

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第6892452号  
(P6892452)

(45) 発行日 令和3年6月23日 (2021.6.23)

(24) 登録日 令和3年5月31日 (2021.5.31)

(51) Int.Cl.

F I

C O 7 D 401/04 (2006.01)

C O 7 D 401/04

C O 7 D 401/14 (2006.01)

C O 7 D 401/14

C S P

A O 1 P 7/04 (2006.01)

A O 1 P 7/04

A O 1 P 7/02 (2006.01)

A O 1 P 7/02

A O 1 N 43/50 (2006.01)

A O 1 N 43/50

N

請求項の数 13 (全 100 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2018-541607 (P2018-541607)  
 (86) (22) 出願日 平成29年2月6日 (2017.2.6)  
 (65) 公表番号 特表2019-507745 (P2019-507745A)  
 (43) 公表日 平成31年3月22日 (2019.3.22)  
 (86) 国際出願番号 PCT/EP2017/052497  
 (87) 国際公開番号 W02017/137337  
 (87) 国際公開日 平成29年8月17日 (2017.8.17)  
 審査請求日 令和2年2月3日 (2020.2.3)  
 (31) 優先権主張番号 16155136.1  
 (32) 優先日 平成28年2月11日 (2016.2.11)  
 (33) 優先権主張国・地域又は機関  
 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 507203353  
 バイエル・クロップサイエンス・アクチエ  
 ンゲゼルシャフト  
 ドイツ国、40789・モンハイム・アム  
 ・ライン、アルフレート・ノベラー・シュト  
 ラーセ・50  
 (74) 代理人 100114188  
 弁理士 小野 誠  
 (74) 代理人 100119253  
 弁理士 金山 賢教  
 (74) 代理人 100124855  
 弁理士 坪倉 道明  
 (74) 代理人 100129713  
 弁理士 重森 一輝

最終頁に続く

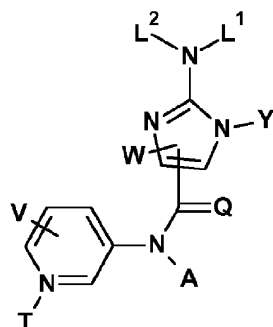
(54) 【発明の名称】 有害生物防除剤としての置換イミダゾリルカルボキサミド類

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



(I)

〔式中、

Q は、酸素又は硫黄を表し；

V は、水素、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、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - ハロアルコキシ及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

W は、水素、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、C<sub>1</sub> - C

$_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

Yは、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、直鎖又は分枝鎖の $C_3 - C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル（ここで、これは、O、 $S(O)_n$ 、CO又は $NR^{4a}$ で互いに独立して1回又は2回中断されていてもよく、及び、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～4置換されていてもよい）、アリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル若しくはヘタリール -  $C_1 - C_4$  - アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル -  $S(O)_n$  - 、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

10

Aは、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）及び $C_3 - C_6$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1置換又は2置換されていてもよい）及び $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖の $C_3 - C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

20

Tは、酸素又は電子対を表し；

$L^1$ は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $C(O)R^2$ 、 $C(O)N(R^3)(R^4)$ 、 $C(O)OR^5$ 及び $SO_2R^6$ を表し；

30

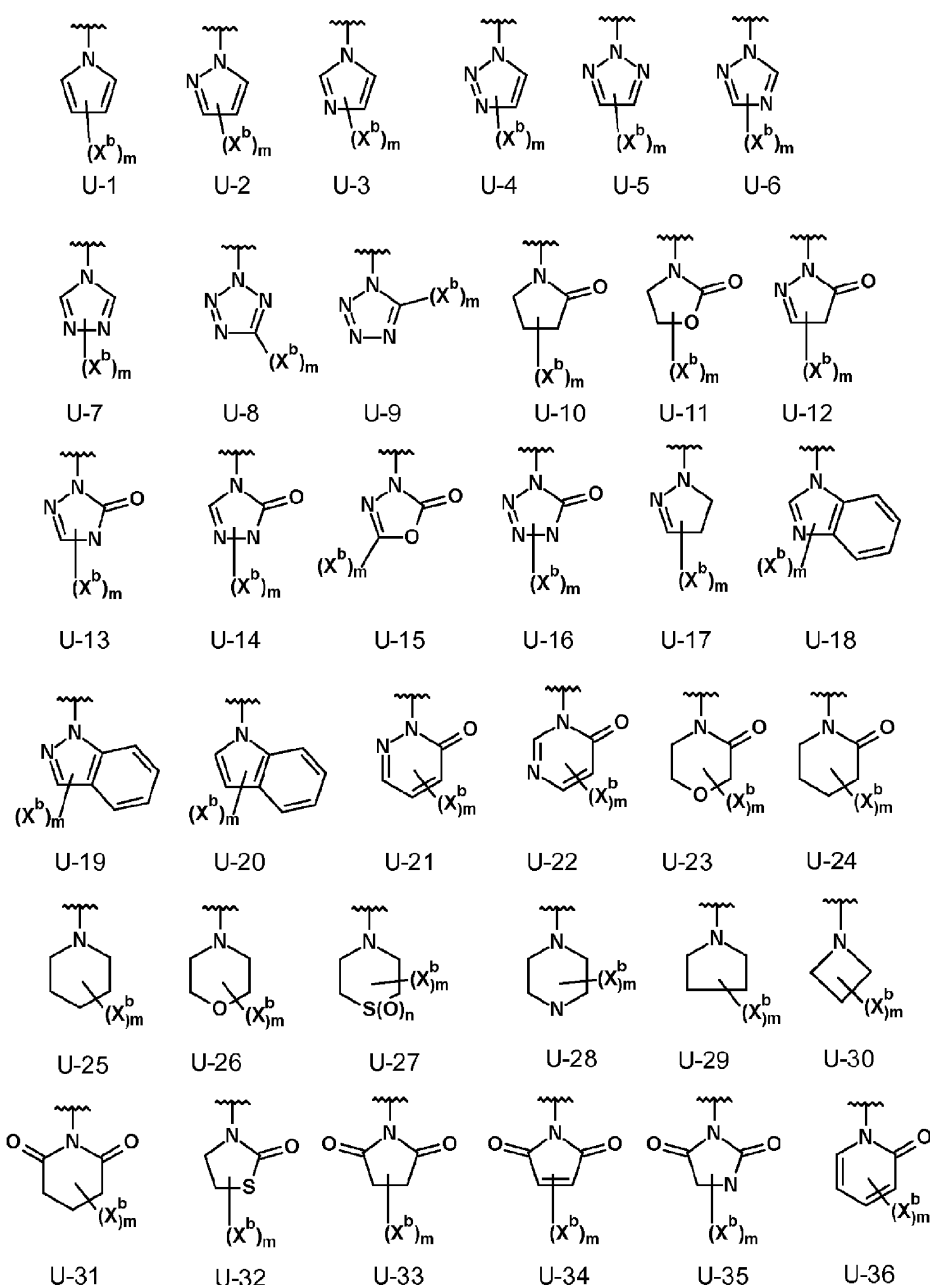
$L^2$ は、水素、 $-N(R^{3a})(R^{4a})$ 、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - アルキニル若しくは $C_1 - C_4$  - アルコキシ（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）、直鎖又は分枝鎖の $C_3 - C_8$  - シクロアルキル若しくは $C_3 - C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル（ここで、これらは、O、 $S(O)_n$ 、CO又は $NR^{4a}$ で互いに独立して1回又は2回中断されていてもよく、及び、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～4置換されていてもよい）、アリール、ヘタリール、アリールアルキル若しくはヘタリールアルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル -  $S(O)_n$  - 、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

