSにより、所望の生成物のみが示された。反応混合物を室温に温め、飽和塩化アンモニウム水溶液でクエンチし、有機相を、チオ硫酸ナトリウムおよび塩水で連続して洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を、12gのカラムおよびシクロヘキサン+0~40%の酢酸エチルの勾配を用いたCombiflashクロマトグラフィーによって精製したところ、表題化合物が得られた。

GCMS(化学イオン化、方法E)：保持時間、4.60分間、347(MH<sup>+</sup>)

<sup>1</sup>H NMR(400MHz、クロロホルム-d) ppm 1.49(t, J=7.15Hz, 3H) 4.58(q, J=6.97Hz, 2H) 8.40(s, 1H).

【0234】

工程C：4-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-カルバルデヒド：  
【化44】



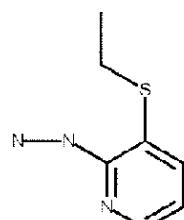
ジクロロメタン(4.5mL)中のエチル4-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-カルボキシレート(0.3g、0.86695mmol)の溶液を、-78で冷却し、-70~-78で滴下して加えられる水素化ジイソブチルアルミニウム(DIBAL、1.7339mL、1.7339mmol)で処理した。反応混合物を-78で1時間攪拌し、次に、室温に温め、一晩攪拌した。次に、反応混合物を0℃に冷却し、飽和NH<sub>4</sub>Clで慎重にクエンチし、次に、10%のHClを用いてpHを酸性にした。混合物をEtOAcで(3回)抽出し、組み合わされた有機層を塩水で洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を、12gのカラムおよびシクロヘキサン+0~60%の酢酸エチルの勾配を用いたCombiflashクロマトグラフィーによって精製したところ、純粋な表題生成物が得られた。

LCMS(標準的方法A)；保持時間0.81分間、303(MH<sup>+</sup>)。

<sup>1</sup>H NMR(400MHz、クロロホルム-d) ppm: 8.52(s, 1H); 10.32(s, 1H).

【0235】

工程D：(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)ヒドラジン：  
【化45】



1,4-ジオキサン(100mL)中の3-エチルスルファニル-2-フルオロ-ピリジン(市販されているか、または国際公開第8910694号パンフレットに記載されるように調製される、9.70g、61.7mmol)の溶液に、ヒドラジン-水和物(12.0g、11.7mL、370mmol)を加えた。得られた溶液を一晩還流させた。水および酢酸エチルの添加によって反応を停止させた。水層を酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸マグネシウム上で乾燥させ、減圧下で濃縮したところ、(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)ヒドラジン(9.23g、88.4%の収率)が純粋化合物として得られた。<sup>1</sup>H NMR(400MHz、CDCl<sub>3</sub>) ppm: 8.12(d, 1H)、7.55(d, 1H)、6.72(s b, 1H)、6.62(m,

10

20

30

40

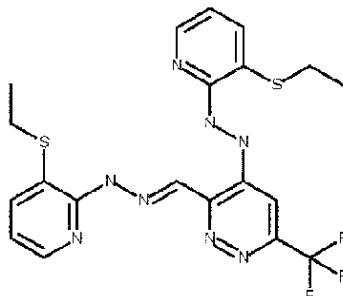
50

1 H)、3.98(s b, 2 H)、2.75(q, 2 H)、1.22(t, 3 H).

【0236】

工程E：3-エチルスルファニル-N-[ (E)-[4-[2-(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)ヒドラジノ]-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-イル]メチレンアミノ]ピリジン-2-アミン：

【化46】



10

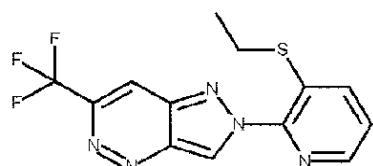
アルゴン下のフラスコ中で、4-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-カルバルデヒド(0.077 g、0.25498 mmol)および(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)ヒドラジン(工程Dにおいて調製される、0.053 g、0.28 mmol)を、室温で48時間にわたってメタノール(3.03 g、3.83 mL、94.3 mmol)中で攪拌した。LCMSおよびTLC分析により、出発材料の消費が完了したのが示された。反応混合物を減圧下で濃縮し、粗生成物を、12 gのカラムおよびシクロヘキサン+0~100%の酢酸エチルの勾配を用いたCombi flashクロマトグラフィーによって精製した。これにより、1:1の比率で表題化合物と、3-エチルスルファニル-N-[ (Z) - [4-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-イル]メチレンアミノ]ピリジン-2-アミンとの混合物が得られた。この混合物をさらに精製せずに次の工程に使用した。

LCMS(標準的方法A)；保持時間1.06分間、494(MH<sup>+</sup>) (表題化合物)。混合物中の第2の化合物は、3-エチルスルファニル-N-[ (Z) - [4-ヨード-6-(トリフルオロメチル)ピリダジン-3-イル]メチレンアミノ]ピリジン-2-アミン：LCMS(標準的方法A)；保持時間0.99分間、454(MH<sup>+</sup>)であった。

【0237】

工程F：2-(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-c]ピリダジン：

【化47】



30

マイクロ波バイアル中で、工程Eにおいて得られた生成物を、DMFに溶解させ、得られた混合物を、マイクロ波条件下で、160℃で10分間攪拌した。DMFを、減圧下で、65℃で蒸発によって除去し、残渣をt-ブチルメチルエーテルおよび水に溶解させ、有機層を分離し、次に、チオ硫酸ナトリウムの飽和水溶液、水および塩水で連続して洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物を、シクロヘキサン+0~50%の酢酸エチルの勾配で4 gのカラムを用いたCombi flashクロマトグラフィーによって精製した。最初に溶出する生成物は、副生成物：1-(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-6-(トリフルオロメチル)ピラゾロ[4,3-c]ピリダジンである。LCMS(標準的方法A)；保持時間0.95分間、326(MH<sup>+</sup>)。2番目に溶出する生成物：2-(3-エチルスルファニル-2-ピリジル)-6-

40

50

- (トリフルオロメチル) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリダジン。

L C M S (標準的方法 A ) ; 保持時間 0 . 9 3 分間、 3 2 6 ( M H + )。

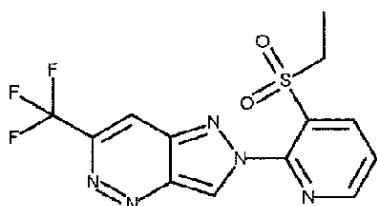
<sup>1</sup>H N M R ( 4 0 0 M H z 、 クロロホルム - d ) p p m : 1 . 3 6 ( t , J = 7 . 3 4 H z 、 3 H ) ; 2 . 9 9 ( q , J = 7 . 4 6 H z 、 2 H ) ; 7 . 5 0 ( d d , J = 8 . 0 7 、 4 . 7 7 H z 、 1 H ) ; 7 . 9 1 ( d d , J = 8 . 0 7 、 1 . 4 7 H z 、 1 H ) ; 8 . 3 2 ( s , 1 H ) ; 8 . 4 3 ( d d , J = 4 . 7 7 、 1 . 4 7 H z 、 1 H ) ; 9 . 6 0 ( d , J = 1 . 1 0 H z 、 1 H ) .

【 0 2 3 8 】

工程 G : 2 - ( 3 - エチルスルホニル - 2 - ピリジル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリダジン ( P P 1 ) :

10

【 化 4 8 】



1 - ( 3 - エチルスルファニル - 2 - ピリジル ) - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピラゾロ [ 4 , 3 - c ] ピリダジン ( 1 5 m g 、 0 . 0 4 6 m m o l ) を、 ジクロロメタン ( 2 m L ) に溶解させ、 3 - クロロ過安息香酸 ( 2 1 . 7 m g 、 0 . 0 9 7 m m o l ) を、 0 度ゆっくりと加えた。得られた混合物を、 0 度で 3 0 分間、 次に室温で一晩攪拌した。この後、 さらに 1 当量の m - C P B A を加え、 反応混合物を室温で 3 0 分間攪拌し、 その時点までに、 L C M S により、 反応の完了が示された。反応混合物を、 2 m l の N a O H 1 N および 2 m l のチオ硫酸ナトリウムの飽和水溶液でクエンチした。混合物を 1 0 分間攪拌し、 次に、 水層を 1 0 m l のジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を 1 0 m l の N a O H 1 N で洗浄し、 N a<sub>2</sub>S O<sub>4</sub> 上で乾燥させ、 罗過し、 減圧下で濃縮したところ、 表題化合物が黄色の油として得られた。

L C M S ( 標準的方法 A ) ; 保持時間 0 . 8 2 分間、 3 5 8 ( M H + )。

<sup>1</sup>H N M R ( 4 0 0 M H z 、 クロロホルム - d ) p p m 1 . 4 6 ( t , J = 7 . 3 4 H z 、 3 H ) ; 3 . 9 3 ( q , J = 7 . 7 0 H z 、 2 H ) ; 7 . 8 4 ( d d , J = 8 . 0 7 、 4 . 7 7 H z 、 1 H ) ; 8 . 2 4 ( s , 1 H ) ; 8 . 6 9 ( d d , J = 7 . 8 9 、 1 . 6 5 H z 、 1 H ) ; 8 . 9 2 ( d d , J = 4 . 7 7 、 1 . 8 3 H z 、 1 H ) ; 9 . 5 3 ( d , J = 1 . 1 0 H z 、 1 H ) .

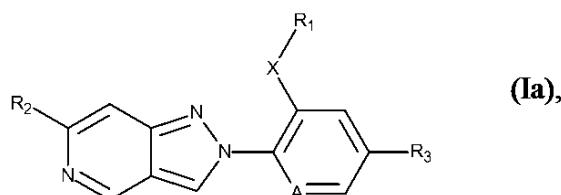
【 0 2 3 9 】

20

30

## 【表15】

表4: 式(Ia)(「Ph」が、フェニル基を表す)の化合物の例:



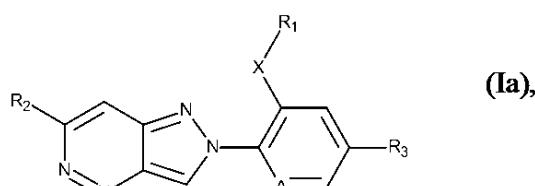
化合物番号	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	A
P1 (1.005)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	S	CH
P2 (1.006)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub>	CH
P3 (1.007)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	S	N
P4 (1.008)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub>	N
P5	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	H	S	N
P6	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	H	SO <sub>2</sub>	N
P7 (1.004)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub>	N
P8	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Br	SO <sub>2</sub>	N
P9	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	シクロプロピル	SO <sub>2</sub>	N
P10	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	SO <sub>2</sub>	N
P11 (1.010)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-ClPh	SO <sub>2</sub>	N
P12	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> Ph	SO <sub>2</sub>	N

10

## 【0240】

## 【表16】

表5: 式(Ia)の化合物の例



化合物番号	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	X	A
PP1 (2.006)	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub>	CH

30

## 【0241】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的に、殺ダニ的に、および／または殺真菌的に活性な成分を加えることによって、かなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。式Iの化合物と、他の殺虫的に、殺ダニ的に、および／または殺真菌的に活性な成分との混合物が、より広い意味で、相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、昆虫がそれらの異なる発育段階で防除され得ること、あるいはそれらの製造中、例えば粉碎または混合中

40

50

、それらの貯蔵中またはそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

【0242】

本明細書における活性成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の活性成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオニコチノイドおよびバチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

【0243】

式Iの化合物と、活性成分との以下の混合物が好ましい（「TX」という略語は、「本発明の表1～5に記載される化合物からなる群から選択される1つの化合物」を意味する）：

石油（代替名）(628) + TXからなる物質の群から選択される補助剤、  
 1, 1 - ビス(4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシエタノール(IUPAC名)(9  
 10) + TX、2, 4 - ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC / ケミカル  
 アブストラクト名)(1059) + TX、2 - フルオロ - N - メチル - N - 1 - ナフチル  
 アセドアミド(IUPAC名)(1295) + TX、4 - クロロフェニルフェニルスルホ  
 ン(IUPAC名)(981) + TX、アバメクチン(1) + TX、アセキノシル(3)  
 + TX、アセトプロール[CCN] + TX、アクリナトリン(9) + TX、アルジカルブ  
 (16) + TX、アルドキシカルブ(863) + TX、 - シペルメトリン(202) +  
 TX、アミジチオン(870) + TX、アミドフルメト[CCN] + TX、アミドチオエ  
 ート(872) + TX、アミトン(875) + TX、アミトンシュウ酸水素塩(875)  
 + TX、アミトラズ(24) + TX、アラマイド(881) + TX、三酸化ニヒ素(88  
 2) + TX、AVI 382(化合物コード) + TX、AZ 60541(化合物コード)  
 ) + TX、アジンホス - エチル(44) + TX、アジンホス - メチル(45) + TX、ア  
 ゾベンゼン(IUPAC名)(888) + TX、アゾシクロチン(46) + TX、アゾト  
 エート(889) + TX、ベノミル(62) + TX、ベノキサホス(代替名)[CCN]  
 + TX、ベンゾキシメート(71) + TX、安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN]  
 ] + TX、ビフェナゼート(74) + TX、ビフェントリン(76) + TX、ビナパクリ  
 ル(907) + TX、プロフェンバレート(代替名) + TX、プロモシクレン(918)  
 ) + TX、プロモホス(920) + TX、プロモホス - エチル(921) + TX、プロモ  
 プロピレート(94) + TX、ブプロフェジン(99) + TX、ブトカルボキシム(10  
 3) + TX、ブトキシカルボキシム(104) + TX、ブチルピリダベン(代替名) + T  
 X、多硫化カルシウム(IUPAC名)(111) + TX、カンフェクロル(941) +  
 TX、カーバノレート(943) + TX、カルバリル(115) + TX、カルボフラン(1  
 18) + TX、カルボフェノチオン(947) + TX、CGA 50'439(開発コ  
 ード)(125) + TX、キノメチオナト(126) + TX、クロルベンシド(959)  
 + TX、クロルジメホルム(964) + TX、クロルジメホルム塩酸塩(964) + TX  
 、クロルフェナピル(130) + TX、クロルフェネトール(968) + TX、クロルフ  
 ェンソン(970) + TX、クロルフェンスルフィド(971) + TX、クロルフェンビ  
 ンホス(131) + TX、クロロベンジレート(975) + TX、クロロメブホルム(9  
 77) + TX、クロロメチウロン(978) + TX、クロロプロピレート(983) + T  
 X、クロルピリホス(145) + TX、クロルピリホス - メチル(146) + TX、クロ  
 ルチオホス(994) + TX、シネリンI(696) + TX、シネリンII(696) +  
 TX、シネリン(696) + TX、クロフエンテジン(158) + TX、クロサンテル(代  
 替名)[CCN] + TX、クマホス(174) + TX、クロタミトン(代替名)[CC  
 N] + TX、クロトキシホス(1010) + TX、クフラネブ(1013) + TX、シア  
 ントエート(1020) + TX、シフルメトフェン(CAS登録番号: 400882-0  
 7-7) + TX、シハロトリン(196) + TX、シヘキサチン(199) + TX、シペ  
 ルメトリン(201) + TX、DCPM(1032) + TX、DDT(219) + TX、  
 50

デメフィオン(1037) + TX、デメフィオン-O(1037) + TX、デメフィオン-S(1037) + TX、デメトン(1038) + TX、デメトン-Mチル(224) + TX、デメトン-O(1038) + TX、デメトン-O-Mチル(224) + TX、デメトン-S(1038) + TX、デメトン-S-Mチル(224) + TX、デメトン-S-Mチルスルホン(1039) + TX、ジアフェンチウロン(226) + TX、ジアリホス(1042) + TX、ジアジノン(227) + TX、ジクロフルアニド(230) + TX、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス(代替名) + TX、ジコホル(242) + TX、ジクロトホス(243) + TX、ジエノクロル(1071) + TX、ジメホックス(1081) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジナクチン(代替名)(653) + TX、ジネクス(1089) + TX、ジネクス-ジクレキシン(1089) + TX、ジノブトン(269) + TX、ジノカップ(270) + TX、ジノカップ-4 [CCN] + TX、ジノカップ-6 [CCN] + TX、ジノクトン(1090) + TX、ジノペントン(1092) + TX、ジノスルホン(1097) + TX、ジノテルボン(1098) + TX、ジオキサチオン(1102) + TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1103) + TX、ジスルフィラム(代替名)[CCN] + TX、ジスルホトン(278) + TX、DNO C(282) + TX、ドフェナピン(1113) + TX、ドラメクチン(代替名)[CCN] + TX、エンドスルファン(294) + TX、エンドチオン(1121) + TX、EPN(297) + TX、エプリノメクチン(代替名)[CCN] + TX、エチオン(309) + TX、エトエート-Mチル(1134) + TX、エトキサゾール(320) + TX、エトリムホス(1142) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェナザキン(328) + TX、酸化フェンブタスズ(330) + TX、フェノチオカルブ(337) + TX、フェンプロパトリン(342) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンピロキシメート(345) + TX、フェンソン(1157) + TX、フェントリファニル(1161) + TX、フェンバレレート(349) + TX、フィプロニル(354) + TX、フルアクリピリム(360) + TX、フルアズロン(1166) + TX、フルベンジミン(1167) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルオルベンシド(1174) + TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC 1137(開発コード)(1185) + TX、ホルメタネート(405) + TX、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムパラネート(1193) + TX、-HCH(430) + TX、グリオジン(1205) + TX、ハルフェンプロックス(424) + TX、ヘプテノホス(432) + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1216) + TX、ヘキシチアゾクス(441) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、イソカルボホス(代替名)(473) + TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473) + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ヨードフェンホス(1248) + TX、リンダン(430) + TX、ルフェヌロン(490) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX、メカルバム(502) + TX、メホスホラン(1261) + TX、メスルフェン(代替名)[CCN] + TX、メタクリホス(1266) + TX、メタミドホス(527) + TX、メチダチオン(529) + TX、メチオカルブ(530) + TX、メトミル(531) + TX、臭化メチル(537) + TX、メトルカルブ(550) + TX、メビンホス(556) + TX、メキサカルベート(1290) + TX、ミルベメクチン(557) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、ミパホックス(1293) + TX、モノクロトホス(561) + TX、モルホチオン(1300) + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ナレド(567) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、NC-512(化合物コード) + TX、ニフルリジド(1309) + TX、ニコマイシン(代替名)[CCN] + TX、二トリラカルブ(1313) + TX、二トリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313) + TX