40

又は、

50

$L^1$  と  $L^2$  は、 $N$  と一緒に、群  $U-1 \sim U-36$   
 【化 2】



から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 - C_5$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、シアノ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_3 - C_6$ -アルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルコシカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルアミノカルボニル、ジ-( $C_1 - C_6$ )アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルアミノ、アリール及びヘタリールからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、上記置換基アリール及びヘタリールは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ及び $C_1 - C_4$ -アルキルチオからなる群から選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、並び

に、ここで、U - 13、U - 14、U - 16、U - 28及びU - 35における環窒素原子は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキルオキシでは置換されず；

又は、

$X^b$ は、 $C_2 - C_5$ -炭素鎖（ここで、該炭素鎖は、N、S及びOからなる群から選択される1個のヘテロ原子を含んでいてもよく、該炭素鎖は、環の隣接する2つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環、芳香族環、ヘテロ芳香族環又はヘテロ環式環を形成し、その場合、mは2に等しい）を表し；

$R^2$ は、水素、 $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -アルケニル若しくは $C_3 - C_8$ -アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又は $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -で互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖のアリール- $C_1 - C_4$ -アルキル若しくはヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$R^3$ 及び $R^4$ は、互いに独立して、水素、 $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -アルケニル若しくは $C_3 - C_8$ -アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又は $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -で互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖のアリール- $C_1 - C_4$ -アルキル若しくはヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$R^{3a}$ は、水素、 $C_1 - C_8$ -アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ又は $C_1 - C_4$ -アルコキシで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル又は $C_1 - C_4$ -アルコキシで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖のアリール- $C_1 - C_4$ -アルキル若しくはヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

10

20

30

40

50

$R^{4a}$  は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル（ここで、これは、ハロゲン又は  $C_1 - C_4$  - アルコキシで互いに独立して 1 置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル又は  $C_1 - C_4$  - アルコキシで互いに独立して 1～2 置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル  $C(O)R^2$ 、 $C(O)OR^5$  及び  $SO_2R^6$  を表し；

$R^5$  は、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - アルケニル若しくは  $C_3 - C_8$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又は  $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - で互いに独立して 1 置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して 1～2 置換されていてもよい）を表し；

$R^6$  は、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - アルケニル若しくは  $C_3 - C_8$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又は  $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - で互いに独立して 1 置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して 1～2 置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  -、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル -  $S(O)_n$  -、ニトロ又はシアノで互いに独立して 1～3 置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$m$  は、数 0、1、2 又は 3 を表し；

$n$  は、数 0、1 又は 2 を表す；

で表される化合物及びそれらの塩。

#### 【請求項 2】

$Q$  は、酸素を表し；

$V$  は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

$W$  は、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ及びメチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

$Y$  は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_4$  - アルケニル若しくは  $C_3 - C_4$  - アルキニル（ここで、これらは、フッ素、塩素、臭素、メトキシ又はエトキシで互いに独立して 1～5 置換されていてもよい）及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル（ここで、これは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して 1～2 置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$A$  は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは  $C_3 - C_6$  - アルキニル（ここで、これらは、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して 1～5 置換されていてもよい）及び  $C_3 - C_6$  - シクロアルキル（ここで、これは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して 1～2 置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$T$  は、電子対を表し；

$L^1$  と  $L^2$  は、 $N$  と一緒に、群  $U - 1$ 、 $U - 2$ 、 $U - 3$ 、 $U - 4$ 、 $U - 5$ 、 $U - 6$ 、 $U - 7$ 、 $U - 25$ 、 $U - 26$ 、 $U - 27$ 、 $U - 28$ 、 $U - 29$  及び  $U - 30$  から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_2$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  -

10

20

30

40

50

アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルアミノ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 $Me - S(O)_n -$ 、 $Et - S(O)_n -$ 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル -  $S(O)_n -$ 、ジフルオロエチル -  $S(O)_n -$ 、トリフルオロエチル -  $S(O)_n -$ 、ニトロ又はシアノで1～3置換されていてもよく；

又は、

$X^b$  は、 $C_3 - C_5$  - 炭素鎖（ここで、該炭素鎖は、環の隣接する2つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環を形成し、その場合、 $m$  は2に等しい）を表し；

$m$  は、数0、1又は2を表し；

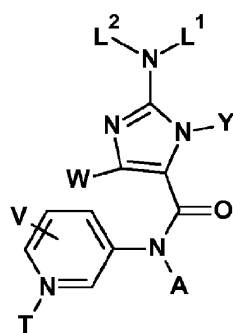
$n$  は、数0、1又は2を表す；

請求項1に記載の化合物及びそれらの塩。

【請求項3】

式(I-1)

【化3】



(I-1),

〔式中、

$V$  は、水素、フッ素、塩素、メチル及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

$W$  は、水素、フッ素、塩素、臭素及びメチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

$Y$  は、メチル、エチル、プロピル、アリル又はプロパルギル（ここで、これらは、フッ素、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$A$  は、水素；メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル若しくはシクロプロピル（ここで、これらは、フッ素、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$T$  は、電子対を表し；

$L^1$  と  $L^2$  は、 $N$  と一緒に、群  $U - 1$ 、 $U - 2$ 、 $U - 3$ 、 $U - 4$ 、 $U - 5$ 、 $U - 6$ 、 $U - 7$ 、 $U - 25$ 、 $U - 26$ 、 $U - 27$ 、 $U - 29$  及び  $U - 30$  から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、メチル、エチル、 $n$  - プロピル及びイソプロピル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、 $n$  - プロポキシ及びイソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メチル -  $S(O)_n -$ 、エチル -  $S(O)_n -$ 、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、メチルカルボニルアミノ又はフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ニトロ又はシアノで1～3置換されていて

もよく；

又は、

$X^b$  は、 $C_3 - C_4$  - 炭素鎖（ここで、該炭素鎖は、環の隣接する 2 つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環を形成し、その場合、 $m$  は 2 に等しい）を表し；

$m$  は、数 0、1 又は 2 を表し；

$n$  は、数 0、1 又は 2 を表す；

で表される請求項 1 に記載の化合物及びそれらの塩。

【請求項 4】

$V$  は、水素を表し；

$W$  は、水素を表し；

$Y$  は、水素、メチル、エチル、アリル及びプロパルギルからなる群から選択されるラジカルを表し；

$A$  は、水素、メチル、エチル及びシクロプロピルからなる群から選択されるラジカルを表し；

$T$  は、電子対を表し；

$L^1$  と  $L^2$  は、 $N$  と一緒に、群  $U - 1$ 、 $U - 2$ 、 $U - 3$ 、 $U - 6$ 、 $U - 25$ 、 $U - 26$  及び  $U - 29$  から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、メチル、エチル、 $n$  - プロピル及びイソプロピル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、メチル又はメトキシで 1 ~ 3 置換されていてもよく；

又は、

$X^b$  は、 $C_3 - C_4$  - 炭素鎖（ここで、該炭素鎖は、環の隣接する 2 つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環を形成し、その場合、 $m$  は 2 に等しい）を表し；

$m$  は、数 0、1 又は 2 を表す；

請求項 3 に記載の化合物及びそれらの塩。

【請求項 5】

$V$  は、水素を表し；

$W$  は、水素を表し；

$Y$  は、メチルを表し；

$A$  は、メチル、エチル又はシクロプロピルを表し；

$T$  は、電子対を表し；

$L^1$  と  $L^2$  は、 $N$  と一緒に、 $U - 1$ 、 $U - 2$ 、 $U - 3$ 、 $U - 6$ 、 $U - 25$ 、 $U - 26$  及び  $U - 29$  からなる群から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、塩素、シアノ、アミノ、メチル、イソプロピル、トリフルオロメチル、メチルチオ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し；

又は、

$X^b$  は、 $-(CH_2)_3-$ （ここで、これは、環の隣接する 2 つの位置に結合しており、及び、これは、脂肪族環を形成し、その場合、 $m$  は 2 に等しい）を表し；

$m$  は、数 0、1 又は 2 を表す；

請求項 3 に記載の化合物及びそれらの塩。

【請求項 6】

組成物であって、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化合物並びに慣習的な増量剤及び / 又は界面活性剤を含んでいる、害虫を防除するための、前記組成物。

【請求項 7】

害虫を防除する方法であって、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化合物又は請求項 6 に記載の組成物を当該害虫及び / 又はそれらの生息環境に作用させる、前記方法であって、ヒトの身体の外科的な処置、治療的な処置及び診断的な処置は除外される、方法。

【請求項 8】

10

20

30

40

50

害虫を防除するための、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化合物又は請求項 6 に記載の組成物の使用であって、ヒトの身体の外科的な処置、治療的な処置及び診断的な処置は除外される、使用。

【請求項 9】

ヒト又は動物の身体の外科的な処置、治療的な処置及び診断的な処置は除外される、請求項 7 に記載の方法又は請求項 8 に記載の使用。

【請求項 10】

植物の繁殖器官を保護するための、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化合物の使用。

【請求項 11】

農薬製剤であって、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の少なくとも 1 種類の化合物を、その農薬製剤の重量に基づいて 0.00000001 ~ 98 重量%の生物学的に有効な量で含んでおり、並びに、増量剤及び/又は界面活性剤も含んでいる、前記農薬製剤。

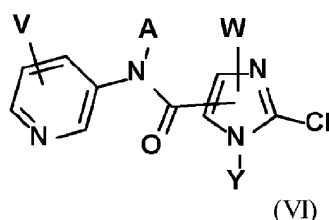
【請求項 12】

さらなる農薬活性化合物をさらに含んでいる、請求項 11 に記載の農薬製剤。

【請求項 13】

式 (VI)

【化 4】



〔式中、ラジカルは、請求項 1 ~ 5 の 1 項に記載されている意味を有している〕  
で表される中間体。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本出願は、新規ヘテロ環式化合物、それらを調製するための調製方法及び中間体、並びに、害虫 (animal pest) を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

【0002】

WO 2011/009804 A2 には、殺虫剤として使用することが可能なヘテロ環式化合物 (これは、とりわけ、イミダゾリルカルボキサミド類を包含する) が記載されている。しかしながら、そのイミダゾリル環がアミノ基で直接置換されているイミダゾリルカルボキサミド類は、記載されていない。WO 2011/009804 A2 の中に記載されているイミダゾリルカルボキサミド類が有している殺虫作用は、極めて弱い。