X、NNI-0101(化合物コード) + TX、NNI-0250(化合物コード) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(602) + TX、オキシデプロホス(1324) + TX、オキシジスルホトン(1325) + TX、pp'-DDT(219) + TX、パラチオン(615) + TX、ペルメトリン(626) + TX、石油(代替名)(628) + TX、フェンカプトン(1330) + TX、フェントエート(631) + TX、ホレート(636) + TX、ホサロン(637) + TX、ホスホラン(1338) + TX、ホスマット(638) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホキシム(642) + TX、ピリミホス-メチル(652) + TX、ポリクロロテルベン(慣用名)(1347) + TX、ポリナクチン(代替名)(653) + TX、プロクロノール(1350) + TX、プロフェノホス(662) + TX、プロマシル(1354) + TX、プロバルギット(671) + TX、プロペタンホス(673) + TX、プロポクサー(678) + TX、プロチダチオン(1360) + TX、プロトエート(1362) + TX、ピレトリニ(696) + TX、ピレトリニ(696) + TX、ピレトリニ(696) + TX、ピリダベン(699) + TX、ピリダフェンチオン(701) + TX、ピリミジフェン(706) + TX、ピリミテート(1370) + TX、キナルホス(711) + TX、キンチオホス(quintiof os)(1381) + TX、R-1492(開発コード)(1382) + TX、RA-17(開発コード)(1383) + TX、ロテノン(722) + TX、シュラーダン(1389) + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、SI-0009(化合物コード) + TX、ソファミド(1402) + TX、スピロジクロフェン(738) + TX、スピロメシフェン(739) + TX、SSI-121(開発コード)(1404) + TX、スルフィラム(代替名)[CCN] + TX、スルフルアミド(750) + TX、スルホテップ(753) + TX、硫黄(754) + TX、SIZ-121(開発コード)(757) + TX、-フルバリネット(398) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、TEPP(1417) + TX、テルバム(代替名) + TX、テトラクロルビンホス(777) + TX、テトラジホン(786) + TX、テトラナクチン(代替名)(653) + TX、テトラスル(1425) + TX、チアフェノックス(代替名) + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオファノックス(800) + TX、チオメトン(801) + TX、チオキノックス(1436) + TX、ツリンギエンシン(代替名)[CCN] + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアラテン(1443) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリナクチン(代替名)(653) + TX、バミドチオン(847) + TX、バニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード) + TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤、

ベトキサジン[CCN] + TX、ジオクタン酸銅(IUPAC名)(170) + TX、硫酸銅(172) + TX、シブトリン[CCN] + TX、ジクロン(1052) + TX、ジクロロフェン(232) + TX、エンドタール(295) + TX、フェンチン(347) + TX、消石灰[CCN] + TX、ナーバム(566) + TX、キノクラミン(714) + TX、キノナミド(1379) + TX、シマジン(730) + TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC名)(347) + TXからなる物質の群から選択される殺藻剤、

アバメクチン(1) + TX、クルホマート(1011) + TX、ドラメクチン(代替名)[CCN] + TX、エマメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、エプリノメクチン(代替名)[CCN] + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ピペラジン[CCN] + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、スピノサド(737)およびチオファネート(1435) + TXからなる物質の群から選択される駆虫剤、

クロラロース(127) + TX、エンドリン(1122) + TX、フェンチオン(346) + TX、ピリジン-4-アミン(IUPAC名)(23)およびストリキニーネ(750)

45) + TX からなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1 - ヒドロキシ - 1H - ピリジン - 2 - チオノン (IUPAC名) (1222) + TX、  
 4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (74  
 8) + TX、8 - ヒドロキシキノリン硫酸塩 (446) + TX、プロノポール (97) +  
 TX、ジオクタン酸銅 (IUPAC名) (170) + TX、水酸化銅 (IUPAC名) (1  
 169) + TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン (232) + TX、ジピ  
 リチオン (1105) + TX、ドジシン (1112) + TX、フェナミノスルフ (114  
 4) + TX、ホルムアルデヒド (404) + TX、ヒドラルガフェン (代替名) [CCN]  
 ] + TX、カスガマイシン (483) + TX、塩酸カスガマイシン水和物 (483) + T  
 X、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート) (IUPAC名) (1308) + TX  
 10  
 、ニトラピリン (580) + TX、オクチリノン (590) + TX、オキソリン酸 (60  
 6) + TX、オキシテトラサイクリン (611) + TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩 (446) + TX、プロペナゾール (658) + TX、ストレプトマイシン (744) + TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン (744) + TX、テクロフタラム (766) + TX、およびチオメルサー (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択さ  
 れる殺菌剤、

コカクモンハマキ (Adoxophyes orana) GV (代替名) (12) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobacter) (代替名) (13) + TX、ムチカブリダニ属 (Amblyseius spp.) (代替名) (19) + TX、アナグラファ・ファルシフェラ (Anagrapha falcifera) NPV (代替名) (28) + TX、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) (代替名) (29) + TX、アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (代替名) (33) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (代替名) (34) + TX、アフィドレテス・アフィジミザ (Aphidoletes aphidimyza) (代替名) (35) + TX、オートグラファ・カリフォルニカ (Autographa californica) NPV (代替名) (38) + TX、バチルス・フィルムス (Bacillus firmus) (代替名) (48) + TX、バチルス・スフェリクス・ネイデ (Bacillus sphaericus Neide) (学名) (49) + TX、バチルス・チューリングンシス・ベルリナー (Bacillus thuringiensis Berliner) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亞種アイザワイ (Bacillus thuringiensis subsp. aizawai) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亞種イスラエンシス (Bacillus thuringiensis subsp. israelensis) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亞種ジャポネンシス (Bacillus thuringiensis subsp. japonensis) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亞種クルスター (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングンシス亞種テネブリオニス (Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis) (学名) (51) + TX、ビューベリア・バシアナ (Beauveria bassiana) (代替名) (53) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (Beauveria brongniartii) (代替名) (54) + TX、クリソペラ・カルネア (Chrysoperla carnea) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオテントウムシ (Cryptolaemus montrouzieri) (代替名) (178) + TX、コドリンガ (Cydia pomonella) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacus sibirica) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa) (学名) (293) + TX、サバクツツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (代替名) (300) + TX、アメリカ

50

タバコガ (*Helicoverpa zea*) N P V (代替名) (431) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) および *H. megidis* (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、レプトマステイクス・ダクチロピイ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリギノスス (*Macrolaphus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) N P V (代替名) (494) + TX、メタフィカス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリヅム (*Metarhizium anisopliae var. acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae var. anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) N P V 10 および *N. lecontei* N P V (代替名) (575) + TX、オリウス属 (*Orius spp.*) (代替名) (596) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジョトウ (*Spodoptera exigua*) 多カブシド核多角体病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・カルポカブサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・グラッセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravisi*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・スカブテリシ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ属 (*Steinernema spp.*) (代替名) (742) + TX、トリコグラムマ属 (*Trichogramma spp.*) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) および バーティシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、

ヨードメタン (IUPAC名) (542) および 臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壤滅菌剤、

アフォレート [CCN] + TX、ビサジル (代替名) [CCN] + TX、ブスルファン (代替名) [CCN] + TX、ジフルベンズロン (250) + TX、ジマチフ (代替名) [CCN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘンパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] + TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアフォレート [CCN] + TX、モルジド [CCN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオヘンパ (代替名) [CCN] + TX、チオテパ (代替名) [CCN] + TX、トレタミン (代替名) [CCN] および ウレデパ (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される不妊化剤、

(E)-デカ-5-エン-1-イルアセテートおよび(E)-デカ-5-エン-1-オール (IUPAC名) (222) + TX、(E)-トリデカ-4-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (829) + TX、(E)-6-メチルヘプタ-2-エン-4-オール (IUPAC名) (541) + TX、(E, Z)-テトラデカ-4, 10-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z)-ドデカ-7-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z)-ヘキサデカ-11-エナール (IUPAC名) (436) + TX、(Z)-ヘキサデカ-11-エン-1-イルアセ

10

20

30

40

50

テート( IUPAC名)(437) + TX、(Z)-ヘキサデカ-13-エン-11-イン-1-イルアセテート( IUPAC名)(438) + TX、(Z)-イコサ-13-エン-10-オン( IUPAC名)(448) + TX、(Z)-テトラデカ-7-エン-1-アール( IUPAC名)(782) + TX、(Z)-テトラデカ-9-エン-1-オール( IUPAC名)(783) + TX、(Z)-テトラデカ-9-エン-1-イルアセテート( IUPAC名)(784) + TX、(7E, 9Z)-ドデカ-7, 9-ジエン-1-イルアセテート( IUPAC名)(283) + TX、(9Z, 11E)-テトラデカ-9, 11-ジエン-1-イルアセテート( IUPAC名)(780) + TX、(9Z, 12E)-テトラデカ-9, 12-ジエン-1-イルアセテート( IUPAC名)(781) + TX、14-メチルオクタデカ-1-エン( IUPAC名)(545) + TX、4-メチルノナン-5-オールおよび4-メチルノナン-5-オン( IUPAC名)(544) + TX、-マルチストリアチン(代替名)[CCN] + TX、プレビコミン(代替名)[CCN] + TX、コドレルア(代替名)[CCN] + TX、コドレモン(代替名)(167) + TX、キュールア(代替名)(179) + TX、ディスパールア(277) + TX、ドデカ-8-エン-1-イルアセテート( IUPAC名)(286) + TX、ドデカ-9-エン-1-イルアセテート( IUPAC名)(287) + TX、ドデカ-8+TX、10-ジエン-1-イルアセテート( IUPAC名)(284) + TX、ドミニカルア(代替名)[CCN] + TX、4-メチルオクタン酸エチル( IUPAC名)(317) + TX、オイゲノール(代替名)[CCN] + TX、フロンタリン(代替名)[CCN] + TX、ゴシップルア(代替名)(420) + TX、グランドルア(421) + TX、グランドルアI(代替名)(421) + TX、グランドルアII(代替名)(421) + TX、グランドルアIII(代替名)(421) + TX、グランドルアIV(代替名)(421) + TX、ヘキサルア[CCN] + TX、イプスジエノール(代替名)[CCN] + TX、イプセノール(代替名)[CCN] + TX、ジャポニルア(代替名)(481) + TX、リネアチン(代替名)[CCN] + TX、リトルア(代替名)[CCN] + TX、ループルア(代替名)[CCN] + TX、メドルア[CCN] + TX、メガトモ酸(代替名)[CCN] + TX、メチルオイゲノール(代替名)(540) + TX、ムスカルア(563) + TX、オクタデカ-2, 13-ジエン-1-イルアセテート( IUPAC名)(588) + TX、オクタデカ-3, 13-ジエン-1-イルアセテート( IUPAC名)(589) + TX、オルフラルア(代替名)[CCN] + TX、オリクタルア(代替名)(317) + TX、オストラモン(代替名)[CCN] + TX、シグルア[CCN] + TX、ソルジジン(代替名)(736) + TX、スルカトール(代替名)[CCN] + TX、テトラデカ-11-エン-1-イルアセテート( IUPAC名)(785) + TX、トリメドルア(839) + TX、トリメドルアA(代替名)(839) + TX、トリメドルアB<sub>1</sub>(代替名)(839) + TX、トリメドルアB<sub>2</sub>(代替名)(839) + TX、トリメドルアC(代替名)(839)およびトランク-コール(trunc-call)(代替名)[CCN] + TXからなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、  
 2-(オクチルチオ)エタノール( IUPAC名)(591) + TX、ブトピロノキシリ(933) + TX、ブトキシ(ポリプロピレングリコール)(936) + TX、アジピン酸ジブチル( IUPAC名)(1046) + TX、フタル酸ジブチル(1047) + TX、コハク酸ジブチル( IUPAC名)(1048) + TX、ジエチルトルアミド[CCN] + TX、ジメチルカルベート[CCN] + TX、フタル酸ジメチル[CCN] + TX、エチルヘキサンジオール(1137) + TX、ヘキサアミド[CCN] + TX、メトキン-ブチル(1276) + TX、メチルネオデカンアミド[CCN] + TX、オキサメート[CCN]およびピカリジン[CCN] + TXからなる物質の群から選択される昆虫忌避剤、

1-ジクロロ-1-ニトロエタン( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1058) + TX、1, 1-ジクロロ-2, 2-ビス(4-エチルフェニル)エタン( IUPAC名)(1056) + TX、1, 2-ジクロロプロパン( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1062) + TX、1, 2-ジクロロプロパンおよび1, 3-ジクロロブ

ロペン( IUPAC名)(1063)+TX、1-ブロモ-2-クロロエタン( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(916)+TX、2,2,2-トリクロロ-1-(3,4-ジクロロフェニル)エチルアセテート( IUPAC名)(1451)+TX、2,2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート( IUPAC名)(1066)+TX、2-(1,3-ジチオラン-2-イル)フェニルジメチルカルバメート( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1109)+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルチオシアネート( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(935)+TX、2-(4,5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニルメチルカルバメート( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1084)+TX、2-(4-クロロ-3,5-キシリルオキシ)エタノール( IUPAC名)(986)+TX、  
 2-クロロビニルジエチルホスフェート( IUPAC名)(984)+TX、2-イミダゾリドン( IUPAC名)(1225)+TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン( IUPAC名)(1246)+TX、2-メチル(プロパ-2-イニル)アミノフェニルメチルカルバメート( IUPAC名)(1284)+TX、2-チオシアナトエチルラウレート( IUPAC名)(1433)+TX、3-ブロモ-1-クロロプロパ-1-エン( IUPAC名)(917)+TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート( IUPAC名)(1283)+TX、4-メチル(プロパ-2-イニル)アミノ-3,5-キシリルメチルカルバメート( IUPAC名)(1285)+TX、5,5-ジメチル-3-オキソシクロヘキサ-1-エニルジメチルカルバメート( IUPAC名)(1085)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセフェート(2)+TX、アセタミブリド(4)+TX、アセチオン(代替名)[CCN]+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アクリロニトリル( IUPAC名)(861)+TX、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、アルドリン(864)+TX、アレスリン(17)+TX、アロサミジン(代替名)[CCN]+TX、アリキシカルブ(866)+TX、-シペルメトリン(202)+TX、-エクジソン(代替名)[CCN]+TX、リン化アルミニウム(640)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミノカルブ(873)+TX、アミトン(875)+TX、アミトンシュウ酸水素塩(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アナバシン(877)+TX、アチダチオン(883)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アザジラクチン(代替名)(41)+TX、アザメチホス(42)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾトエート(889)+TX、バチルス・チューリゲンシス(Bacillus thuringiensis)デルタエンドトキシン(代替名)(52)+TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム(代替名)[CCN]+TX、多硫化バリウム( IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(892)+TX、バルトリン[CCN]+TX、Bayer 22/190(開発コード)(893)+TX、Bayer 22408(開発コード)(894)+TX、ベンジオカルブ(58)+TX、ベンフラカルブ(60)+TX、ベンスルタップ(66)+TX、-シフルトリン(194)+TX、-シペルメトリン(203)+TX、ビフェントリン(76)+TX、ビオアレトリン(78)+TX、ビオアレトリンS-シクロペンテニル異性体(代替名)(79)+TX、ビオエタノメトリン[CCN]+TX、ビオペルメトリン(908)+TX、ビオレスメトリン(80)+TX、ビス(2-クロロエチル)エーテル( IUPAC名)(909)+TX、ビストリフルロン(83)+TX、ホウ砂(86)+TX、プロフェンバレート(代替名)+TX、ブロムフェンビンホス(914)+TX、ブロモシクレン(918)+TX、ブロモ-D D T(代替名)[CCN]+TX、ブロモホス(920)+TX、ブロモホス-エチル(921)+TX、ブフェンカルブ(924)+TX、ブプロフェジン(99)+TX、ブタカルブ(926)+TX、ブタチオホス(927)+TX、ブトカルボキシム(103)+TX、ブトネート(932)+TX、ブトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサホス(109)+TX、ヒ酸力  
 10  
 20  
 30  
 40  
 50