【0003】

現代の殺虫剤は、例えば、作用の程度、作用の持続性及び作用の範囲並びに可能性のある用途などに関して、多くの要求を満たさなくてはならない。毒性に関する問題、有益種及び花粉媒介者の保護に関する問題、環境特性に関する問題、施用量に関する問題、別の活性成分又は製剤助剤との組合せ可能性に関する問題は、活性成分を合成するのに必要とされる努力の問題と同様に、ある種の役割を果たす。ほんの僅かな要因を挙げれば、さらに、抵抗性も生じ得る。これら全ての理由のみにより、新規作物保護組成物の探求は、完結したものとは考えられ得ず、既知化合物と比較して少なくとも個々の態様に関して改善されている特性を有する新規化合物が絶えず求められている。

【先行技術文献】

【特許文献】



【 0 0 0 4 】

【特許文献 1】国際特許出願公開第 2 0 1 1 / 0 0 9 8 0 4 A 2 号

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【 0 0 0 5 】

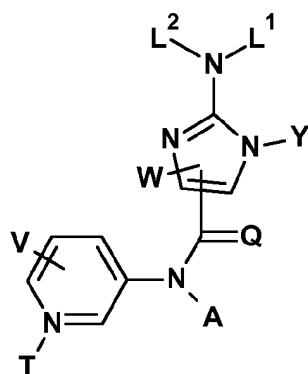
本発明の目的は、さまざまな局面下において殺有害生物剤 ( p e s t i c i d e ) のスペクトルを拡大させる化合物を提供することであった。

【課題を解決するための手段】

【 0 0 0 6 】

この目的、及び、明示的には示されていないが本明細書中で論じられている文脈から認識又は誘導され得るさらなる目的は、式 ( I )

【化 1】



(I)

【 0 0 0 7 】

〔式中 (実施形態 ( 0 ))、

Q は、酸素又は硫黄を表し；

V は、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

W は、水素、ハロゲン、アルキル、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

Y は、水素、シアノ、置換されていてもよいアルキル、アルケニル若しくはアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル (ここで、該シクロアルキルは、ヘテロ原子で中断されていてもよい)、置換されていてもよいシクロアルキルアルキル (ここで、該シクロアルキルアルキルは、ヘテロ原子で中断されていてもよい)、アリールアルキル又はヘタリールアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し；

A は、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル若しくはアルキニル及び置換されていてもよいシクロアルキル若しくはシクロアルキルアルキル (ここで、これらは、ヘテロ原子で中断されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し；

T は、酸素又は電子対を表し；

L<sup>1</sup> は、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル若しくはシクロアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル C ( O ) R<sup>2</sup>、C ( O ) N ( R<sup>3</sup> ) ( R<sup>4</sup> )、C ( O ) O R<sup>5</sup> 及び S O<sub>2</sub> R<sup>6</sup> を表し；

L<sup>2</sup> は、水素、N ( R<sup>3 a</sup> ) ( R<sup>4 a</sup> )、置換されていてもよいアルキル、アルケニル、アルキニル若しくはアルコキシ、置換されていてもよいシクロアルキル若しくはシクロアルキルアルキル (ここで、これらは、ヘテロ原子で中断されていてもよい) 及び置換されていてもよいアリール、アリールアルキル、ヘタリール若しくはヘタリールアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し；

又は、

L<sup>1</sup> と L<sup>2</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒に、3 ~ 7 個の環原子を有する置換されていてもよい飽和、部分的飽和又は芳香族のヘテロ環 (ここで、該環は、さらなる

10

20

30

40

50

ヘテロ原子で中断されていてもよい、及び／又は、1若しくは2のC=O基で中断されていてもよい)を表し；

R<sup>2</sup>は、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル若しくはアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいアリール若しくはヘタリール及び置換されていてもよいアリールアルキル若しくはヘタリールアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し；

R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>は、それぞれ互いに独立して、水素、置換されていてもよいアルキル、アルケニル若しくはアルキニル、置換されていてもよい飽和若しくは不飽和のシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、ヘタリール、アリールアルキル又はヘタリールアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し；

10

又は、

R<sup>3</sup>とR<sup>4</sup>は、一緒に、置換されていてもよい3～7員の脂肪族環(ここで、該環は、窒素原子、硫黄原子又は酸素原子を含んでいてもよい)を形成し；

R<sup>3a</sup>は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、アリール、ヘタリール、アリールアルキル若しくはヘタリールアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し；

R<sup>4a</sup>は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキルからなる群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカルC(O)R<sup>2</sup>、C(O)OR<sup>5</sup>及びSO<sub>2</sub>R<sup>6</sup>を表し；

R<sup>5</sup>は、置換されていてもよいアルキル、アルケニル若しくはアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル若しくはシクロアルキルアルキルを表し；

20

R<sup>6</sup>は、置換されていてもよいアルキル、アルケニル若しくはアルキニル、置換されていてもよいシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘタリール若しくはヘタリールアルキルからなる群から選択されるラジカルを表す]

で表される化合物及びそれらの塩を提供することによって達成される。

【発明を実施するための形態】

【0008】

式(I)で表される化合物において記載されているラジカルに関する好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲(1-1)を形成する。

30

【0009】

Qは、酸素又は硫黄を表し；

Vは、水素、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、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

Wは、水素、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、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

Yは、水素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-アルキル、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルケニル若しくはC<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-アルキニル(ここで、これらは、ハロゲン、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-S(O)<sub>n</sub>-又はシアノで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい)、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル(ここで、これは、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい)、直鎖又は分枝鎖のC<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-シクロアルキル-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル(ここで、これは、O、S(O)<sub>n</sub>、CO又はNR<sup>4a</sup>で互いに独立して1回又は2回中断されていてもよく、及び、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、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～4置換されていてもよい)、アリール-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル若しくはヘタリール-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル(ここで、これらは、ハロゲン、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-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>-アルキル-S(O)<sub>n</sub>-、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-ハロアルコキシ、C

40

50

$_1 - C_4$  - ハロアルキル -  $S(O)_n$  - 、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し；

Aは、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル(ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい) 及び $C_3 - C_6$  - シクロアルキル若しくは $C_3 - C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル(ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい) 及び $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル(ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい) 及び直鎖又は分枝鎖の $C_3 - C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル(ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し；

Tは、酸素又は電子対を表し；

$L^1$  は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル(ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい)、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル(ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $C(O)R^2$ 、 $C(O)N(R^3)(R^4)$ 、 $C(O)OR^5$  及び $SO_2R^6$ を表し；

$L^2$  は、水素、 $-N(R^{3a})(R^{4a})$ 、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - アルキニル若しくは $C_1 - C_4$  - アルコキシ(ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい)、直鎖又は分枝鎖の $C_3 - C_8$  - シクロアルキル若しくは $C_3 - C_8$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル(ここで、これらは、O、 $S(O)_n$ 、CO又は $NR^{4a}$ で互いに独立して1回又は2回中断されていてもよく、及び、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～4置換されていてもよい)、アリール、ヘタリール、アリールアルキル若しくはヘタリールアルキル(ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル -  $S(O)_n$  - 、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し；

又は、

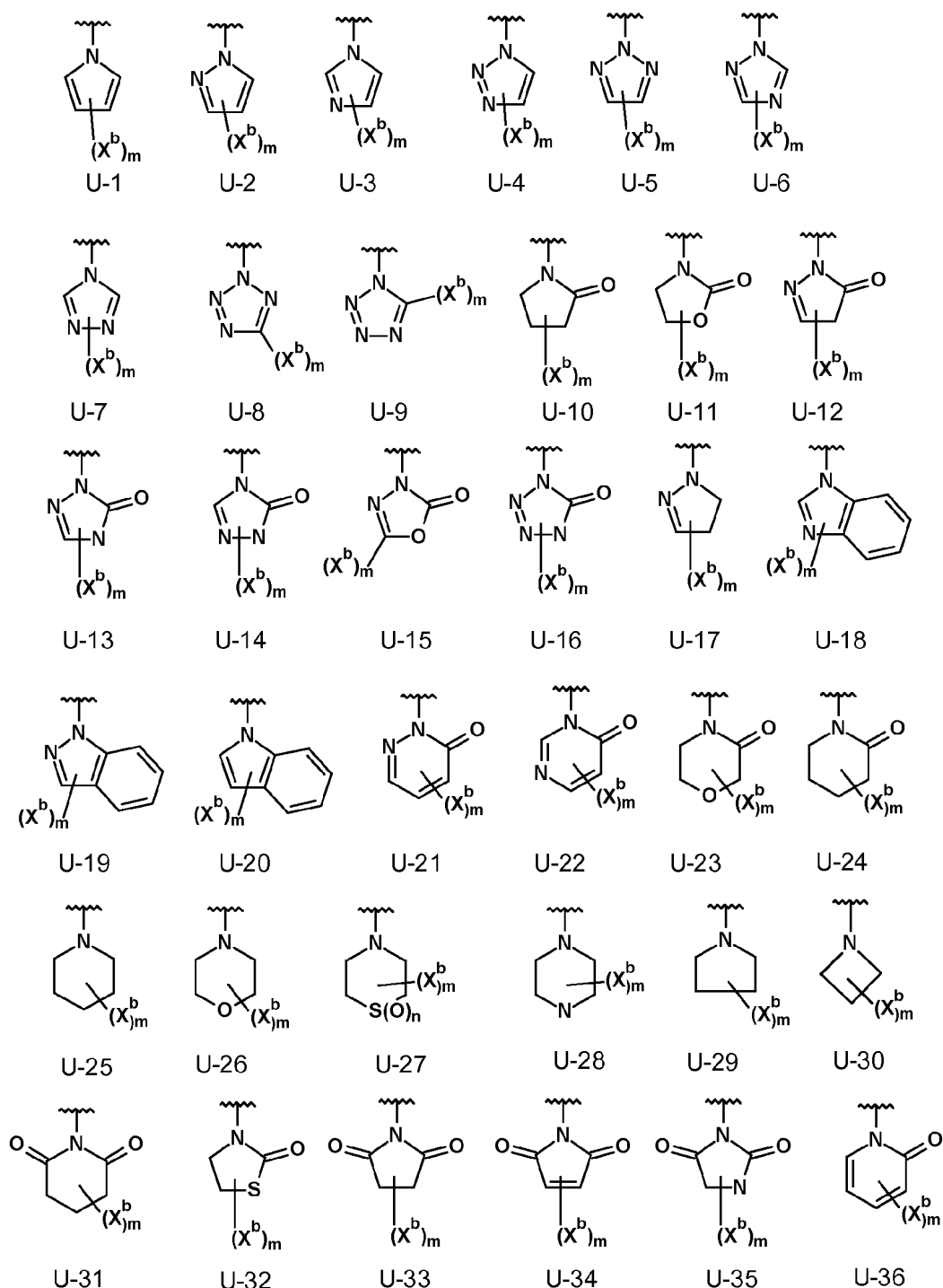
$L^1$  と  $L^2$  は、Nと一緒に、群U - 1～U - 36

10

20

30

## 【化 2】



## 【0010】

から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_5$  - ハロゲンアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、シアノ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - アルキニル、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  -、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルアミノカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルアミノ、アリール及びヘタリールからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、上記置換基アリール

及びヘタリールは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ及び $C_1 - C_4$ -アルキルチオからなる群から選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、並びに、ここで、U - 13、U - 14、U - 16、U - 28及びU - 35における環窒素原子は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキルオキシでは置換されず；