ルシウム [ C C N ] + TX、シアノ化カルシウム ( 444 ) + TX、多硫化カルシウム ( IUPAC名 ) ( 111 ) + TX、カンフェクロル ( 941 ) + TX、カーバノレート ( 943 ) + TX、カルバリル ( 115 ) + TX、カルボフラン ( 118 ) + TX、二硫化炭素 ( IUPAC / ケミカルアブストラクト名 ) ( 945 ) + TX、四塩化炭素 ( IUPAC名 ) ( 946 ) + TX、カルボフェノチオン ( 947 ) + TX、カルボスルファン ( 119 ) + TX、カルタップ ( 123 ) + TX、カルタップ塩酸塩 ( 123 ) + TX、セバジン ( 代替名 ) ( 725 ) + TX、クロルビシクレン ( 960 ) + TX、クロルダン ( 128 ) + TX、クロルデコン ( 963 ) + TX、クロルジメホルム ( 964 ) + TX、クロルジメホルム塩酸塩 ( 964 ) + TX、クロルエトキシホス ( 129 ) + TX、クロルフェナビル ( 130 ) + TX、クロルフェンビンホス ( 131 ) + TX、クロルフルアズロン ( 132 ) + TX、クロルメホス ( 136 ) + TX、クロロホルム [ C C N ] + TX、クロロビクリン ( 141 ) + TX、クロルホキシム ( 989 ) + TX、クロルプラゾホス ( 990 ) + TX、クロルピリホス ( 145 ) + TX、クロルピリホス - メチル ( 146 ) + TX、クロルチオホス ( 994 ) + TX、クロマフェノジド ( 150 ) + TX、シネリンI ( 696 ) + TX、シネリンII ( 696 ) + TX、シネリン ( 696 ) + TX、シス - レスマトリノ ( 代替名 ) + TX、シスマトリノ ( 80 ) + TX、クロシトリノ ( 代替名 ) + TX、クロエトカルブ ( 999 ) + TX、クロサンテル ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、クロチアニジン ( 165 ) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [ C C N ] + TX、ヒ酸銅 [ C C N ] + TX、オレイン酸銅 [ C C N ] + TX、クマホス ( 174 ) + TX、クミトイート ( 1006 ) + TX、クロタミトン ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、クロトキシホス ( 1010 ) + TX、クルホマート ( 1011 ) + TX、氷晶石 ( 代替名 ) ( 177 ) + TX、CS 708 ( 開発コード ) ( 1012 ) + TX、シアノフェンホス ( 1019 ) + TX、シアノホス ( 184 ) + TX、シアントエート ( 1020 ) + TX、シクレトリノ [ C C N ] + TX、シクロプロトリン ( 188 ) + TX、シフルトリン ( 193 ) + TX、シハロトリン ( 196 ) + TX、シペルメトリノ ( 201 ) + TX、シフェノトリノ ( 206 ) + TX、シロマジン ( 209 ) + TX、サイチオアート ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、d - リモネン ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、d - テトラメトリノ ( 代替名 ) ( 788 ) + TX、DAEP ( 1031 ) + TX、ダゾメット ( 216 ) + TX、DDT ( 219 ) + TX、デカルボフラン ( 1034 ) + TX、デルタメトリノ ( 223 ) + TX、デメフィオン ( 1037 ) + TX、デメフィオン - O ( 1037 ) + TX、デメフィオン - S ( 1037 ) + TX、デメトン ( 1038 ) + TX、デメトン - メチル ( 224 ) + TX、デメトン - O ( 1038 ) + TX、デメトン - O - メチル ( 224 ) + TX、デメトン - S ( 1038 ) + TX、デメトン - S - メチル ( 224 ) + TX、デメトン - S - メチルスルホン ( 1039 ) + TX、ジアフェンチウロン ( 226 ) + TX、ジアリホス ( 1042 ) + TX、ジアミダホス ( 1044 ) + TX、ジアジノン ( 227 ) + TX、ジカプトン ( 1050 ) + TX、ジクロフェンチオノ ( 1051 ) + TX、ジクロルボス ( 236 ) + TX、ジクリホス ( 代替名 ) + TX、ジクレシル ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、ジクロトホス ( 243 ) + TX、ジシクラニル ( 244 ) + TX、ジエルドリン ( 1070 ) + TX、ジエチル5 - メチルピラゾール - 3 - イルホスフェート ( IUPAC名 ) ( 1076 ) + TX、ジフルベンズロン ( 250 ) + TX、ジロール ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、ジメフルトリノ [ C C N ] + TX、ジメホックス ( 1081 ) + TX、ジメタン ( 1085 ) + TX、ジメトエート ( 262 ) + TX、ジメトリノ ( 1083 ) + TX、ジメチルビンホス ( 265 ) + TX、ジメチラン ( 1086 ) + TX、ジネクス ( 1089 ) + TX、ジネクス - ジクレキシン ( 1089 ) + TX、ジノプロブ ( 1093 ) + TX、ジノサム ( 1094 ) + TX、ジノセブ ( 1095 ) + TX、ジノテフラン ( 271 ) + TX、ジオフェノラン ( 1099 ) + TX、ジオキサベンゾホス ( 1100 ) + TX、ジオキサカルブ ( 1101 ) + TX、ジオキサチオノ ( 1102 ) + TX、ジスルホトン ( 278 ) + TX、ジチクロホス ( 1108 ) + TX、DNOOC ( 282 ) + TX、ドラメクチン ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、DSP ( 1115 ) + TX、エクジステロン ( 代替名 ) [ C C N ] + TX、EI 1642 ( 開発コード ) ( 1118 ) + TX、エ 10

20

30

40

50

マメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、EMP C(1  
 120) + TX、エンペントリン(292) + TX、エンドスルファン(294) + TX  
 、エンドチオン(1121) + TX、エンドリン(1122) + TX、EPBP(112  
 3) + TX、EPN(297) + TX、エボフェノナン(1124) + TX、エプリノメ  
 クチン(代替名)[CCN] + TX、エスフェンバレート(302) + TX、エタホス  
 (代替名)[CCN] + TX、エチオフェンカルブ(308) + TX、エチオン(309  
 ) + TX、エチプロール(310) + TX、エトエート-メチル(1134) + TX、エ  
 トプロホス(312) + TX、ギ酸エチル(IUPAC名)[CCN] + TX、エチル-  
 DDD(代替名)(1056) + TX、二臭化工チレン(316) + TX、二塩化工チレ  
 ン(化学名)(1136) + TX、エチレンオキシド[CCN] + TX、エトフェンプロ  
 ックス(319) + TX、エトリムホス(1142) + TX、EXD(1143) + TX  
 、ファンファー(323) + TX、フェナミホス(326) + TX、フェナザフロル(1  
 147) + TX、フェンクロルホス(1148) + TX、フェネタカルブ(1149) +  
 TX、フェンフルトリン(1150) + TX、フェニトロチオン(335) + TX、フェ  
 ノブカルブ(336) + TX、フェノキサクリム(1153) + TX、フェノキシカルブ  
 (340) + TX、フェンピリトリン(1155) + TX、フェンプロパトリン(342  
 ) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンスルホチオン(1158) + TX、フ  
 ェンチオン(346) + TX、フェンチオン-エチル[CCN] + TX、フェンバレー  
 ト(349) + TX、フィプロニル(354) + TX、フロニカミド(358) + TX、  
 フルベンジアミド(CAS登録番号:272451-65-7) + TX、フルコフロン  
 (1168) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシリネート(367  
 ) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェネリム[CCN] + TX、フルフ  
 エノクスロン(370) + TX、フルフェンプロックス(1171) + TX、フルメトリ  
 ン(372) + TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC 1137(開発コー  
 ド)  
 )(1185) + TX、ホノホス(1191) + TX、ホルメタネート(405) + TX  
 、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムバラ  
 ネート(1193) + TX、ホスマチラン(1194) + TX、ホスピレート(1195  
 ) + TX、ホスチアゼート(408) + TX、ホスチエタン(1196) + TX、フラチ  
 オカルブ(412) + TX、フレトリン(1200) + TX、 -シハロトリン(197  
 ) + TX、 -HCH(430) + TX、グアザチン(422) + TX、酢酸グアザチン  
 (422) + TX、GY-81(開発コード)(423) + TX、ハルフェンプロックス  
 (424) + TX、ハロフェノジド(425) + TX、HCH(430) + TX、HEOD(1070  
 ) + TX、ヘブタクロル(1211) + TX、ヘブテノホス(432) + TX、  
 ヘテロホス[CCN] + TX、ヘキサフルムロン(439) + TX、HHDN(86  
 4) + TX、ヒドロメチルノン(443) + TX、シアノ化水素(444) + TX、ハイ  
 ドロブレン(445) + TX、ヒキンカルブ(1223) + TX、イミダクロブリド(4  
 58) + TX、イミプロトリン(460) + TX、インドキサカルブ(465) + TX、  
 ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、IPSP(1229) + TX、イサゾ  
 ホス(1231) + TX、イソベンゼン(1232) + TX、イソカルボホス(代替名)  
 (473) + TX、イソドリン(1235) + TX、イソフェンホス(1236) + TX  
 、イソラン(1237) + TX、イソプロカルブ(472) + TX、イソプロピルO-(  
 メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473) + TX、イソ  
 プロチオラン(474) + TX、イソチオエート(1244) + TX、イソキサチオン(4  
 80) + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ジャスモリンI(696  
 ) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ヨードフェンホス(1248) + TX、  
 幼若ホルモンI(代替名)[CCN] + TX、幼若ホルモンII(代替名)[CCN] +  
 TX、幼若ホルモンIII(代替名)[CCN] + TX、ケレバン(1249) + TX、  
 キノブレン(484) + TX、 -シハロトリン(198) + TX、ヒ酸鉛[CCN] +  
 TX、レビメクチン(CCN) + TX、レプトホス(1250) + TX、リンダン(43  
 50)

0 ) + TX、リリムホス(1251) + TX、ルフェヌロン(490) + TX、リチダチ  
 オン(1253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1014)  
 ) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、マラチオン(492)  
 ) + TX、マロノベン(1254) + TX、マジドックス(1255) + TX、メカルバ  
 ム(502) + TX、メカルフォン(1258) + TX、メナゾン(1260) + TX、  
 メホスホラン(1261) + TX、塩化第一水銀(513) + TX、メスルフェンホス(1263) + TX、メタフルミゾン[CCN] + TX、メタム(519) + TX、メタム-カリウム(代替名)(519) + TX、メタム-ナトリウム(519) + TX、メタクリホス(1266) + TX、メタミドホス(527) + TX、フッ化メタンスルホニル(IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1268) + TX、メチダチオン(529)  
 + TX、メチオカルブ(530) + TX、メトクロトホス(1273) + TX、メトミル(531) + TX、メトブレン(532) + TX、メトキン-ブチル(1276) + TX、メトトリノジド(535) + TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネット(543) + TX、メチルクロロホルム(代替名)[CCN] + TX、塩化メチレン[CCN] + TX、メトフルトリノジド(533) + TX、メトキシクロル(534) + TX、メトキシフェノジド(535) + TX、ミルベメクチン(557) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、ミパホックス(1293) + TX、ミレックス(1294) + TX、モノクロトホス(561) + TX、モルホチオン(1300) + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ナフタロホス(代替名)[CCN] + TX、ナレド(567) + TX、ナフタレン(IUPAC / ケミカルアブストラクト名)(1303) + TX、NC-170(開発コード)(1306) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、ニコチノジド(578) + TX、硫酸ニコチノジド(578) + TX、ニフルリジド(1309) + TX、ニテンピラム(579) + TX、ニチアジン(1311) + TX、ニトリラカルブ(1313) + TX、ニトリラカルブ1 : 1 塩化亜鉛錯体(1313) + TX、NNI-0101(化合物コード) + TX、NNI-0250(化合物コード) + TX、ノルニコチノジド(1319) + TX、ノバルロン(585) + TX、ノビフルムロン(586) + TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057) + TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1074) + TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075) + TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジオキソホスフェート(IUPAC名)(1424) + TX、オレイン酸(IUPAC名)(593) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(602) + TX、オキシデメトン-メチル(609) + TX、オキシデプロホス(1324) + TX、オキシジスルホトン(1325) + TX、pp'-DDT(219) + TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN] + TX、パラチオン(615) + TX、パラチオン-メチル(616) + TX、ペンフルロン(代替名)[CCN] + TX、ペンタクロロフェノール(623) + TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623) + TX、ペルメトリン(626) + TX、石油(代替名)(628) + TX、PH-60-38(開発コード)(1328) + TX、フェンカプトン(1330) + TX、フェノトリノジド(630) + TX、フェントエート(631) + TX、ホレート(636) + TX、ホサロン(637) + TX、ホスホラン(1338) + TX、ホスマット(638) + TX、ホスニクロール(1339) + TX、ホスファミド(639) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、ホキシム(642) + TX、ホキシム-メチル(1340) + TX、ピリメタホス(1344) + TX、ピリミカルブ(651) + TX、ピリミホス-エチル(1345) + TX、ピリミホス-メチル(652) + TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346) + TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347) + TX、亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、カリウムチオシアネット[CCN]

10

20

30

40

50

]<sup>10</sup> + TX、 プラレトリン ( 655 ) + TX、 プレコセン I ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 プレコセン II ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 プレコセン III ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 プリミドホス ( 1349 ) + TX、 プロフェノホス ( 662 ) + TX、 プロフルトリン [ CCN ] + TX、 プロマシル ( 1354 ) + TX、 プロメカルブ ( 1355 ) + TX、 プロパホス ( 1356 ) + TX、 プロペタンホス ( 673 ) + TX、 プロポクサー ( 678 ) + TX、 プロチダチオン ( 1360 ) + TX、 プロチオホス ( 686 ) + TX、 プロトエート ( 1362 ) + TX、 プロトリフェンピュート [ CCN ] + TX、 ピメトロジン ( 688 ) + TX、 ピラクロホス ( 689 ) + TX、 ピラゾホス ( 693 ) + TX、 ピレスメトリン ( 1367 ) + TX、 ピレトリン I ( 696 ) + TX、 ピレトリン II ( 696 ) + TX、 ピレトリン ( 696 ) + TX、 ピリダベン ( 699 ) + TX、 ピリダリル ( 700 ) + TX、 ピリダフェンチオン ( 701 ) + TX、 ピリミジフェン ( 706 ) + TX、 ピリミテート ( 1370 ) + TX、 ピリプロキシフェン ( 708 ) + TX、 クアッシア ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 キナルホス ( 711 ) + TX、 キナルホス - メチル ( 1376 ) + TX、 キノチオン ( 1380 ) + TX、 キンチオホス ( 1381 ) + TX、 R - 1492 ( 開発コード ) ( 1382 ) + TX、 ラフオキサニド ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 レスマトリン ( 719 ) + TX、 ロテノン ( 722 ) + TX、 RU 15525 ( 開発コード ) ( 723 ) + TX、 RU 25475 ( 開発コード ) ( 1386 ) + TX、 リアニア ( 代替名 ) ( 1387 ) + TX、 リアノジン ( 慣用名 ) ( 1387 ) + TX、 サバジラ ( 代替名 ) ( 725 ) + TX、 シュラーダン ( 1389 ) + TX、 セブホス ( 代替名 ) + TX、 セラメクチン ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 SI - 0009 ( 化合物コード ) + TX、 SI - 0205 ( 化合物コード ) + TX、 SI - 0404 ( 化合物コード ) + TX、 SI - 0405 ( 化合物コード ) + TX、 シラフルオフェン ( 728 ) + TX、 SN 72129 ( 開発コード ) ( 1397 ) + TX、 亜ヒ酸ナトリウム [ CCN ] + TX、 シアン化ナトリウム ( 444 ) + TX、 フッ化ナトリウム ( IUPAC / ケミカルアブストラクト名 ) ( 1399 ) + TX、 ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム ( 1400 ) + TX、 ナトリウムペンタクロロフェノキシド ( 623 ) + TX、 セレン酸ナトリウム ( IUPAC 名 ) ( 1401 ) + TX、 ナトリウムチオシアネット [ CCN ] + TX、 ソファミド ( 1402 ) + TX、 スピノサド ( 737 ) + TX、 スピロメシフェン ( 739 ) + TX、 スピロテトラマト ( CCN ) + TX、 スルコフロン ( 746 ) + TX、 スルコフロン - ナトリウム ( 746 ) + TX、 スルフルアミド ( 750 ) + TX、 スルホテップ ( 753 ) + TX、 フッ化スルフリル ( 756 ) + TX、 スルプロオス ( 1408 ) + TX、 タール油 ( 代替名 ) ( 758 ) + TX、 - フルバリネート ( 398 ) + TX、 タジムカルブ ( 1412 ) + TX、 TDE ( 1414 ) + TX、 テブフェノジド ( 762 ) + TX、 テブフェンピラド ( 763 ) + TX、 テブピリムホス ( 764 ) + TX、 テフルベンズロン ( 768 ) + TX、 テフルトリン ( 769 ) + TX、 テメホス ( 770 ) + TX、 TEPP ( 1417 ) + TX、 テラレトリン ( 1418 ) + TX、 テルバム ( 代替名 ) + TX、 テルブホス ( 773 ) + TX、 テトラクロロエタン [ CCN ] + TX、 テトラクロルビンホス ( 777 ) + TX、 テトラメトリン ( 787 ) + TX、 - シペルメトリン ( 204 ) + TX、 チアクロブリド ( 791 ) + TX、 チアフェノックス ( 代替名 ) + TX、 チアメトキサム ( 792 ) + TX、 チクロホス ( 1428 ) + TX、 チオカルボキシム ( 1431 ) + TX、 チオシクラム ( 798 ) + TX、 チオシクラムシュウ酸水素塩 ( 798 ) + TX、 チオジカルブ ( 799 ) + TX、 チオファノックス ( 800 ) + TX、 チオメトン ( 801 ) + TX、 チオナジン ( 1434 ) + TX、 チオスルタップ ( 803 ) + TX、 チオスルタップ - ナトリウム ( 803 ) + TX、 ツリンギエンシン ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 トルフェンピラド ( 809 ) + TX、 トラロメトリン ( 812 ) + TX、 トランスフルトリン ( 813 ) + TX、 トランスペルメトリン ( 1440 ) + TX、 トリアミホス ( 1441 ) + TX、 トリアザメート ( 818 ) + TX、 トリアゾホス ( 820 ) + TX、 トリアズロン ( 代替名 ) + TX、 トリクロルホン ( 824 ) + TX、 トリクロルメタホス - 3 ( 代替名 ) [ CCN ] + TX、 トリクロロナート ( 1452 ) + TX、 トリフェノホス ( 1455 ) + TX、 トリフルムロン ( 835 ) + TX、 トリメタカルブ <sup>20</sup>  
<sup>30</sup>  
<sup>40</sup>  
<sup>50</sup>

( 8 4 0 ) + TX、トリブレン( 1 4 5 9 ) + TX、バミドチオン( 8 4 7 ) + TX、バニリプロール[ C C N ] + TX、ベラトリジン( 代替名 )( 7 2 5 ) + TX、ベラトリン( 代替名 )( 7 2 5 ) + TX、XMC( 8 5 3 ) + TX、キシリルカルブ( 8 5 4 ) + TX

、YI - 5 3 0 2 ( 化合物コード ) + TX、 - シペルメトリン( 2 0 5 ) + TX、ゼタメトリン( z et a m e t h r i n ) ( 代替名 ) + TX、リン化亜鉛( 6 4 0 ) + TX、ゾラプロホス( 1 4 6 9 ) および ZX I 8 9 0 1 ( 開発コード )( 8 5 8 ) + TX、シアントラニリプロール[ 7 3 6 9 9 4 - 6 3 - 1 9 + TX、クロラントラニリプロール[ 5 0 0 0 0 8 - 4 5 - 7 ] + TX、シエノピラフェン[ 5 6 0 1 2 1 - 5 2 - 0 ] + TX、シフルメトフェン[ 4 0 0 8 8 2 - 0 7 - 7 ] + TX、ピリフルキナゾン[ 3 3 7 4 5 10 8 - 2 7 - 2 ] + TX、スピネトラム[ 1 8 7 1 6 6 - 4 0 - 1 + 1 8 7 1 6 6 - 1 5 - 0 ] + TX、スピロテトラマト[ 2 0 3 3 1 3 - 2 5 - 1 ] + TX、スルホキサフロール[ 9 4 6 5 7 8 - 0 0 - 3 ] + TX、フルフィプロール[ 7 0 4 8 8 6 - 1 8 - 0 ] + TX、メペルフルトルリン[ 9 1 5 2 8 8 - 1 3 - 0 ] + TX、テトラメチルフルトルリン[ 8 4 9 3 7 - 8 8 - 2 ] + TX、トリフルメゾピリム( 国際公開第 2 0 1 2 / 0 9 2 1 1 5 号パンフレットに開示される ) + TX からなる物質の群から選択される殺虫剤、

ビス( トリブチルスズ ) オキシド( IUPAC名 )( 9 1 3 ) + TX、プロモアセトアミド[ C C N ] + TX、ヒ酸カルシウム[ C C N ] + TX、クロエトカルブ( 9 9 9 ) + TX、アセト亜ヒ酸銅[ C C N ] + TX、硫酸銅( 1 7 2 ) + TX、フェンチン( 3 4 7 ) + TX、リン酸第二鉄( IUPAC名 )( 3 5 2 ) + TX、メタアルデヒド( 5 1 8 ) + TX、メチオカルブ( 5 3 0 ) + TX、ニクロサミド( 5 7 6 ) + TX、ニクロサミド - オールアミン( 5 7 6 ) + TX、ペンタクロロフェノール( 6 2 3 ) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド( 6 2 3 ) + TX、タジムカルブ( 1 4 1 2 ) + TX、チオジカルブ( 7 9 9 ) + TX、酸化トリブチルスズ( 9 1 3 ) + TX、トリフェンモルフ( 1 4 5 4 ) + TX、トリメタカルブ( 8 4 0 ) + TX、酢酸トリフェニルスズ( IUPAC名 )( 3 4 7 ) および水酸化トリフェニルスズ( IUPAC名 )( 3 4 7 ) + TX、ピリプロール[ 3 9 4 7 3 0 - 7 1 - 3 ] + TX からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、

AKD - 3 0 8 8 ( 化合物コード ) + TX、1 , 2 - ジブロモ - 3 - クロロプロパン( IUPAC / ケミカルアブストラクト名 )( 1 0 4 5 ) + TX、1 , 2 - ジクロロプロパン( IUPAC / ケミカルアブストラクト名 )( 1 0 6 2 ) + TX、1 , 2 - ジクロロブロパンおよび1 , 3 - ジクロロプロペン( IUPAC名 )( 1 0 6 3 ) + TX、1 , 3 - ジクロロプロペン( 2 3 3 ) + TX、3 , 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン1 , 1 - ジオキシド( IUPAC / ケミカルアブストラクト名 )( 1 0 6 5 ) + TX、3 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - メチルローダニン( IUPAC名 )( 9 8 0 ) + TX、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1 , 3 , 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸( IUPAC名 )( 1 2 8 6 ) + TX、6 - イソペンテニルアミノブリン( 代替名 )( 2 1 0 ) + TX、アバメクチン( 1 ) + TX、アセトプロール[ C C N ] + TX、アラニカルブ( 1 5 ) + TX、アルジカルブ( 1 6 ) + TX、アルドキシカルブ( 8 6 3 ) + TX、AZ 6 0 5 4 1 ( 化合物コード ) + TX、ベンクロチアズ[ C C N ] + TX、ベノミル( 6 2 ) + TX、ブチルピリダベン( 代替名 ) + TX、カズサホス( 1 0 9 ) + TX、カルボフラン( 1 1 8 ) + TX、二硫化炭素( 9 4 5 ) + TX、カルボスルファン( 1 1 9 ) + TX、クロロピクリン( 1 4 1 ) + TX、クロルピリホス( 1 4 5 ) + TX、クロエトカルブ( 9 9 9 ) + TX、サイトカイニン( 代替名 )( 2 1 0 ) + TX、ダゾメット( 2 1 6 ) + TX、DBCP( 1 0 4 5 ) + TX、DCIP( 2 1 8 ) + TX、ジアミダホス( 1 0 4 4 ) + TX、ジクロフェンチオン( 1 0 5 1 ) + TX、ジクリホス( 代替名 ) + TX、ジメトエート( 2 6 2 ) + TX、ドラメクチン( 代替名 )[ C C N ] + TX、エマメクチン( 2 9 1 ) + TX、エマメクチン安息香酸塩( 2 9 1 ) + TX、エブリノメクチン( 代替名 )[ C C N ] + TX、エトプロホス( 3 1 2 ) + TX、二臭化工チレン( 3 1 6 ) + TX、フェナミホス( 3 2 6 ) + TX、フェンピラド( 代替名 ) + TX、フェンスルホチオン( 1 1 5 50 ) + TX、フェンスルホチオン( 1 1 5 )

8 ) + TX、ホスチアゼート(408) + TX、ホスチエタン(1196) + TX、フルフラール(代替名)[CCN] + TX、GY-81(開発コード)(423) + TX、ヘテロホス[CCN] + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、イサミドホス(1230) + TX、イサゾホス(1231) + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、キネチン(代替名)(210) + TX、メカルフォン(1258) + TX、メタム(519) + TX、メタム-カリウム(代替名)(519) + TX、メタム-ナトリウム(519) + TX、臭化メチル(537) + TX、メチルイソチオシアネット(543) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、クワ暗斑病菌(*Myrothecium verrucaria*)組成物(代替名)(565) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、オキサミル(602) + TX、ホレート(636) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホスホカルブ[CCN] + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、スピノサド(737) + TX、テルバム(代替名) + TX、テルブホス(773) + TX、テトラクロロチオフェン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1422) + TX、チアフェノックス(代替名) + TX、チオナジン(1434) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、キシレノール[CCN] + TX、YI-5302(化合物コード)およびゼアチン(代替名)(210) + TX、フルエンスルホン[318290-98-1] + TXからなる物質の群から選択される殺線虫剤。 10

エチルキサントゲン酸カリウム[CCN]およびニトラピリン(580) + TXからなる物質の群から選択される硝化阻害剤。 20

アシベンゾラル(6) + TX、アシベンゾラル-S-メチル(6) + TX、プロベナゾール(658)およびオオイタドリ(*Reynoutria sachalinensis*)抽出物(代替名)(720) + TXからなる物質の群から選択される植物活性化剤、  
 2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名)(1246) + TX、4-  
 -(キノキサリン-2-イルアミノ)ベンゼンスルホンアミド(IUPAC名)(748)  
 ) + TX、-クロロヒドリン[CCN] + TX、リン化アルミニウム(640) + TX  
 、アンチュ(aantu)(880) + TX、三酸化ニヒ素(882) + TX、炭酸バリウム(891) + TX、ビスチオセミ(912) + TX、ブロディファコウム(89) + TX  
 、ブロマジオロン(91) + TX、ブロメタリン(92) + TX、シアノ化カルシウム(444) + TX、クロラロース(127) + TX、クロロファシン(140) + TX  
 、コレカルシフェロール(代替名)(850) + TX、クマクロール(1004) + TX  
 、クマフリル(1005) + TX、クマテトラリル(175) + TX、クリミジン(1009) + TX、ジフェナコウム(246) + TX、ジフェチアロン(249) + TX、ジ  
 ファシノン(273) + TX、エルゴカルシフェロール(301) + TX、フロクマフェン(357) + TX、フルオロアセトアミド(379) + TX、フルプロパダイン(1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩(1183) + TX、-HCH(430) + TX  
 、HCH(430) + TX、シアノ化水素(444) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、リンダン(430) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、臭化メチル(537) + TX、ノルボルミド(1318) + TX  
 、ホサセチム(1336) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、リン[CCN] + TX、ピンドン(1341) + TX、亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、ピ  
 リヌロン(1371) + TX、シリロシド(1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアノ化ナトリウム(444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735)  
 + TX、ストリキニーネ(745) + TX、硫酸タリウム[CCN] + TX、ワルファリ  
 ン(851)およびリン化亜鉛(640) + TXからなる物質の群から選択される殺鼠剤  
 、  
 2-(2-ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート(IUPAC名)(934) + TX  
 、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシリシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903) + TX、ファルネソールおよびネロリドール(代替名 50

) ( 3 2 4 ) + TX、MB - 5 9 9 (開発コード) ( 4 9 8 ) + TX、MGK 2 6 4 (開発コード) ( 2 9 6 ) + TX、ピペロニルブトキシド ( 6 4 9 ) + TX、ピプロタール ( 1 3 4 3 ) + TX、プロピル異性体 ( 1 3 5 8 ) + TX、S 4 2 1 (開発コード) ( 7 2 4 ) + TX、セサメクス ( 1 3 9 3 ) + TX、セサモリン ( 1 3 9 4 ) およびスルホキシド ( 1 4 0 6 ) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、

アントラキノン ( 3 2 ) + TX、クロラロース ( 1 2 7 ) + TX、ナフテン酸銅 [ C C N ] + TX、オキシ塩化銅 ( 1 7 1 ) + TX、ジアジノン ( 2 2 7 ) + TX、ジシクロペニタジエン ( 化学名 ) ( 1 0 6 9 ) + TX、グアザチン ( 4 2 2 ) + TX、酢酸グアザチン ( 4 2 2 ) + TX、メチオカルブ ( 5 3 0 ) + TX、ピリジン - 4 - アミン ( I U P A C 名 ) ( 2 3 ) + TX、チラム ( 8 0 4 ) + TX、トリメタカルブ ( 8 4 0 ) + TX、ナフテン酸亜鉛 [ C C N ] およびジラム ( 8 5 6 ) + TX からなる物質の群から選択される動物忌避剤、  
10

イマニン (代替名) [ C C N ] およびリバビリン (代替名) [ C C N ] + TX からなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、

酸化第二水銀 ( 5 1 2 ) + TX、オクチリノン ( 5 9 0 ) およびチオファネート - メチル ( 8 0 2 ) + TX からなる物質の群から選択される傷保護剤、

ならびにアザコナゾール ( 6 0 2 0 7 - 3 1 - 0 ) + TX、ビテルタノール [ 7 0 5 8 5 - 3 6 - 3 ] + TX、ブロムコナゾール [ 1 1 6 2 5 5 - 4 8 - 2 ] + TX、シプロコナゾール [ 9 4 3 6 1 - 0 6 - 5 ] + TX、ジフェノコナゾール [ 1 1 9 4 4 6 - 6 8 - 3 ] + TX、ジニコナゾール [ 8 3 6 5 7 - 2 4 - 3 ] + TX、エポキシコナゾール [ 1 0 6 3 2 5 - 0 8 - 0 ] + TX、フェンブコナゾール [ 1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6 ] + TX、フルキンコナゾール [ 1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5 ] + TX、フルシラゾール [ 8 5 5 0 9 - 1 9 - 9 ] + TX、フルトリニアホール [ 7 6 6 7 4 - 2 1 - 0 ] + TX、ヘキサコナゾール [ 7 9 9 8 3 - 7 1 - 4 ] + TX、イマザリル [ 3 5 5 5 4 - 4 4 - 0 ] + TX、イミベンコナゾール [ 8 6 5 9 8 - 9 2 - 7 ] + TX、イブコナゾール [ 1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7 ] + TX、メトコナゾール [ 1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6 ] + TX、ミクロブタニル [ 8 8 6 7 1 - 8 9 - 0 ] + TX、ペフラゾエート [ 1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4 ] + TX、ペンコナゾール [ 6 6 2 4 6 - 8 8 - 6 ] + TX、プロチオコナゾール [ 1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6 ] + TX、ピリフェノックス [ 8 8 2 8 3 - 4 1 - 4 ] + TX、プロクロラズ [ 6 7 7 4 7 - 0 9 - 5 ] + TX、プロピコナゾール [ 6 0 2 0 7 - 9 0 - 1 ] + TX、シメコナゾール [ 1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7 ] + TX、テブコナゾール [ 1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3 ] + TX、テトラコナゾール [ 1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3 ] + TX、トリアジメホン [ 4 3 1 2 1 - 4 3 - 3 ] + TX、トリアジメノール [ 5 5 2 1 9 - 6 5 - 3 ] + TX、トリフルミゾール [ 9 9 3 8 7 - 8 9 - 0 ] + TX、トリチコナゾール [ 1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7 ] + TX、アンシミドール [ 1 2 7 7 1 - 6 8 - 5 ] + TX、フェナリモル [ 6 0 1 6 8 - 8 8 - 9 ] + TX、ヌアリモル [ 6 3 2 8 4 - 7 1 - 9 ] + TX、ブピリメート [ 4 1 4 8 3 - 4 3 - 6 ] + TX、ジメチリモール [ 5 2 2 1 - 5 3 - 4 ] + TX、エチリモル [ 2 3 9 4 7 - 6 0 - 6 ] + TX、ドデモルフ [ 1 5 9 3 - 7 7 - 7 ] + TX、フェンプロピジン [ 6 7 3 0 6 - 0 0 - 7 ] + TX、フェンプロピモルフ [ 6 7 5 6 4 - 9 1 - 4 ] + TX、スピロキサミン [ 1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8 ] + TX、トリデモルフ [ 8 1 4 1 2 - 4 3 - 3 ] + TX、シプロジニル [ 1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2 ] + TX、メパニビルム [ 1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7 ] + TX、ピリメタニル [ 5 3 1 1 2 - 2 8 - 0 ] + TX、フェンピクロニル [ 7 4 7 3 8 - 1 7 - 3 ] + TX、フルジオキソニル [ 1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1 ] + TX、ベナラキシル [ 7 1 6 2 6 - 1 1 - 4 ] + TX、フララキシル [ 5 7 6 4 6 - 3 0 - 7 ] + TX、メタラキシル [ 5 7 8 3 7 - 1 9 - 1 ] + TX、R - メタラキシル [ 7 0 6 3 0 - 1 7 - 0 ] + TX、オフレース [ 5 8 8 1 0 - 4 8 - 3 ] + TX、オキサジキシル [ 7 7 7 3 2 - 0 9 - 3 ] + TX、ベノミル [ 1 7 8 0 4 - 3 5 - 2 ] + TX、カルベンダジム [ 1 0 6 0 5 - 2 1 - 7 ] + TX、デバカルブ [ 6 2 7 3 2 - 9 1 - 6 ] + TX、フベリダゾール [ 3 8 7 8 - 1 9 - 1 ] + TX、チアベンダゾール [ 1 4 8 - 7 9 - 8 ] + TX、クロゾリネット [ 8 4 3 3 2 - 8 6 - 5 ] + TX、ジクロゾリ  
20  
30  
40  
50