$R^2$  は、水素、 $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -アルケニル若しくは $C_3 - C_8$ -アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又は $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -で互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖のアリール- $C_1 - C_4$ -アルキル若しくはヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$R^3$ 、 $R^4$  は、互いに独立して、水素、 $C_1 - C_8$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -アルケニル若しくは $C_3 - C_8$ -アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又は $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -で互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖のアリール- $C_1 - C_4$ -アルキル若しくはヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$R^{3a}$  は、水素、 $C_1 - C_8$ -アルキル（ここで、これは、ハロゲン、シアノ又は $C_1 - C_4$ -アルコキシで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル又は $C_1 - C_4$ -アルコキシで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル- $S(O)_n$ -、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）及び直鎖又は分枝鎖のアリール- $C_1 - C_4$ -アルキル若しくはヘタリール- $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキル- $S(O)_n$ -、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

$R^{4a}$  は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル（ここで、これは、ハロゲン又は $C_1 - C_4$ -アルコキシで互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_6$ -シクロア

10

20

30

40

50

ルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル又は $C_1 - C_4$  - アルコキシで互いに独立して1～2置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し、並びに、ラジカル $C(O)R^2$ 、 $C(O)OR^5$ 及び $SO_2R^6$ を表し；

$R^5$ は、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_8$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又は $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - で互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）を表し；

10

$R^6$ は、 $C_1 - C_8$  - アルキル、 $C_3 - C_8$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_8$  - アルキニル（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又は $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - で互いに独立して1置換～多置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$  - シクロアルキル（ここで、これは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ又はシアノで互いに独立して1～2置換されていてもよい）、アリール若しくはヘタリール（ここで、これらは、ハロゲン、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル -  $S(O)_n$  - 、ニトロ又はシアノで互いに独立して1～3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

20

$m$ は、数0、1、2又は3を表し；

$n$ は、数0、1又は2を表す；

及び、それらの塩。

#### 【0011】

式(I)で表される化合物において記載されているラジカルに関する好ましいさらなる置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲(1-2)を形成し、ここで、

$Q$ 、 $V$ 、 $W$ 、 $Y$ 、 $A$ 、 $T$ 、 $L^1$ 、 $L^2$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $m$ 及び $n$ は、好ましい範囲(1-1)において定義されているとおりであり；及び、

30

$X^b$ は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_5$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、シアノ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_3 - C_6$  - アルキニル、 $C_1 - C_4$  - アルキル -  $S(O)_n$  - 、 $C_1 - C_4$  - アルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルアミノカルボニル、ジ - ( $C_1 - C_6$ ) - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルアミノ、アリール及びヘタリールからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、上記置換基アリール及びヘタリールは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_2 - C_6$  - アルケニル、 $C_2 - C_6$  - アルキニル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$  - ハロアルコキシ及び $C_1 - C_4$  - アルキルチオからなる群から選択される同一であるか又は異なっている置換基で1置換又は多置換されていてもよく、並びに、ここで、 $U-13$ 、 $U-14$ 、 $U-16$ 及び $U-28$ における環窒素原子はハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキルオキシでは置換されず；

40

又は、

$X^b$ は、 $C_2 - C_5$  - 炭素鎖（ここで、該炭素鎖は、 $N$ 、 $S$ 及び $O$ からなる群から選択される1個のヘテロ原子を含んでいてもよく、該炭素鎖は、環の隣接する2つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環、芳香族環、ヘテロ芳香族環又はヘテロ環式環を形成し、その場合、 $m$ は2に等しい）を表す。

50

## 【 0 0 1 2 】

式 ( I ) で表される化合物において記載されているラジカルに関する特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲 ( 2 - 1 ) を形成する。

## 【 0 0 1 3 】

Q は、酸素を表し；

V は、水素、フッ素、塩素、臭素、メチル及びエチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

W は、水素、フッ素、塩素、臭素、シアノ及びメチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

Y は、水素、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_4$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_4$  - アルキニル (ここで、これらは、フッ素、塩素、臭素、メトキシ又はエトキシで互いに独立して1 ~ 5置換されていてもよい) 及び $C_3 - C_6$  - シクロアルキル (ここで、これは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1 ~ 2置換されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し；

A は、水素、 $C_1 - C_6$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - アルケニル若しくは $C_3 - C_6$  - アルキニル (ここで、これらは、フッ素、塩素、臭素、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1 ~ 5置換されていてもよい) 及び $C_3 - C_6$  - シクロアルキル (ここで、これは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1 ~ 2置換されていてもよい) からなる群から選択されるラジカルを表し；

T は、電子対を表し；

$L^1$  と  $L^2$  は、Nと一緒に、群U - 1、U - 2、U - 3、U - 4、U - 5、U - 6、U - 7、U - 25、U - 26、U - 27、U - 28、U - 29 及び U - 30 から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_2$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$  - アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$  - アルキルカルボニルアミノ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 $Me - S(O)_n -$ 、 $Et - S(O)_n -$ 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル -  $S(O)_n -$ 、ジフルオロエチル -  $S(O)_n -$ 、トリフルオロエチル -  $S(O)_n -$ 、ニトロ又はシアノで1 ~ 3置換されていてもよく；

m は、数 0、1 又は 2 を表し；

n は、数 0、1 又は 2 を表す；

及び、それらの塩。

## 【 0 0 1 4 】

式 ( I ) で表される化合物において記載されているラジカルに関する好ましいさらなる置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲 ( 2 - 2 ) を形成し、ここで、

Q、V、W、Y、A、T、 $L^1$ 、 $L^2$ 、m 及び n は、好ましい範囲 ( 2 - 1 ) において定義されているとおりであり；及び、

$X^b$  は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、アミノ、 $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_3 - C_6$  - シクロアルキル、 $C_1 - C_2$  - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ、 $C_1 - C_4$  - ハロアルコキシ、 $C_3 - C_6$  - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$  - アルコキシ -  $C_1 - C_4$  - アルキル、 $C_1 - C_6$  - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$  - アルコキシカルボニル、 $C_1 - C_4$