ン [ 2 4 2 0 1 - 5 8 - 9 ] + TX、イブロジオン [ 3 6 7 3 4 - 1 9 - 7 ] + TX、マイクロゾリン [ 5 4 8 6 4 - 6 1 - 8 ] + TX、プロシミドン [ 3 2 8 0 9 - 1 6 - 8 ] + TX、ピンクロゾリン [ 5 0 4 7 1 - 4 4 - 8 ] + TX、ボスカリド [ 1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6 ] + TX、カルボキシン [ 5 2 3 4 - 6 8 - 4 ] + TX、フェンフラム [ 2 4 6 9 1 - 8 0 - 3 ] + TX、フルトラニル [ 6 6 3 3 2 - 9 6 - 5 ] + TX、メプロニル [ 5 5 8 1 4 - 4 1 - 0 ] + TX、オキシカルボキシン [ 5 2 5 9 - 8 8 - 1 ] + TX、ペンチオピラド [ 1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3 ] + TX、チフルザミド [ 1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7 ] + TX、グアザチン [ 1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6 ] + TX、ドジン [ 2 4 3 9 - 1 0 - 3 ] [ 1 1 2 - 6 5 - 2 ] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [ 1 3 5 1 6 - 2 7 - 3 ] + TX、アゾキシストロビン [ 1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8 ] + TX、ジモキシストロビン [ 1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4 ] + TX、エヌステロブリン { Proc. B C P C , Int. Congr. , Glasgow , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + TX、フルオキサストロビン [ 3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9 ] + TX、クレソキシム - メチル [ 1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0 ] + TX、メトミノストロビン [ 1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1 ] + TX、トリフロキシストロビン [ 1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7 ] + TX、オリザストロビン [ 2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0 ] + TX、ピコキシストロビン [ 1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5 ] + TX、ピラクロストロビン [ 1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0 ] + TX、フェルバム [ 1 4 4 8 4 - 6 4 - 1 ] + TX、マンコゼブ [ 8 0 1 8 - 0 1 - 7 ] + TX、マネブ [ 1 2 4 2 7 - 3 8 - 2 ] + TX、メチラム [ 9 0 0 6 - 4 2 - 2 ] + TX、プロピネブ [ 1 2 0 7 1 - 8 3 - 9 ] + TX、チラム [ 1 3 7 - 2 6 - 8 ] + TX、ジネブ [ 1 2 1 2 2 - 6 7 - 7 ] + TX、ジラム [ 1 3 7 - 3 0 - 4 ] + TX、カプタホール [ 2 4 2 5 - 0 6 - 1 ] + TX、カプタン [ 1 3 3 - 0 6 - 2 ] + TX、ジクロフルアニド [ 1 0 8 5 - 9 8 - 9 ] + TX、フルオロイミド [ 4 1 2 0 5 - 2 1 - 4 ] + TX、ホルペット [ 1 3 3 - 0 7 - 3 ] + TX、トリルフルアニド [ 7 3 1 - 2 7 - 1 ] + TX、ボルドー液 [ 8 0 1 1 - 6 3 - 0 ] + TX、水酸化銅 [ 2 0 4 2 7 - 5 9 - 2 ] + TX、オキシ塩化銅 [ 1 3 3 2 - 4 0 - 7 ] + TX、硫酸銅 [ 7 7 5 8 - 9 8 - 7 ] + TX、酸化銅 [ 1 3 1 7 - 3 9 - 1 ] + TX、マンコッパー (man copper) [ 5 3 9 8 8 - 9 3 - 5 ] + TX、オキシン銅 [ 1 0 3 8 0 - 2 8 - 6 ] + TX、ジノカップ [ 1 3 1 - 7 2 - 6 ] + TX、ニトロタール - イソプロピル [ 1 0 5 5 2 - 7 4 - 6 ] + TX、エディフェンホス [ 1 7 1 0 9 - 4 9 - 8 ] + TX、イプロベンホス [ 2 6 0 8 7 - 4 7 - 8 ] + TX、イソプロチオラン [ 5 0 5 1 2 - 3 5 - 1 ] + TX、ホスジフェン [ 3 6 5 1 9 - 0 0 - 3 ] + TX、ピラゾホス [ 1 3 4 5 7 - 1 8 - 6 ] + TX、トルクロホス - メチル [ 5 7 0 1 8 - 0 4 - 9 ] + TX、アシベンゾラル - S - メチル [ 1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2 ] + TX、アニラジン [ 1 0 1 - 0 5 - 3 ] + TX、ベンチアバリカルブ [ 4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7 ] + TX、ブラストサイジン - S [ 2 0 7 9 - 0 0 - 7 ] + TX、キノメチオナト [ 2 4 3 9 - 0 1 - 2 ] + TX、クロロネブ [ 2 6 7 5 - 7 7 - 6 ] + TX、クロロタロニル [ 1 8 9 7 - 4 5 - 6 ] + TX、シフルフエナミド [ 1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3 ] + TX、シモキサニル [ 5 7 9 6 6 - 9 5 - 7 ] + TX、ジクロロン [ 1 1 7 - 8 0 - 6 ] + TX、ジクロシメット [ 1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4 ] + TX、ジクロメジン [ 6 2 8 6 5 - 3 6 - 5 ] + TX、ジクロラン [ 9 9 - 3 0 - 9 ] + TX、ジエトフェンカルブ [ 8 7 1 3 0 - 2 0 - 9 ] + TX、ジメトモルフ [ 1 1 0 4 8 8 - 7 0 - 5 ] + TX、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [ 2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9 ] + TX、ジチアノン [ 3 3 4 7 - 2 2 - 6 ] + TX、エタボキサム [ 1 6 2 6 5 0 - 7 7 - 3 ] + TX、エトリジアゾール [ 2 5 9 3 - 1 5 - 9 ] + TX、ファモキサドン [ 1 3 1 8 0 7 - 5 7 - 3 ] + TX、フェナミドン [ 1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7 ] + TX、フェノキサニル [ 1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7 ] + TX、フェンチン [ 6 6 8 - 3 4 - 8 ] + TX、フェリムゾン [ 8 9 2 6 9 - 6 4 - 7 ] + TX、フルアジナム [ 7 9 6 2 2 - 5 9 - 6 ] + TX、フルオピコリド [ 2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7 ] + TX、フルスルファミド [ 1 0 6 9 1 7 - 5 2 - 6 ] + TX、フェンヘキサミド [ 1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8 ] + TX、ホセチル - アルミニウム [ 3 9 1 4 8 - 2 4 - 8 ] + TX、ヒメキサゾール [ 1 0 0 0 4 - 4 4 - 1 ] + TX、イプロバリカルブ [ 1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7 ] + TX、I K F - 9 1 50

6 (シアゾファミド) [ 1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3 ] + TX、カスガマイシン [ 6 9 8 0 - 1 8 - 3 ] + TX、メタスルホカルブ [ 6 6 9 5 2 - 4 9 - 6 ] + TX、メトラフェノン [ 2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6 ] + TX、ペンシクロン [ 6 6 0 6 3 - 0 5 - 6 ] + TX、フタリド [ 2 7 3 5 5 - 2 2 - 2 ] + TX、ポリオキシン [ 1 1 1 1 3 - 8 0 - 7 ] + TX、プロベナゾール [ 2 7 6 0 5 - 7 6 - 1 ] + TX、プロパモカルブ [ 2 5 6 0 6 - 4 1 - 1 ] + TX、プロキンアジド [ 1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4 ] + TX、ピロキロン [ 5 7 3 6 9 - 3 2 - 1 ] + TX、キノキシフエン [ 1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7 ] + TX、キントゼン [ 8 2 - 6 8 - 8 ] + TX、硫黄 [ 7 7 0 4 - 3 4 - 9 ] + TX、チアジニル [ 2 2 3 5 8 0 - 5 1 - 6 ] + TX、トリアゾキシド [ 7 2 4 5 9 - 5 8 - 6 ] + TX、トリシクラゾール [ 4 1 8 1 4 - 7 8 - 2 ] + TX、トリホリン [ 2 6 6 4 4 - 4 6 - 2 ] + TX 10  
、バリダマイシン [ 3 7 2 4 8 - 4 7 - 8 ] + TX、ゾキサミド (RH7281) [ 1 5 6 0 5 2 - 6 8 - 5 ] + TX、マンジプロパミド [ 3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2 ] + TX、イソピラザム [ 8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1 ] + TX、セダキサン [ 8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6 ] + TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (9-ジクロロメチレン-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノ-ナフタレン-5-イル)-アミド (国際公開第2007/048556号パンフレットに開示される) + TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (3', 4', 5' - トリフルオロ-ビフェニル-2-イル)-アミド (国際公開第2006/087343号パンフレットに開示される) + TX、[(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル)オキシ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ-6, 12-ジヒドロキシ-4, 6a, 12b - トリメチル-11-オキソ-9-(3-ピリジニル) - 2H, 11Hナフト[2, 1-b]ピラノ[3, 4-e]ピラン-4-イル]メチル-シクロプロパンカルボキシレート [915972-17-7] + TX および 1, 3, 5-トリメチル-N-(2-メチル-1-オキソプロピル)-N-[3-(2-メチルプロピル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-メトキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド [926914-55-8] + TX からなる物質の群から選択される生物学的に活性な化合物、および 20

以下のものを含む微生物 (microbials) : アシネットバクター・ルオフィイ (Acinetobacter lwoffii) + TX、アクレモニウム・アルタナツム (Acremonium alternatum) + TX + TX、アクレモニウム・セファロスporium (Acremonium cephalosporium) + TX + TX、アクレモニウム・ディオスピリ (Acremonium diospyri) + TX、アクレモニウム・オブクラバツム (Acremonium obclavatum) + TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス (Adoxophyes orana granulovirus) (AdoxGV) (Capex (登録商標)) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobacter) 菌株 K84 (Galltrol-A (登録商標)) + TX、アルテルナリア・アルテルナータ (Alternaria alternate) + TX、アルテルナリア・カシアエ (Alternaria cassia) + TX、アルテルナリア・デストルエンス (Alternaria destruens) (Smolder (登録商標)) + TX、アンペロマイセス・キスカリス (Ampelomyces quisqualis) (AQ10 (登録商標)) + TX、アスペルギルス・フラブス (Aspergillus flavus) AF36 (AF36 (登録商標)) + TX、アスペルギルス・フラブス (Aspergillus flavus) NRR L 21882 (Aflaguard (登録商標)) + TX、アスペルギルス属 (Aspergillus spp.) + TX、アウレオバシジウム・プルランス (Aureobasidium pullulans) + TX、アゾスピリルム属 (Azospirillum) + TX、(MicroAZ (登録商標)) + TX、TAZO B (登録商標)) + TX、アゾトバクター属 (Azotobacter) + TX、アゾトバクター・クロオコッカム (Azotobacter chro 30  
40  
40  
50

o c u c c u m ) ( A z o t o m e a l ( 登録商標 ) ) + TX、アゾトバクター ( Azo  
 t o b a c t e r ) シスト ( cyst ) ( B i o n a t u r a l B l o o m i n g B  
 l o s s o m s ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・アミロリケファシエンス ( B a c i l  
 l u s a m y l o l i q u e f a c i e n s ) + TX、セレウス菌 ( B a c i l l u s  
 c e r e u s ) + TX、バチルス・キチノスポルス ( B a c i l l u s c h i t i n  
 o s p o r u s ) 菌株 C M - 1 + TX、バチルス・キチノスポルス ( B a c i l l u s  
 c h i t i n o s p o r u s ) 菌株 A Q 7 4 6 + TX、バチルス・リケニフォルミス ( B  
 a c i l l u s l i c h e n i f o r m i s ) 菌株 H B - 2 ( B i o s t a r t ( 商標 )  
 ) R h i z o b o o s t ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・リケニフォルミス ( B a c i  
 l l u s l i c h e n i f o r m i s ) 菌株 3 0 8 6 ( E c o G u a r d ( 登録商標 )  
 ) + TX、G r e e n R e l e a f ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・サーキュランス ( 10  
 B a c i l l u s c i r c u l a n s ) + TX、バチルス・フィルムス ( B a c i l l u s  
 f i r m u s ) ( B i o S a f e ( 登録商標 ) ) 、B i o N e m - W P ( 登録商標 )  
 、V O T i V O ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・フィルムス ( B a c i l l u s f i  
 r m u s ) 菌株 I - 1 5 8 2 + TX、バチルス・マセランス ( B a c i l l u s m a c  
 e r a n s ) + TX、バチルス・マリスモルトウイ ( B a c i l l u s m a r i s m o  
 r t u i ) + TX、バチルス・メガテリウム ( B a c i l l u s m e g a t e r i u m  
 ) + TX、バチルス・ミコイデス ( B a c i l l u s m y c o i d e s ) 菌株 A Q 7 2  
 6 + TX、バチルス・ポピリエ ( B a c i l l u s p a p i l l a e ) ( M i l k y  
 S p o r e P o w d e r ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・ブミルス種 ( B a c i l l u s  
 p u m i l u s s p p . ) + TX、バチルス・ブミルス ( B a c i l l u s p u  
 m i l u s ) 菌株 G B 3 4 ( Y i e l d S h i e l d ( 登録商標 ) ) + TX、バチ  
 ルス・ブミルス ( B a c i l l u s p u m i l u s ) 菌株 A Q 7 1 7 + TX、バチルス  
 20 ブミルス ( B a c i l l u s p u m i l u s ) 菌株 Q S T 2 8 0 8 ( S o n a t a ( 登録商標 )  
 ) + TX、B a l l a d P l u s ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・スフェリ  
 カス ( B a c i l l u s s p a h e r i c u s ) ( V e c t o L e x ( 登録商標 ) ) +  
 TX、バチルス属 ( B a c i l l u s s p p . ) + TX、バチルス属 ( B a c i l l u s  
 s p p . ) 菌株 A Q 1 7 5 + TX、バチルス属 ( B a c i l l u s s p p . ) 菌株  
 A Q 1 7 7 + TX、バチルス属 ( B a c i l l u s s p p . ) 菌株 A Q 1 7 8 + TX、  
 枯草菌 ( B a c i l l u s s u b t i l i s ) 菌株 Q S T 7 1 3 ( C E A S E ( 登録  
 商標 ) + TX、S e r e n a d e ( 登録商標 ) + TX、R h a p s o d y ( 登録商標 ) )  
 + TX、枯草菌 ( B a c i l l u s s u b t i l i s ) 菌株 Q S T 7 1 4 ( J A Z Z  
 ( 登録商標 ) ) + TX、枯草菌 ( B a c i l l u s s u b t i l i s ) 菌株 A Q 1 5 3  
 + TX、枯草菌 ( B a c i l l u s s u b t i l i s ) 菌株 A Q 7 4 3 + TX、枯草菌  
 ( B a c i l l u s s u b t i l i s ) 菌株 Q S T 3 0 0 2 + TX、枯草菌 ( B a c i  
 l l u s s u b t i l i s ) 菌株 Q S T 3 0 0 4 + TX、枯草菌变种アミロリケファシ  
 エンス ( B a c i l l u s s u b t i l i s v a r . a m y l o l i q u e f a c i  
 e n s ) 菌株 F Z B 2 4 ( T a e g r o ( 登録商標 ) + TX、R h i z o p r o ( 登録商  
 標 ) ) + TX、バチルス・チューリングンシス ( B a c i l l u s t h u r i n g i e  
 n s i s ) C r y 2 A e + TX、バチルス・チューリングンシス ( B a c i l l u s  
 t h u r i n g i e n s i s ) C r y 1 A b + TX、バチルス・チューリングンシス・ア  
 イザワイ ( B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s a i z a w a i ) G C 9  
 1 ( A g r e e ( 登録商標 ) ) + TX、バチルス・チューリングンシス・イスラエルシ  
 斯 ( B a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s i s r a e l e n s i s ) ( B M  
 P 1 2 3 ( 登録商標 ) + TX、A q u a b a c ( 登録商標 ) + TX、V e c t o B a c (  
 登録商標 ) ) + TX、バチルス・チューリングンシス・クルスターイ ( B a c i l l u s  
 30 t h u r i n g i e n s i s k u r s t a k i ) ( J a v e l i n ( 登録商標 ) + T  
 X、D e l i v e r ( 登録商標 ) + TX、C r y M a x ( 登録商標 ) + TX、B o n i d  
 e ( 登録商標 ) + TX、S c u t e l l a W P ( 登録商標 ) + TX、T u r i l a v  
 W P ( 登録商標 ) + TX、A s t u t o ( 登録商標 ) + TX、D i p e l W P ( 登録商  
 40

標) + TX、Biobit(登録商標) + TX、Foray(登録商標)) + TX、バチルス・チューリングエンシス・クルスターーキ(*Bacillus thuringiensis kurstaki*)BMP 123(*Baritone*(登録商標)) + TX、バチルス・チューリングエンシス・クルスターーキ(*Bacillus thuringiensis kurstaki*)HD-1(*Bioprotec-CAF/3P*(登録商標)) + TX、バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)菌株BD#32 + TX、バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)菌株AQ52 + TX、バチルス・チューリングエンシス変種アイザワイ(*Bacillus thuringiensis var. aizawai*) (*XenTari*(登録商標) + TX、Dipel(登録商標)) + TX、細菌種(*bacteria spp.*) (*GROWMEND*(登録商標) + TX、*GROWSWEET*(登録商標) + TX、*Shootup*(登録商標)) + TX、クラビバクター・ミシガネンシス(*Clavipacter michiganensis*)のバクテリオファージ(*Agriphage*(登録商標)) + TX、*Bakflor*(登録商標) + TX、白きょう病菌(*Beauveria bassiana*) (*Beaugenic*(登録商標) + TX、*Brocaril WP*(登録商標)) + TX、白きょう病菌(*Beauveria bassiana*)GHA(*Mycotrol ES*(登録商標) + TX、*Mycotrol O*(登録商標) + TX、*BotaniGuard*(登録商標)) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ(*Beauveria brongniartii*) (*Engerlingspilz*(登録商標) + TX、*Schweizer Beauveria*(登録商標) + TX、*Melocont*(登録商標)) + TX、ビューベリア属(*Beauveria spp.*) + TX、灰色かび病菌(*Botrytis cinerea*) + TX、プラディリゾビウム・ジャボニクム(*Bradyrhizobium japonicum*) (*TerraMax*(登録商標)) + TX、プレビバチルス・プレビス(*Brevibacillus brevis*) + TX、バチルス・チューリングエンシス・テネブリオニス(*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) (*Novodor*(登録商標)) + TX、*Bt Booster* + TX、バークホルデリア・セパシア(*Burkholderia cepacia*) (*Deny*(登録商標) + TX、*Intercept*(登録商標) + TX、*Blue Circle*(登録商標)) + TX、バークホルデリア・グラディ(*Burkholderia gladii*) + TX、バークホルデリア・グラディオリ(*Burkholderia gladiooli*) + TX、バークホルデリア属(*Burkholderia spp.*) + TX、セイヨウトゲアザミの菌(*Canadian thistle fungus*) (*CBH Canadian Bioherbicide*(登録商標)) + TX、カンジダ・ブチリ(*Candida butyri*) + TX、カンジダ・ファマータ(*Candida famata*) + TX、カンジダ・フルクタス(*Candida fructus*) + TX、カンジダ・グラブラタ(*Candida glabrata*) + TX、カンジダ・ギリエルモンディ(*Candida guilliermondii*) + TX、カンジダ・メリビオシカ(*Candida melibiosica*) + TX、カンジダ・オレオフィラ(*Candida oleophila*)菌株O + TX、カンジダ・バラブシロシス(*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダ・ペリキュローザ(*Candida pelluculosa*) + TX、カンジダ・プルケリマ(*Candida pulcherrima*) + TX、カンジダ・レウカウフィ(*Candida reukaufii*) + TX、カンジダ・サイトアナ(*Candida saitoana*) (*Bio-Coat*(登録商標) + TX、*Biocure*(登録商標)) + TX、カンジダ・サケ(*Candida sake*) + TX、カンジダ属(*Candida spp.*) + TX、カンジダ・テヌイス(*Candida tenius*) + TX、セデセア・ダビセ(*Cedecea dravissae*) + TX、セルロモナス・フラビゲナ(*Celullomonas flavigena*) + TX、カエトミウム・コクリオイデス(*Chaeatomium cochlioides*) (*Nova-Cide*(登録商標)) + TX 10  
20  
30  
40  
50

、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) (*Nova-Cide* (登録商標)) + TX、クロモバクテリウム・スブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株 PRAA4-1T (*Grandevol* (登録商標)) + TX、クラドスボリウム・クラドスボリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) + TX、クラドスボリウム・オキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*) + TX、クラドスボリウム・クロロセファルム

(*Cladosporium chlorocephalum*) + TX、クラドスボリウム属 (*Cladosporium spp.*) + TX、クラドスボリウム・テヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) + TX、クロノスタキス・ロゼア (*Clonostachys rosea*) (*EndoFine* (登録商標)) + TX、コレトトリクム・アクタータム (*Colletotrichum acutatum*) + TX、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*) (*Cotans WG* (登録商標)) + TX、コニオチリウム属 (*Coniothyrium spp.*) + TX、クリプトコッカス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*) (*YIELDPLUS* (登録商標)) + TX、クリプトコッカス・フミコラ (*Cryptococcus humicola*) + TX、クリプトコッカス・インフィルモ-ミニアツス (*Cryptococcus infirmo-miniatius*) + TX、クリプトコッカス・ローレンティ (*Cryptococcus laurenii*) + TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (*Cryptex* (登録商標)) + TX、カプリアビダス・カンピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) + TX、コドリンガ顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (*CYD-X* (登録商標)) + TX、コドリンガ顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (*Madex* (登録商標)) + TX、*Madex Plus* (登録商標) + TX、*Madex Max/Carpovirusine* (登録商標) + TX、エビコウヤクタケ (*Cylindrobasidium laeve*) (*Stumpout* (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (*Cylindrocladium*) + TX、デバリオマイセス・ハンセンイ (*Debaryomyces hansenii*) + TX、ドレクスレラ・ハワイエンシス (*Drechslera hawaiiensis*) + TX、エンテロバクター・クロアカ (*Enterobacter cloacae*) + TX、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*) + TX、エントモフトラ・ビルレンタ (*Entomopathora virulenta*) (*Vektor* (登録商標)) + TX、エピコッカム・ニグラム (*Epicoccum nigrum*) + TX、エピコッカム・パーパラセンス (*Epicoccum purpurascens*) + TX、エピコッカム属 (*Epicoccum spp.*) + TX、フィロバシディウム・フロリフォルメ (*Filobasidium floriforme*) + TX、フザリウム・アクミナツム (*Fusarium acuminatum*) + TX、フザリウム・クラミドスボルム (*Fusarium chlamydosporum*) + TX、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) (*Fusaclean* (登録商標) / *Biofox C* (登録商標)) + TX、フザリウム・プロリフェラツム (*Fusarium proliferatum*) + TX、フザリウム属 (*Fusarium spp.*) + TX、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (*Galactomyces geotrichum*) + TX、グリオクラジウム・カヌラツム (*Gliocladium catenulatum*) (*Primastop* (登録商標)) + TX、*Prestop* (登録商標) + TX、グリオクラジウム・ロセウム (*Gliocladium roseum*) + TX、グリオクラジウム属 (*Gliocladium spp.*) (*SoilGuard* (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) (*Soilguard* (登録商標)) + TX、顆粒病ウイルス (*Granulovirus*) (*Gr*

10

20

30

40

50

anupom(登録商標) + TX、ハロバチルス・ハロフィラス(*Halobacillus halophilus*) + TX、ハロバチルス・リトラリス(*Halobacillus litoralis*) + TX、ハロバチルス・トルウエペリ(*Halobacillus trueperi*) + TX、ハロモナス属(*Halomonas spp.*) + TX、ハロモナス・スブグラシェスコーラ(*Halomonas subglaci escola*) + TX、ハロビブリオ・バリアビリス(*Halovibrio variabilis*) + TX、ハンセニアスpora・ウバルム(*Hanseniaspora uvarum*) + TX、オオタバコガ核多角体病ウイルス(*Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus*) (*Helicovex*(登録商標)) + TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス(*Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus*) (*Gemstar*(登録商標)) + TX、イソフラボン・ホルモノネチン(*Myconate*(登録商標)) + TX、クロエケラ・アピキュラータ(*Kloeckera apiculata*) + TX、クロエケラ属(*Kloeckera spp.*) + TX、ラゲニジウム・ギガンテウム(*Lagenidium giganteum*) (*Laginex*(登録商標)) + TX、レカニシリウム・ロンギスポルム(*Lecanicillium longisporum*) (*Vertiblast*(登録商標)) + TX、レカニシリウム・ムスカリウム(*Lecanicillium muscarium*) (*Vertikil*(登録商標)) + TX、マイマイガ核多角体病ウイルス(*Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus*) (*Disparvirus*(登録商標)) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス(*Marinococcus halophilus*) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ(*Meira geulakonigi*) + TX、メタリジウム・アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae*) (*Met 52*(登録商標)) + TX、メタリジウム・アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae*) (*Destruxin WP*(登録商標)) + TX、メチニコビア・フルクチコラ(*Metschnikowia fruticola*) (*Shemer*(登録商標)) + TX、メチニコビア・ブルケリマ(*Metschnikowia pulcherrima*) + TX、ミクロドチウム・ジメルム(*Microdochium dimerum*) (*Antibot*(登録商標)) + TX、ミクロモノスpora・ケルレア(*Micromonospora coerulea*) + TX、ミクロスファエロブシス・オクラセ(*Microsphaeropsis ochracea*) + TX、ムスコドル・アルブス(*Muscodorus albus*) 620 (*Muscudor*(登録商標)) + TX、ムスコドル・ロセウス(*Muscodorus roseus*) 菌株A3-5 + TX、ミコリザエ属(*Mycorrhizae spp.*) (*AMykor*(登録商標)) + TX、Root Maximizer(登録商標)) + TX、クワ暗斑病菌(*Myrothecium verrucaria*) 菌株AARC-0255 (*DiTera*(登録商標)) + TX、BROS PLUS(登録商標) + TX、オフィオストマ・ピリフェルム(*Ophiostoma piliferum*) 菌株D97 (*Sylvanex*(登録商標)) + TX、ペシロマイセス・ファリノスス(*Paecilomyces farinosus*) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*) (PFR-97(登録商標)) + TX、PreFerAl(登録商標)) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス(*Paecilomyces linacinus*) (*Biostat WP*(登録商標)) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス(*Paecilomyces lilacinus*) 菌株251 (*MeloCon WG*(登録商標)) + TX、パエニバチルス・ポリミキサ(*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエア・アグロメランス(*Pantoea agglo merans*) (BlightBan C9-1(登録商標)) + TX、パントエア属(*Pantoea spp.*) + TX、パストーリア属(*Pasteuria spp.*) (*Econem*(登録商標)) + TX、パストーリア・ニシザワエ(*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウム・オーランティオグリセウム(*Peni 10*

20  
 30  
 40  
 50

cillium aurantiogriseum) + TX、ペニシリウム・ビライ (Penicillium billai) (Jumpstart (登録商標) + TX、Tag Team (登録商標)) + TX、ペニシリウム・ブレビコンパクツム (Penicillium brevicompactum) + TX、ペニシリウム・フレクエンタス (Penicillium frequentans) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (Penicillium griseofulvum) + TX、ペニシリウム・ブルプロゲナム (Penicillium purpurogenum) + TX、ペニシリウム属 (Penicillium spp.) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (Penicillium viridicatum) + TX、フレビオブシス・ギガンティア (Phlebiopsis gigantean) (Rotstop (登録商標)) + TX、リン酸塩溶解細菌 (Phosphomeal (登録商標)) + TX、フィトファトラ・クリプトゲア (Phytophthora cryptogea) + TX、フィトファトラ・パルミボラ (Phytophthora palmivora) (Devine (登録商標)) + TX、ピヒア・アノマラ (Pichia anomala) + TX、ピヒア・ギリエルモンディ (Pichia guillermondii) + TX、ピヒア・メンブラネファシエンス (Pichia membranaefaciens) + TX、ピヒア・オニキス (Pichia onychis) + TX、ピヒア・スチピチス (Pichia stipites) + TX、緑膿菌 (Pseudomonas aeruginosa) + TX、シュードモナス・オーレオファシエンス (Pseudomonas aureofaciens) (Spot-Less Biofungicide (登録商標)) + TX、シュードモナス・セパシア (Pseudomonas cepacia) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (Pseudomonas chlororaphis) (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナス・コルガータ (Pseudomonas corrugate) + TX、蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標)) + TX、シュードモナス・プチダ (Pseudomonas putida) + TX、シュードモナス・リアクタンス (Pseudomonas reactans) + TX、シュードモナス属 (Pseudomonas spp.) + TX、シュードモナス・シリンガエ (Pseudomonas syringae) (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナス・ビリジフラバ (Pseudomonas viridiflava) + TX、蛍光菌 (Pseudomonas fluorescens) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマ・フロクロサ (Pseudozyma flocculosa) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニア・カナリクラタ (Puccinia canaliculata) + TX、プッシニア・テラスペオス (Puccinia thlaspeos) (Wood Wa  
rrior (登録商標)) + TX、ピシウム・パレカンドルム (Pythium paraecandrum) + TX、ピシウム・オリガンドルム (Pythium oligandrum) (Polygandron (登録商標) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウム病菌 (Pythium periplocum) + TX、ラーネラ・アクアティリス (Rhanelia aquatilis) + TX、ラーネラ属 (Rhanelia spp.) + TX、リゾビウム属 (Rhizobia) (Dormaal (登録商標) + TX、Vaultt (登録商標)) + TX、リゾクトニア属 (Rhizoctonia) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (Rhodococcus glaberulus) 菌株 AQ719 + TX、ロドスピリジウム・ディオボバタム (Rhodosporidium diobovatum) + TX、ロドスピリジウム・トルロイデス (Rhodosporidium toruloides) + TX、ロドトルラ属 (Rhodotorula spp.) + TX、ロドトルラ・グルチニス (Rhodotorula glutinis) + TX、ロドトルラ・グラミニス (Rhodotorula graminis) + TX、ロドトルラ・ムチラギノーザ (Rhodotorula 10  
20  
30  
40  
50

mucilaginosa) + TX、ロドトルラ・ルブラ (*Rhodotorula rubra*) + TX、サッカロマイセス・セレビシエ (*Saccharomyces cerevisiae*) + TX、サリニコッカス・ロセウス (*Salinococcus roseus*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) (SARRITOR (登録商標)) + TX、スキタリジウム属 (*Scytalidium spp.*) + TX、スキタリジウム・ウレジニコラ (*Scytalidium uredinicola*) + TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus*) (Spod-X (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + TX、セラチア・マルセッセンス (*Serratia marcescens*) + TX、セラチア・プリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラチア属 (*Serratia spp.*) + TX、ソルダリア・フィミコーラ (*Sordaria fimicola*) + TX、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus*) (Littovir (登録商標)) + TX、スポロボロマイセス・ロセウス (*Sporobolomyces roseus*) + TX、ステノトロホモナス・マルトフィリア (*Stenotrophomonas maltophilia*) + TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス (*Streptomyces ahygroscopicus*) + TX、ストレプトマイセス・アルバドゥンカス (*Streptomyces albaduncus*) + TX、ストレプトマイセス・エクスフオリエーテス (*Streptomyces exfoliates*) + TX、ストレプトマイセス・ガルバス (*Streptomyces galbus*) + TX、ストレプトマイセス・グリセオプラヌス (*Streptomyces griseoplanus*) + TX、ストレプトマイセス・グリセオビリディス (*Streptomyces griseoviridis*) (Mycostop (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (*Streptomyces lydicus*) (Actinovate (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (*Streptomyces lydicus*) WYEC-108 (ActinoGrow (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・ビオラセウス (*Streptomyces violaceus*) + TX、チレチオブシス・ミノル (*Tilletiopsis minor*) + TX、チレチオブシス属 (*Tilletiopsis spp.*) + TX、トリコデルマ・アスペレルム (*Trichoderma asperellum*) (T34 Biocontrol (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (*Trichoderma gamsii*) (Tenet (登録商標)) + TX、トリコデルマ・アトリビリデ (*Trichoderma atroviride*) (Plantmate (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハマツム (*Trichoderma hamatum*) TH 382 + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) (Mycostar (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) T-22 (Trianum-P (登録商標)) + TX、PlantShield HC (登録商標) + TX、RootShield (登録商標) + TX、Trianum-G (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) T-39 (Trichodex (登録商標)) + TX、トリコデルマ・インハマタム (*Trichoderma inhamatum*) + TX、トリコデルマ・コニンギ (*Trichoderma koningii*) + TX、トリコデルマ属 (*Trichoderma spp.*) LC 52 (Sentinel (登録商標)) + TX、トリコデルマ・リゲノルム (*Trichoderma lignorum*) + TX、トリコデルマ・ロンギブラキアタム (*Trichoderma longibrachiatum*) + TX、トリコデルマ・ポリスボラム (*Trichoderma polysporum*) (Binab-T (登録商標)) + TX、トリコデルマ・タキシ (*Trichoderma taxi*) + TX、トリコデルマ・ビレ

10

20

30

40

50

ンス (*Trichoderma virens*) + TX、トリコデルマ・ビレンス (*Trichoderma virens*) (旧グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) GL-21) (Soil Guard (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*) + TX、トリコデルマ・ビリデ (*Trichoderma viride*) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) + TX、トリコスプロン・ブルランス (*Trichosporon pullulans*) + TX、トリコスプロン属 (*Trichosporon spp.*) + TX、トリコセシウム属 (*Trichothecium spp.*) + TX、トリコセシウム・ロセウム (*Trichothecium roseum*) + TX、アカエガマノホタケ (*Typhula phacorrhiza*) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (*Typhula phacorrhiza*) 菌株 94671 + TX、ウロクラジウム・アトラム (*Ulocladium atrum*) + TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (*Ulocladium oudemansii*) (Botry-Zen (登録商標)) + TX、トウモロコシ黒穂病菌 (*Ustilago maydis*) + TX、様々な細菌および補助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標)) + TX、バーチシリウム・クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) + TX、バーチシリウム・レカニ (*Verticillium lecanii*) (Mycoatal (登録商標)) + TX、Vertalec (登録商標)) + TX、Vip3Aa 20 (VIPter (登録商標)) + TX、ビルジバチルス・マリスモルツイ (*Virgibacillus marismortui*) + TX、キサントモナス・カムペストリス病原型ポアエ (*Xanthomonas campestris* pv. *Poae*) (Camperico (登録商標)) + TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (*Xenorhabdus bovienii*) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (*Xenorhabdus nematophilius*) ; および

以下のものを含む植物抽出物：松油 (Retenol (登録商標)) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標)) + TX、Azaguard (登録商標) + TX、Meemazal (登録商標) + TX、Molt-X (登録商標) + TX、植物性の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標)、Neemix (登録商標)) + TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標)) + TX、アメリカアリタソウ (*Chenopodium ambrosioides* near *ambrosioides*) (Requiem (登録商標)) + TX、キク属 (*Chrysanthemum*) 抽出物 (Crisant (登録商標)) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標)) + TX、シン科植物 (*Labiatae*) の精油 (Botania (登録商標)) + TX、クローブローズマリーペパー・ミントおよびタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標)) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標)) + TX、ニンニク + TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標)) + TX、ニーム油 + TX、イヌハッカ (*Nepeta cataria*) (キャットニップ油) + TX、イヌハッカ (*Nepeta catarina*) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (MossBuster (登録商標)) + TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標)) + TX、除虫菊 + TX、シャボンノキ (*Quillaja saponaria*) (NemaQ (登録商標)) + TX、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) (Regalia (登録商標)) + TX、Sakalia (登録商標)) + TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標)) + TX、ミカン科植物 (*Rutaceae*) 抽出物 (Soleo (登録商標)) + TX、大豆油 (Ortho ecosense (登録商標)) + TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標)) + TX、タイム油 + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、BugOil (登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパー・ミント・タイムおよびシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標)) + TX、クローブローズマリーお

およびペパーミント抽出物の混合物( E F 4 0 0 (登録商標) ) + TX、クロープペパー  
ミントニンニク油およびミントの混合物( S o i l S h o t (登録商標) ) + TX、カ  
オリソルブ( S c r e e n (登録商標) ) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン( L a m i n a r i  
n (登録商標) ) + TX; および

以下のものを含むフェロモン: クロネハイイロヒメハマキ( b l a c k h e a d e d  
f i r e w o r m ) フェロモン( 3 M S p r a y a b l e B l a c k h e a d e d  
F i r e w o r m P h e r o m o n e (登録商標) ) + TX、コドリンガ( C o d l i  
n g M o t h ) フェロモン( P a r a m o u n t d i s p e n s e r - ( C M ) / I  
s o m a t e C - P l u s (登録商標) ) + TX、グレープベリーモス( G r a p e  
B e r r y M o t h ) フェロモン( 3 M M E C - G B M S p r a y a b l e P h  
e r o m o n e (登録商標) ) + TX、ハマキガ科のガ( L e a f r o l l e r ) フェロ  
モン( 3 M M E C - L R S p r a y a b l e P h e r o m o n e (登録商標) ) +  
TX、Muscumone( S n i p 7 F l y B a i t (登録商標) ) + TX、S t a  
r b a r P r e m i u m F l y B a i t (登録商標) ) + TX、ナシヒメシンクイ  
( O r i e n t a l F r u i t M o t h ) フェロモン( 3 M o r i e n t a l f  
r u i t m o t h s p r a y a b l e p h e r o m o n e (登録商標) ) + TX、  
スカシバガ科のガ( P e a c h t r e e B o r e r ) フェロモン( I s o m a t e - P  
(登録商標) ) + TX、トマトピンワーム( T o m a t o P i n w o r m ) フェロモン  
( 3 M S p r a y a b l e p h e r o m o n e (登録商標) ) + TX、E n t o s t  
a t 粉末( ヤシの木からの抽出物)( E x o s e x C M (登録商標) ) + TX、テトラ  
デカトリエニルアセテート+ TX、13 - ヘキサデカトリエナール+ TX、( E + T X ,  
Z ) - 7 + TX , 9 - ドデカジエン - 1 - イルアセテート+ TX、2 - メチル - 1 - ブタ  
ノール+ TX、酢酸カルシウム+ TX、S c e n t u r i o n (登録商標) + TX、B i  
o l u r e (登録商標) + TX、C h e c k - M a t e (登録商標) + TX、ラバンズリ  
ルセネシオアート( L a v a n d u l y l s e n e c i o a t e ) ; および