10

20

30

40

50

- アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルカルボニルアミノ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、 $Me-S(O)_n-$ 、 $Et-S(O)_n-$ 、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、トリフルオロメチル- $S(O)_n$ 、ジフルオロエチル- $S(O)_n$ 、トリフルオロエチル- $S(O)_n$ 、ニトロ又はシアノで1~3置換されていてもよく；

又は、

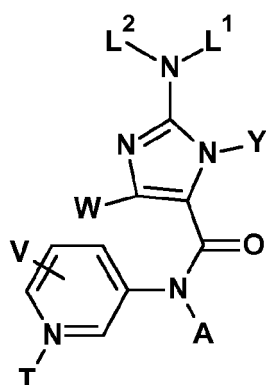
$X^b$ は、 $C_3 - C_5$ -炭素鎖（ここで、該炭素鎖は、環の隣接する2つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環を形成し、その場合、 $m$ は2に等しい）を表す。

10

#### 【0015】

式(I)で表される化合物において記載されているラジカルの中でも特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。イミダゾールラジカルにおけるカルボキサミド基の位置を考慮して、極めて特に好ましい構造(I-1)が得られる。それらの組合せは、好ましい範囲(3-1)を形成する。

#### 【化3】



(I-1)

20

#### 【0016】

Vは、水素、フッ素、塩素、メチル及びシアノからなる群から選択されるラジカルを表し；

30

Wは、水素、フッ素、塩素、臭素及びメチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

Yは、メチル、エチル、プロピル、アリル又はプロパルギル（ここで、これらは、フッ素、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1~3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

Aは、水素、及び、メチル、エチル、プロピル、アリル、プロパルギル若しくはシクロプロピル（ここで、これらは、フッ素、メトキシ、エトキシ又はシアノで互いに独立して1~3置換されていてもよい）からなる群から選択されるラジカルを表し；

Tは、電子対を表し；

40

$L^1$ と $L^2$ は、Nと一緒に、群U-1、U-2、U-3、U-4、U-5、U-6、U-7、U-25、U-26、U-27、U-29及びU-30から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$ は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、 $n$ -プロピル及びイソプロピル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、 $n$ -プロボキシ及びイソプロボキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メチル- $S(O)_n-$ 、エチル- $S(O)_n-$ 、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、メチルカルボニルアミノ又はフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフ

50



ルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ニトロ又はシアノで 1 ~ 3 置換されていてもよく；  
 m は、数 0、1 又は 2 を表し；  
 n は、数 0、1 又は 2 を表す；  
 及び、それらの塩。

【 0 0 1 7 】

イミダゾールラジカルにおけるカルボキサミド基の位置を考慮して、式 ( I ) から極めて特に好ましい構造 ( I - 1 ) が得られる。式 ( I - 1 ) で表される化合物において記載されているラジカルは極めて特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲 ( 3 - 2 ) を形成し、ここで、

V、W、Y、A、T、 $L^1$ 、 $L^2$ 、m 及び n は、好ましい範囲 ( 3 - 1 ) において定義されているとおりであり；及び、

$X^b$  は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、メチル、エチル、n - プロピル及びイソプロピル、シクロプロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n - プロポキシ及びイソプロポキシ、トリフルオロメトキシ、メトキシメチル、エトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、メチル - S ( O )<sub>n</sub> - 、エチル - S ( O )<sub>n</sub> - 、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、メチルアミノカルボニル、メチルカルボニルアミノ又はフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、臭素、メチル、エチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、ニトロ又はシアノで 1 ~ 3 置換されていてもよく；

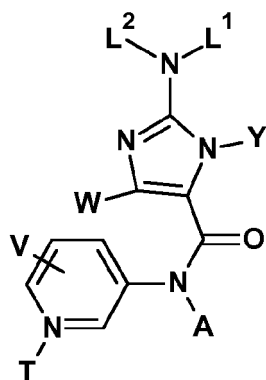
又は、

$X^b$  は、C<sub>3</sub> - C<sub>5</sub> - 炭素鎖 (ここで、該炭素鎖は、環の隣接する 2 つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環を形成し、その場合、m は 2 に等しい) を表す。

【 0 0 1 8 】

式 ( I - 1 ) で表される化合物において記載されているラジカルに関するとりわけ好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。該とりわけ好ましい置換基の組合せは、好ましい範囲 ( 4 - 1 ) を形成し、ここで、

【 化 4 】



(I-1)

【 0 0 1 9 】

V は、水素を表し；

W は、水素を表し；

Y は、水素、メチル、エチル、アリル及びプロパルギルからなる群から選択されるラジカルを表し；

A は、水素、メチル及びエチルからなる群から選択されるラジカルを表し；

T は、電子対を表し；

$L^1$  と  $L^2$  は、N と一緒に、群 U - 1、U - 2、U - 3、U - 6、U - 25、U - 26 及び U - 29 から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$  は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、メチル、エチル、n - プロピル及びイソプロピ

ル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、メチル又はメトキシで1～3置換されていてもよく；

mは、数0、1又は2を表す；

及び、それらの塩。

【0020】

式(I-1)で表される化合物において記載されているラジカルに関するとりわけ好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。該とりわけ好ましい置換基の組合せは、好ましい範囲(4-2)を形成し、ここで、

V、W、Y、T、 $L^1$ 、 $L^2$ 及びmは、好ましい範囲(4-1)において定義されているとおりであり；及び、

Aは、水素、メチル、エチル及びシクロプロピルからなる群から選択されるラジカルを表し；及び、

$X^b$ は、フッ素、塩素、臭素、シアノ、アミノ、メチル、エチル、n-プロピル及びイソプロピル、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、メチルチオ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し、ここで、フェニルは、フッ素、塩素、メチル又はメトキシで1～3置換されていてもよく；

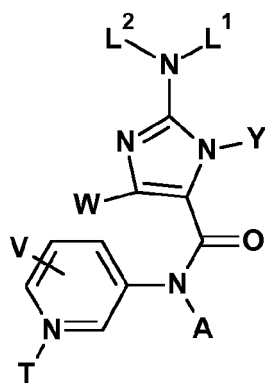
又は、

$X^b$ は、 $C_3 - C_4$ -炭素鎖(ここで、該炭素鎖は、環の隣接する2つの位置に結合しており、及び、該炭素鎖は、脂肪族環を形成し、その場合、mは2に等しい)を表す。