以下のものを含む生物( M a c r o b i a l s ) : アフェリヌス・アブドミナリス( A  
p h e l i n u s a b d o m i n a l i s ) + TX、アフィジウス・エルビ( A p h i  
d i u s e r v i ) ( A p h e l i n u s - S y s t e m (登録商標) ) + TX、アセ  
ロファガス・パパイヤ( A c e r o p h a g u s p a p a y a ) + TX、フタモンテン  
トウ( A d a l i a b i p u n c t a t a ) ( A d a l i a - S y s t e m (登録商標)  
)) + TX、フタモンテントウ( A d a l i a b i p u n c t a t a ) ( A d a l i n  
e (登録商標) ) + TX、フタモンテントウ( A d a l i a b i p u n c t a t a ) ( A p h i d a l i a (登録商標) ) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ( A g e n i a  
s p i s c i t r i c o l a ) + TX、アゲニアスピス・フシコリス( A g e n i a s  
p i s f u s c i c o l l i s ) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ( A m b l  
y s e i u s a n d e r s o n i ) ( A n d e r l i n e (登録商標) + TX、A n d  
e r s o n i - S y s t e m (登録商標) ) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニク  
ス( A m b l y s e i u s c a l i f o r n i c u s ) ( A m b l y l i n e (登録商  
標) + TX、S p i c a l (登録商標) ) + TX、アンブリセイウス・ククメリス( A m  
b l y s e i u s c u c u m e r i s ) ( T h r i p e x (登録商標) + TX、B u g  
l i n e c u c u m e r i s (登録商標) ) + TX、アンブリセイウス・ファラキス( A m b l y s e i u s f a l l a c i s ) ( F a l l a c i s (登録商標) ) + TX、  
アンブリセイウス・スウィルスキイ( A m b l y s e i u s s w i r s k i i ) ( B u  
g l i n e s w i r s k i i (登録商標) + TX、S w i r s k i i - M i t e (登録  
商標) ) + TX、アンブリセイウス・ウォマースレイ( A m b l y s e i u s w o  
m e r s l e y i ) ( W o m e r M i t e (登録商標) ) + TX、アミツス・ヘスペリヅム  
( A m i t u s h e s p e r i d u m ) + TX、アナグラス・アトムス( A n a g r u s  
a t o m u s ) + TX、アナギルス・フシベントリス( A n a g y r u s f u s c  
i v e n t r i s ) + TX、アナギルス・カマリ( A n a g y r u s k a m a l i ) +  
TX、A n a g y r u s l o e c k i + TX、アナギルス・シュードコッカス( A n a  
50

gyrus pseudococcii) (Citripar (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris - System (登録商標)) + TX、アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標)) + TX、Aphiline (登録商標)) + TX、アフェリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Aphipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuensis) + TX、アフィジウス・マトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Aphipar - M (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標)) + TX、アフィチス・リングナナンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、アフィチス・メリヌス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイイ (Aprostocetus hagenowii) + TX、アセタ・コリアリア (Atheta coriaria) (Staphylone (登録商標)) + TX、マルハナバチ属 (Bombus spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Natupol Beehive (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標)) + TX、Tripol (登録商標)) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、チノコルス・ニグリツス (Chilocorus nigritus) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysopa (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフィラブリス (Chrysoperla rufilabris) + TX、シロスピルス・イングヌウス (Cirrospilus ingenuus) + TX、シロスピルス・クアドリストリアツス (Cirrospilus quadristriatus) + TX、シトロスチクス・フィロクニストトイデス (Citrostichus phylloconistoides) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (Closterocerus chamaeleon) + TX、クロステロセルス属 (Closterocerus spp.) + TX、コシドキセノイデス・ペルミニツス (Coccidoxenoides perminutus) (Planopar (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (Coccophagus cowperi) + TX、コッコファグス・リシムニア (Coccophagus lycomnia) + TX、キアシサムライコマユバチ (Cotesia flavipes) + TX、コナガサムライコマユバチ (Cotesia plutellae) + TX、ツマアカオオテントウムシ (Cryptolaemus montrouzieri) (Cryptobug (登録商標)) + TX、Cryptoline (登録商標)) + TX、キムネタマキスイ (Cybocephalus nipponicus) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (Minusa (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (Diminex (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (Delphastus catalinae) (Delphastus (登録商標)) + TX、デルファスツス・プシリス (Delphastus pusillus) + TX、ディアカスミモルファ・クラウシイ (Diachasmimorpha krausii) + TX、ディアカスミモルファ・ロンギカウダタ (Diachasmimorpha longicaudata) + TX、ディアパルシス・ジュク 10  
20  
30  
40  
50

ンダ ( *Diaparsis jucunda* ) + TX、ディアホレンシルツス・アリガレンシス ( *Diaphorencyrtus aligarhensis* ) + TX、イサエアヒメコバチ ( *Diglyphus isaea* ) + TX、イサエアヒメコバチ ( *Diglyphus isaea* ) ( *Miglyphus* ( 登録商標 ) + TX、 *Digline* ( 登録商標 ) ) + TX、ハモグリコマユバチ ( *Dacnusa sibirica* ) ( *DacDigline* ( 登録商標 ) + TX、 *Minex* ( 登録商標 ) ) + TX、ディベルシネルブス属 ( *Diversinervus spp.* ) + TX、エンカルシア・シリナ ( *Encarsia citrina* ) + TX、オンシツツヤコバチ ( *Encarsia formosa* ) ( *Encarsia max* ( 登録商標 ) + TX、 *Encarlina* ( 登録商標 ) + TX、 *En-Strip* ( 登録商標 ) ) + TX、サバクツヤコバチ ( *Eretmocerus eremicus* ) ( *Enermix* ( 登録商標 ) ) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ ( *Encarsia guadeloupae* ) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス ( *Encarsia haitiensis* ) + TX、ホソヒラタアブ ( *Episyphus balteatus* ) ( *Syrphidend* ( 登録商標 ) ) + TX、エレトモセリス・シフォニニ ( *Eretmoceris siphonini* ) + TX、エレトモセルス・カリフォルニクス ( *Eretmocerus californicus* ) + TX、サバクツヤコバチ ( *Eretmocerus eremicus* ) ( *Ercal* ( 登録商標 ) + TX、 *Eretline e* ( 登録商標 ) ) + TX、サバクツヤコバチ ( *Eretmocerus eremicus* ) ( *Bemimix* ( 登録商標 ) ) + TX、エレトモセルス・ハヤチ ( *Eretmocerus hayati* ) + TX、エレトモセルス・ムンヅス ( *Eretmocerus mundus* ) ( *Bemipar* ( 登録商標 ) + TX、 *Eretline m* ( 登録商標 ) ) + TX、エレトモセルス・シフォニニ ( *Eretmocerus siphonini* ) + TX、エキソコムス・クアドリップスツラツス ( *Exochomus quadripustulatus* ) + TX、フェルチエラ・アカリスガ ( *Feltiella acarisuga* ) ( *Spidend* ( 登録商標 ) ) + TX、フェルチエラ・アカリスガ ( *Feltiella acarisuga* ) ( *Feltiline* ( 登録商標 ) ) + TX、フォピウス・アリサンス ( *Fopius arisanus* ) + TX、フォピウス・セラチチボルス ( *Fopius ceratitivorus* ) + TX、ホルモノネチン ( *Wireless Beehome* ( 登録商標 ) ) + TX、アリガタシマアザミウマ ( *Franklinotriips vespiformis* ) ( *Vespop* ( 登録商標 ) ) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス ( *Galendromus occidentalis* ) + TX、ゴニオズス・レグネリ ( *Goniozus legneri* ) + TX、シマメイガコマユバチ ( *Habrobracon hebetor* ) + TX、ナミテントウ ( *Harmonia axyridis* ) ( *HarmoBeetle* ( 登録商標 ) ) + TX、ヘテロラブディティス属 ( *Heterorhabditis spp.* ) ( *Lawn Patrol* ( 登録商標 ) ) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ ( *Heterorhabditis bacteriophora* ) ( *NemaShield HB* ( 登録商標 ) + TX、 *Nemaseek* ( 登録商標 ) + TX、 *Terranem-Nam* ( 登録商標 ) + TX、 *Terranem* ( 登録商標 ) + TX、 *Larvanem* ( 登録商標 ) + TX、 *B-Green* ( 登録商標 ) + TX、 *NemAttack* ( 登録商標 ) + TX、 *Nematop* ( 登録商標 ) ) + TX、ヘテロラブディティス・メジディス ( *Heterorhabditis megidis* ) ( *Nemasys H* ( 登録商標 ) + TX、 *BioNem H* ( 登録商標 ) + TX、 *Exhibitline hm* ( 登録商標 ) + TX、 *Larvanem-M* ( 登録商標 ) ) + TX、サカハチテントウ ( *Hippodamia convergens* ) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー ( *Hypoaspis aculeifer* ) ( *Aculeifer-System* ( 登録商標 ) + TX、 *Entomite-A* ( 登録商標 ) ) + TX、ヒポアスピス・ミルス ( *Hypoaspis miles* ) ( *Hypoline m* ( 登録商標 ) + TX、 *Entomite-M* ( 登録商標 ) ) + TX、ルバリア・レウコスパイデス ( *Lbalia leucospoides* 50

) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (*Lecanoideus floccissimus*) + TX、レモファグス・エラブンヅス (*Lemophagus errabundus*) + TX、レプトマスチdea・アブノルミス (*Leptomastidea abnormis*) + TX、レプトマスチクス・ダクチロピ (*Leptomastix dactylopii*) (*Leptopar* (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エポナ (*Leptomastix epona*) + TX、リンドルス・ロファンタエ (*Lindorus lophantheae*) + TX、リポレクシス・オレグマエ (*Lipolexis oregmae*) + TX、ルシリア・カエサル (*Lucilia caesar*) (*Natufly* (登録商標)) + TX、リシフレブス・テスタケイペス (*Lysiphlebus testaceipes*) + TX、マクロロフス・カリギノスス (*Macrolophus caliginosus*) (*Mirical-N* (登録商標)) + TX、  
 Macrololine c (登録商標) + TX、*Mirical* (登録商標)) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (*Mesoseiulus longipes*) + TX、メタフィクス・フラブス (*Metaphycus flavus*) + TX、メタフィクス・ロウンスブリイ (*Metaphycus lounsburyi*) + TX、ミクロムス・アングラツス (*Micromus angulatus*) (*Milacewing* (登録商標)) + TX、ミクロテリス・フラブス (*Microterys flavus*) + TX、ムスシディフラクス・ラポトレルス (*Muscidiifurax raptor* el lus) およびスパランギア・カメロニ (*Spalangia cameroni*) (*Biopar* (登録商標)) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (*Neodryinus typhlocybae*) + TX、ミヤコカブリダニ (*Neoseiulus californicus*) + TX、ネオセイウルス・ククメリス (*Neoseiulus cucumeris*) (*THRYPEX* (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (*Neoseiulus fallacis*) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (*Nesidioecoris tenuis*) (*NesidioBug* (登録商標)) + TX、*Nesibug* (登録商標)) + TX、オフィラ・アエネセンス (*Ophyra aenescens*) (*Biofly* (登録商標)) + TX、シノビハナカメムシ (*Orinus insidiosus*) (*Thripor-I* (登録商標)) + TX、*Oriline i* (登録商標)) + TX、エルヒメハナカメムシ (*Orius laevigatus*) (*Thripor-L* (登録商標)) + TX、*Oriline l* (登録商標)) + TX、オリウス・マジュスクルス (*Orius majusculus*) (*Oriline m* (登録商標)) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (*Orius strigicollis*) (*Thripor-S* (登録商標)) + TX、パウエシア・ジュニペロルム (*Pauesia juniperorum*) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (*Pediobius foveolatus*) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (*Phasmarrhabditis hermaphrodita*) (*Nemaslug* (登録商標)) + TX、フィマスティクス・コフェア (*Phymastichus coffea*) + TX、フィトセイウルス・マクロピルス (*Phytoseiulus macropilus*) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (*Spidex* (登録商標)) + TX、*Phytolipe p* (登録商標)) + TX、ポディスス・マクリベントリス (*Podisus maculiventris*) (*Podisus* (登録商標)) + TX、シューダクテオン・クルバツス (*Pseudacteon curvatus*) + TX、シューダクテオン・オブツスス (*Pseudacteon obtusus*) + TX、シューダクテオン・トリクスピス (*Pseudacteon tricuspis*) + TX、シューダフィクス・マクリベンニス (*Pseudaphycus maculipennis*) + TX、シュードレブトマスティクス・メキシカーナ (*Pseudoleptomastix mexicana*) + TX、サイラエファグス・ピロスス (*Psyllaephagus pilosus*) + TX、サイタリア・コンコロル (*Psytalbia concolor*) (複合体) 50

+ TX、クアドラスティクス属 (*Quadrastichus spp.*) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (*Rhyzobius lophanthae*) + TX、ベダリアテントウ (*Rodolia cardinalis*) + TX、オオクビキレガイ (*Rumina decollata*) + TX、セミエラケア・ペティオラツス (*Semielachner petiolatus*) + TX、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (*Ervibank* (登録商標)) + TX、スタイルネマ・カーポブサエ (*Steinernema carpocapsae*) (*Nematac C* (登録商標)) + TX、*Millenium* (登録商標) + TX、*BioNem C* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemastar* (登録商標) + TX、*Capsanem* (登録商標) ) + TX、スタイルネマ・フェルティニアエ (*Steinerinema feltiae*) (*NemaShield* (登録商標)) + TX、*Nemasys F* (登録商標) + TX、*BioNem F* (登録商標) + TX、*Steinerinema-System* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemaplus* (登録商標) + TX、*Exhibitline sf* (登録商標) + TX、*Scia-rid* (登録商標) + TX、*Entonem* (登録商標) ) + TX、スタイルネマ・クラッセイ (*Steinerinema kraussei*) (*Nemasys L* (登録商標)) + TX、*BioNem L* (登録商標) + TX、*Exhibitline sr b* (登録商標) ) + TX、スタイルネマ・リオブラベ (*Steinerinema riobrave*) (*BioVector* (登録商標)) + TX、*BioVektor* (登録商標) ) + TX、スタイルネマ・スカプテリシ (*Steinerinema capterisci*) (*Nematac S* (登録商標)) + TX、スタイルネマ属 (*Steinerinema spp.*) + TX、スタイルネマチド属 (*Steiner nematid spp.*) (*Guardian Nematodes* (登録商標)) + TX、ステトルス・ punctillum (*Stethorus punctillum*) (*Stethorus* (登録商標)) + TX、タマリキシア・ラジアタ (*Tamarixia radiata*) + TX、テトラスティクス・セティファー (*Tetrastichus setifer*) + TX、トリポビウス・セミルテウス (*Thripobius semiluteus*) + TX、トリムス・シネンシス (*Torymus sinensis*) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricholine b* (登録商標)) + TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tricho-Strip* (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (*Trichogramma evanescens*) + TX、トリコグラムマ・ミニツム (*Trichogramma minutum*) + TX、アワノメイガタマゴバチ (*Trichogramma ostriniae*) + TX、トリコグラムマ・プラトネリ (*Trichogramma platneri*) + TX、トリコグラムマ・プレチオスム (*Trichogramma pretiosum*) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla stemmator*) ; および

以下のものを含む他の生物学的製剤 : アブシジン酸 + TX、*bioSea* (登録商標) + TX、コンドロステレウム・ブルプレウム (*Chondrostereum purpureum*) (*Chontrol Paste* (登録商標)) + TX、コレトリクム・グレオスポリオイデス (*Colletotrichum gloeosporioides*) (*Collego* (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (*Cueva* (登録商標)) + TX、デルタトラップ (*Trapline d* (登録商標)) + TX、エルウィニア・アミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハーピン) (*ProAct* (登録商標)) + TX、*Ni-HIBIT Gold CST* (登録商標) ) + TX、リン酸第二鉄 (*Ferriphosphate*) (*Ferramol* (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (*Trapline y* (登録商標)) + TX、*Galleex* (登録商標) + TX、*Grower's Secret* (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (*Homobrassonolide*) + TX、リン酸鉄 (*Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait* (登録商標) 50

) ) + TX、M C P hailトラップ(Trapline f (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ(Microctonus hyperodae) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス(Mycoleptodiscus terrestris)(Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Aminomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ(Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム(MilStop (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩(Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液(Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム+チオシアン酸カリウム(Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX、クモ毒+TX、ノセマ・ロクスタエ(Nosema locustae) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX、粘着トラップ(Trapline YF (登録商標) + TX、Rebel Amarillo (登録商標)) + TXおよびトラップ(Takitrapline y+b (登録商標)) + TX。

#### 【0244】

活性成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば、[3878-19-1]は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。上記の混合の相手は公知である。活性成分が、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会(The British Crop Protection Council)]に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号(1)で記載されている。「[CCN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names”に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, (著作権) 1995-2004]；例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス：<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>に記載されている。

#### 【0245】

上記の活性成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」または別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され；その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクト名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」または「開発コード」が使用され、あるいはそれらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。

#### 【0246】

表1～5から選択される式Iの化合物と、上記の活性成分との活性成分混合物は、表1～5から選択される化合物および上記の活性成分を、好ましくは、100：1～1：600、特に、50：1～1：50の混合比で、より特に、20：1～1：20、さらにより特に、10：1～1：10、非常に特に、5：1および1：5の比率で(2：1～1：2の比率が特に好ましく、4：1～2：1の比率が同様に好ましい)、とりわけ、1：1、または5：1、または5：2、または5：3、または5：4、または4：1、または4：2、または4：3、または3：1、または3：2、または2：1、または1：5、または2：5、または3：5、または4：5、または1：4、または2：4、または3：4、または1：3、または2：3、または1：2、または1：600、または1：300、または1：150、または1：35、または2：35、または4：35、または1：75、または2：75、または4：75、または1：6000、または1：3000、または1

: 1500、または1:350、または2:350、または4:350、または1:750、または2:750、または4:750の比率で含む。それらの混合比は、重量基準である。

#### 【0247】

上記の混合物は、有害生物を防除するための方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を、有害生物またはその環境に施用する工程を含むが、手術または治療による人または動物の身体の治療のための方法および人または動物の身体において実施される診断方法を除く。

#### 【0248】

表1～5から選択される式Iの化合物と、上記の1つまたは複数の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス(ready-mix)形態で、「タンクミックス」などの、単一の活性成分の別個の製剤から構成される組み合わされたスプレー混合物として、および逐次、すなわち、数時間または数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の活性成分の併用で施用され得る。表1～5から選択される式Iの化合物および上記の活性成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。10

#### 【0249】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば、非エポキシ化またはエポキシ化植物油（例えばエポキシ化ヤシ油、ナタネ油または大豆油）、消泡剤、例えば、シリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤および/または粘着付与剤、肥料または特定の効果を得るために他の活性成分、例えば、殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤または除草剤などの、さらなる固体または液体助剤も含み得る。20

#### 【0250】

本発明に係る組成物は、例えば、固体活性成分を粉碎し、篩にかけ、および/または圧縮することによって、助剤の非存在下で、および例えば、活性成分を、1つまたは複数の助剤と均質混合し、および/または粉碎することによって、少なくとも1つの助剤の存在下で、それ自体公知の方法で調製される。この組成物の調製のためのこれらの方法およびこれらの組成物の調製のための化合物Iの使用も本発明の主題である。

#### 【0251】

この組成物のための施用方法、すなわち、噴霧、霧化(atomizing)、散布、はけ塗り(brushing on)、粉衣(dressing)、拡散(scattering)または注ぎかけ(pouring)(これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである)などの、上記のタイプの有害生物を防除する方法および上記のタイプの有害生物を防除するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1～1000 ppm、好ましくは、0.1～500 ppmの活性成分である。ヘクタール当たりの施用量は、一般に、ヘクタール当たり1～2000 gの活性成分、特に、10～1000 g/h a、好ましくは、10～600 g/h aである。30

#### 【0252】

作物保護の分野における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用(葉面施用)であり、該当する有害生物による寄生の危険性に合わせて施用頻度および施用量を選択することができる。あるいは、活性成分は、植物の生息地に液体組成物を灌注することによって、または固体形態の活性成分を、植物の生息地、例えば土壤中に、例えば粒剤の形態で導入すること(土壤施用)によって、根系(全身作用)を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。40

#### 【0253】

本発明の化合物およびその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば、果実、塊茎または穀粒などの種子、または苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。あるいは、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することによって、または固体組成物の層を塗布することによって、種子仁に塗付され得る(コーティング)。繁殖材料が50

施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を、例えば、ドリルまき (drillling) の際に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法およびこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物および防除される有害生物 / 真菌に応じて決まり、一般に、100 kg の種子当たり 1 ~ 200 グラム、好ましくは、100 kg の種子当たり 5 ~ 150 グラム (100 kg の種子当たり 10 ~ 100 グラムなど) である。

#### 【0254】

種子という用語は、真正種子 (true seed)、種子片、吸枝、トウモロコシ粒 (corn)、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽 (cut shoot) などを含むがこれらに限定されないあらゆる種類の種子および植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

#### 【0255】

本発明は、式 I の化合物で被覆または処理されるかあるいはそれを含有する種子も含む。「で被覆または処理されるかおよび / またはそれを含有する」という用語は、一般に、活性成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、活性成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式 (I) の化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これによって、式 (I) の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

#### 【0256】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬および種子ペレッティング (pelleting) などの、当該技術分野において公知の全ての好適な種子処理技術を含む。式 (I) の化合物の種子処理適用は、種まきの前または種まき / 種子の植え付けの際に噴霧または種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

#### 【0257】

生物学的実施例 :

実施例 B1 : タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*) (ワタコナジラミ) に対する活性 :

ワタ葉片を、24 ウエルマイクロタイターブレート中の寒天上に置き、10'000 pm の DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に、コナジラミ成虫を外寄生させた。インキュベーションの 6 日後、試料を死亡率について調べた。

#### 【0258】

以下の化合物 : P1 および P2 は、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした。

#### 【0259】

実施例 B2 : ディアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*) (トウモロコシハムシ) に対する活性

24 ウエルマイクロタイターブレート中の寒天層上に置かれたトウモロコシの芽を、噴霧により、10'000 ppm の DMSO ストック溶液から調製された試験水溶液で処理した。乾燥させた後、ブレートに、L2 幼虫 (ウェル当たり 6 ~ 10 匹) を外寄生させた。外寄生の 4 日後、試料を死亡率について評価した。

#### 【0260】

以下の化合物 : P1、P2、P3、P4、P6、P7、P8、P9、PP1、P10、P11 および P12 は、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした。

#### 【0261】

実施例 B3 : ユースキスツス・ヘロス (*Euschistus heros*) (ネオトロピカルチャイロカメムシ (Neotropical Brown Stink Bug))

10

20

30

40

50

)に対する活性：

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉に、N-2若虫を外寄生させた。外寄生の5日後、試料を、非処理の試料と比較した成長阻害について評価した。

**【0262】**

以下の化合物：P1、P3、P4、P7、P8、PP1、P10、P11およびP12は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリー（死亡率または成長阻害）の少なくとも1つにおいて少なくとも80%の効果を示した。

**【0263】**

実施例B4：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)に対する活性：

ヒマワリ葉片を、24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に、様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。外寄生の6日後、試料を死亡率について評価した。

**【0264】**

以下の化合物：P1、P2、P3、P4、P6、P7、P8、PP1、P10およびP11は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

**【0265】**

実施例B5：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)に対する活性：

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウマメの苗の根を、10'000 DMSOストック溶液から調製された試験水溶液に直接入れた。苗を試験溶液に入れた6日後、試料を死亡率について評価した。

**【0266】**

以下の化合物：P2およびP4は、24 ppmの試験量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

**【0267】**

実施例B6：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)に対する活性：

10'000 ppmのDMSOストック溶液からの試験化合物を、ピペットによって、24ウェルマイクロタイタープレートに適用し、スクロース溶液と混合した。プレートを伸張したパラフィルムで閉じた。24個の穴を開けたプラスチックステンシルをプレート上に置き、外寄生させたエンドウマメの苗を、直接パラフィルム上に置いた。外寄生させたプレートをゲル吸取紙および別のプラスチックステンシルで閉じ、次に、上下を逆にした。外寄生の5日後、試料を死亡率について評価した。

**【0268】**

以下の化合物：P1およびP3は、12 ppmの試験量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

**【0269】**

実施例B7：コナガ (*Pluteolla xylostella*) (コナガ)に対する活性

人工飼料の入った24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに、L2幼虫(ウェル当たり10~15匹)を外寄生させた。外寄生の5日後、試料を、非処理の試料と比較した死亡率および成長阻害について評価した。

**【0270】**

以下の化合物：P1、P2、P3、P4、P7、P8、PP1、P10、P11およびP12は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリー（死亡率または成長阻害）の少なくとも1つにおいて少なくとも80%の効果を示した。

10

20

30

40

50

とも1つにおいて少なくとも80%の効果を示した。

【0271】

実施例B8：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ）に対する活性：

ワタ葉片を、24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に、5匹のL1幼虫を外寄生させた。外寄生の3日後、試料を、非処理の試料と比較した死亡率、摂食阻害効果、および成長阻害について評価した。試験試料によるエジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）の防除は、死亡率、摂食阻害効果、および成長阻害のうちの少なくとも1つが、非処理の試料より高い場合である。

10

【0272】

以下の化合物：P1、P2、P3、P4、P7、P8、P9、PP1、P10、P11およびP12は、200ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした。

【0273】

実施例B9：エジプトヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（エジプトヨトウ）に対する活性：

試験化合物を、ピペットによって、10'000 ppmのDMSOストック溶液から24ウェルプレートへと適用し、寒天と混合した。レタス種子を、寒天上に置き、マルチウェルプレートを、同様に寒天を含む別のプレートによって閉じた。7日後、根が化合物を吸収しており、レタスは蓋プレート中へと成長していた。ここで、レタス葉を切り取って、蓋プレート中に入れた。スピドロテラ属（*Spodoptera*）の卵を、プラスチックステンシルを介して、湿ったゲル吸取紙上にピペットで取り、プレートをこの吸取紙で閉じた。外寄生の6日後、試料を、非処理の試料と比較した死亡率、摂食阻害効果および成長阻害について評価した。

20

【0274】

以下の化合物P1、P3、P4およびP7は、12.5ppmの試験量で3つのカテゴリー（死亡率、摂食阻害、または成長阻害）の少なくとも1つにおいて少なくとも80%の効果を示した。

【0275】

実施例B10：ハダニ（*Tetranychus urticae*）（ナミハダニ）に対する活性：摂食／接触活性：

30

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のインゲンマメ葉片に、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に、様々な齢数のダニ個体群を外寄生させた。試料を、外寄生の8日後の混合個体群（可動状態）における死亡率について評価した。

【0276】

以下の化合物：P1は、200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0277】

実施例B11：ネギアザミウマ（*Thrips tabaci*）（ネギアザミウマ）に対する活性、摂食／接触活性：

40

ヒマワリ葉片を、24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に、様々な齢数のアザミウマ個体群を外寄生させた。外寄生の6日後、試料を死亡率について評価した。

【0278】

以下の化合物：P10は、200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0279】

実施例B11：ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）（黄熱病蚊）に対する活

50

性：

10 ~ 15 匹のネッタイシマカ (Aedes) の幼虫 (L2) を、栄養混合物と一緒に、96 ウエルマイクロタイタープレートに入れた。試験化合物をピペットによりウェルに入れた。2 日間のインキュベーション期間の後、この昆虫を、死亡率および成長阻害について評価した。

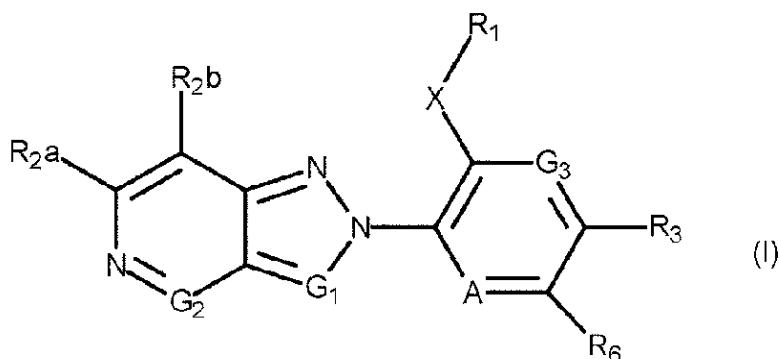
【0280】

以下の化合物：P1 および P7 は、5 ppm の試験量で 2 つのカテゴリー（死亡率または成長阻害）の少なくとも 1 つにおいて少なくとも 80 % の効果を示した。

本発明の好ましい態様は、下記の通りである。

[1] 式 I の化合物

10



20

(式中、

A が、C H、N または C R<sub>7</sub> であり；R<sub>7</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、シアノ、ニトロまたはハロゲンであり；

X が、S、SO または SO<sub>2</sub> であり；

R<sub>1</sub> が、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されている C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；または

R<sub>1</sub> が、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されている C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり；または

R<sub>1</sub> が、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルケニルまたは C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニルであり；

R<sub>2a</sub> および R<sub>2b</sub> が、互いに独立して、水素、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルまたはヒドロキシリル、メトキシおよびシアノからなる群から選択される 1 つまたは 2 つの置換基で置換されている C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルであり；または

R<sub>2a</sub> および R<sub>2b</sub> が、互いに独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルコキシ、または -C(O)(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキル) であり；または

R<sub>2a</sub> および R<sub>2b</sub> が、互いに独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルおよび C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換できることができる C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；

R<sub>3</sub> が、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルコキシ C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル - C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキルであり、または

R<sub>3</sub> が、ハロゲン、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> ハロアルキルおよびシアノからなる群から選択される置換基で一置換または二置換されている C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；または

30

40

50

R<sub>3</sub>が、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、および-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されていることができるフェニルであり；または

R<sub>3</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルコキシ、-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルフィニル、またはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルおよび-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されていることができるピリミジニルであり；または

R<sub>3</sub>が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニルおよび-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されていることができるピリジニルであり；または

R<sub>3</sub>が、置換基G<sub>3</sub>を含有する環に窒素原子を介して連結された5員～6員の、芳香族の、部分的に飽和したまたは完全に飽和した環系であり、前記環系は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルコキシC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルスルホニル、-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルファニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルスルホニルおよび-C(O)C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されていることができ；前記環系は、窒素、酸素および硫黄からなる群から選択される1、2または3個のヘテロ原子を含有し；前記環系は、2個以上の酸素原子および1個以下の硫黄原子を含有していなくてもよく；

R<sub>6</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、ハロゲンまたはシアノであり；

G<sub>1</sub>が、CR<sub>4</sub>であり、R<sub>4</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノまたはハロゲンであり；

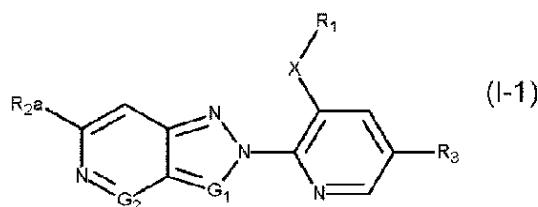
G<sub>2</sub>が、NまたはCR<sub>5</sub>であり、R<sub>5</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、シアノ、ニトロまたはハロゲンであり；

G<sub>3</sub>が、NまたはCR<sub>8</sub>であり、R<sub>8</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、ハロゲンまたはシアノである）

ならびに式Iの前記化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変

異性体およびN-オキシド。

[2] 式I-1の化合物

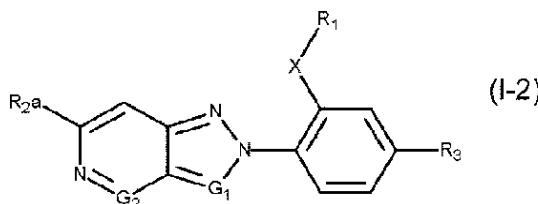


(式中、X、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、R<sub>1</sub>およびR<sub>2a</sub>が、上記式Iで定義されるとおりであり；R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)

10

によって表される、前記〔1〕に記載の式Iの化合物。

[3] 式I-2の化合物

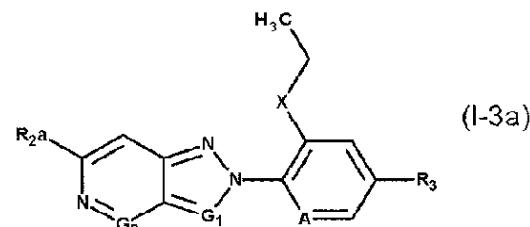


(式中、X、G<sub>1</sub>、G<sub>2</sub>、R<sub>1</sub>およびR<sub>2a</sub>が、上記式Iで定義されるとおりであり；R<sub>3</sub>が、水素、ハロゲンまたはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルである)

20

によって表される、前記〔1〕に記載の式Iの化合物。

[4] 式I-3aの化合物



30

(式中、

Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>であり；R<sub>2a</sub>が、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルまたはハロゲンであり；R<sub>3</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはハロゲンもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルで一置換されていることができるフェニルであり；

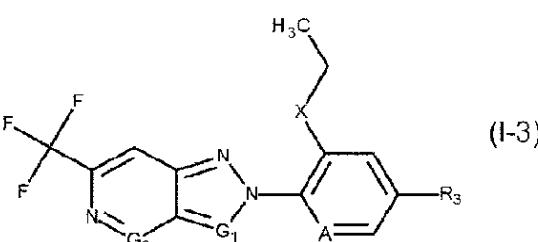
G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり、R<sub>4</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シアノまたはハロゲンであり；

G<sub>2</sub>が、CHまたはNであり；および

Aが、CHまたはNである)

によって表される、式Iの化合物。

[5] 式I-3の化合物



40

(式中、

Xが、S、SOまたはSO<sub>2</sub>であり；

R<sub>3</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであるか、またはハロ

50

ゲンもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>ハロアルキルで一置換されていることができるフェニルであり；  
G<sub>1</sub>がCR<sub>4</sub>であり、R<sub>4</sub>が、水素、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、シアノまたはハロゲンであり；  
G<sub>2</sub>が、CHまたはNであり；および  
Aが、CHまたはNである）

によって表される、前記〔1〕に記載の式Iの化合物。

〔6〕活性成分として、それぞれ遊離形態または農芸化学的に利用可能な塩形態の、前記〔1〕に記載の少なくとも1つの式Iの化合物または適切な場合にその互変異性体と、少なくとも1つの助剤とを含む殺有害生物組成物。

〔7〕有害生物を防除するための方法であって、前記〔6〕に記載の組成物を、前記有害生物またはその環境に施用する工程を含むが、手術または療法による人または動物の身体の治療方法および人または動物の身体において実施される診断方法を除く、方法。 10

〔8〕有害生物による攻撃から植物繁殖材料を保護するための方法であって、前記繁殖材料または前記繁殖材料が植えられた場所を、前記〔6〕に記載の組成物で処理する工程を含む、方法。

## フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I
A 6 1 K 31/444 (2006.01)	A 0 1 P 7/02
A 6 1 K 31/5025 (2006.01)	A 0 1 P 7/04
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 K 31/444
	A 6 1 K 31/5025
	A 6 1 P 33/14

(74)代理人 100119013  
弁理士 山崎 一夫

(74)代理人 100123777  
弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796  
弁理士 服部 博信

(74)代理人 100183379  
弁理士 藤代 昌彦

(72)発明者 ホール ロジャー グラハム  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アクチングゼルシャフト内

(72)発明者 ゴエフ ティボール  
スロバキア 8 4 2 1 5 ブラチスラバ ムリンスカー ドリナ ツアハ - 2 シンコラ エスエ  
ルオーネ

(72)発明者 ユング ピエール ヨーゼフ マルセル  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アクチングゼルシャフト内

(72)発明者 エドマンズ アンドリュー  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アクチングゼルシャフト内

(72)発明者 ジャンゲナ アンドレ  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アクチングゼルシャフト内

(72)発明者 ミューレバッハ ミシェル  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アクチングゼルシャフト内

(72)発明者 ストーラー アンドレ  
スイス ツェーハー - 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ ク  
ロップ プロテクション ミュンヒヴィーレン アクチングゼルシャフト内

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 国際公開第2013/191113 (WO, A1)  
国際公開第2013/106254 (WO, A1)  
特開2014-005263 (JP, A)  
特開2013-136519 (JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D  
A 0 1 N  
A 6 1 K

(112)

JP 6685280 B2 2020.4.22

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