【0021】

式(I-1)で表される化合物において記載されているラジカルの中でも特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲(5-1)を形成する。

【化5】



(I-1),

【0022】

Vは、水素を表し；

Wは、水素を表し；

Yは、メチルを表し、

Aは、メチル又はエチルを表し；

Tは、電子対を表し；

$L^1$ と $L^2$ は、Nと一緒に、群U-1、U-2、U-3、U-6、U-25、U-26及びU-29から選択されるヘテロ環を表し；

$X^b$ は、塩素、シアノ、メチル、トリフルオロメチル、メチルチオ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し；

mは、数0、1又は2を表す；

及び、それらの塩。

【0023】

式 (I - 1) で表される化合物において記載されているラジカル of 極めて特に好ましい置換基又は範囲について、以下で説明する。それらの組合せは、好ましい範囲 (5 - 2) を形成し、ここで、

V、W、Y、T、 $L^1$ 、 $L^2$  及び m は、好ましい範囲 (5 - 1) において定義されているとおりであり；及び、

A は、メチル、エチル又はシクロプロピルを表し；及び、

$X^b$  は、塩素、シアノ、アミノ、メチル、イソプロピル、トリフルオロメチル、メチルチオ及びフェニルからなる群から選択されるラジカルを表し；  
又は、

$X^b$  は、 $-(CH_2)_3-$  (ここで、これは、環の隣接する 2 つの位置に結合しており、及び、これは、脂肪族環を形成し、その場合、m は 2 に等しい) を表す。

10

#### 【0024】

好ましい実施形態では、本発明は、式 (I) 又は式 (I - 1) [ 式中、

ラジカル Q、V、W、Y、A、T 及び n は、好ましい範囲 (1 - 1) 又は好ましい範囲 (1 - 2) 又は好ましい範囲 (2 - 1) 又は好ましい範囲 (2 - 2) 又は好ましい範囲 (3 - 1) 又は好ましい範囲 (3 - 2) 又は好ましい範囲 (4 - 1) 又は好ましい範囲 (4 - 2) 又は好ましい範囲 (5 - 1) 又は好ましい範囲 (5 - 2) において定義されているとおりであり；及び、

$L^1$ 、 $L^2$ 、 $X^b$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  及び m は、実施形態 (0) に記載されている意味を有する]

20

で表される化合物に関する。

#### 【0025】

好ましい実施形態では、本発明は、式 (I) 又は式 (I - 1) [ 式中、

ラジカル Q、V、W、Y、A、T 及び n は、実施形態 (0) 又は好ましい範囲 (2 - 1) 又は好ましい範囲 (2 - 2) 又は好ましい範囲 (3 - 1) 又は好ましい範囲 (3 - 2) 又は好ましい範囲 (4 - 1) 又は好ましい範囲 (4 - 2) 又は好ましい範囲 (5 - 1) 又は好ましい範囲 (5 - 2) において定義されているとおりであり；及び、

$L^1$ 、 $L^2$ 、 $X^b$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{3a}$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  及び m は、好ましい範囲 (1 - 1) 又は好ましい範囲 (1 - 2) に記載されている意味を有する]

で表される化合物に関する。

30

#### 【0026】

好ましい実施形態では、本発明は、式 (I) 又は式 (I - 1) [ 式中、

ラジカル Q、V、W、Y、A、T 及び n は、実施形態 (0 - 1) 又は実施形態 (0 - 2) 又は好ましい範囲 (1 - 1) 又は好ましい範囲 (1 - 2) 又は好ましい範囲 (3 - 1) 又は好ましい範囲 (3 - 2) 又は好ましい範囲 (4 - 1) 又は好ましい範囲 (4 - 2) 又は好ましい範囲 (5 - 1) 又は好ましい範囲 (5 - 2) において定義されているとおりであり；及び、

$L^1$ 、 $L^2$ 、 $X^b$  及び m は、好ましい範囲 (2 - 1) 又は好ましい範囲 (2 - 2) に記載されている意味を有する]

で表される化合物に関する。

40

#### 【0027】

好ましい実施形態では、本発明は、式 (I) 又は式 (I - 1) [ 式中、

ラジカル Q、V、W、Y、A、T 及び n は、実施形態 (0 - 1) 又は実施形態 (0 - 2) 又は好ましい範囲 (1 - 1) 又は好ましい範囲 (1 - 2) 又は好ましい範囲 (2 - 1) 又は好ましい範囲 (2 - 2) 又は好ましい範囲 (4 - 1) 又は好ましい範囲 (4 - 2) 又は好ましい範囲 (5 - 1) 又は好ましい範囲 (5 - 2) において定義されているとおりであり；及び、

$L^1$ 、 $L^2$ 、 $X^b$  及び m は、好ましい範囲 (3 - 1) 又は好ましい範囲 (3 - 2) に記載されている意味を有する]

で表される化合物に関する。

50

## 【 0 0 2 8 】

好ましい実施形態では、本発明は、式 ( I ) 又は式 ( I - 1 ) [ 式中、

ラジカル Q、V、W、Y、A、T 及び n は、実施形態 ( 0 - 1 ) 又は実施形態 ( 0 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 1 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 1 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 2 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 2 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 3 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 3 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 5 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 5 - 2 ) において定義されているとおりであり；及び、

$L^1$ 、 $L^2$ 、 $X^b$  及び m は、好ましい範囲 ( 4 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 4 - 2 ) に記載されている意味を有する]

で表される化合物に関する。

10

## 【 0 0 2 9 】

好ましい実施形態では、本発明は、式 ( I ) 又は式 ( I - 1 ) [ 式中、

ラジカル Q、V、W、Y、A、T 及び n は、実施形態 ( 0 - 1 ) 又は実施形態 ( 0 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 1 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 1 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 2 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 2 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 3 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 3 - 2 ) 又は好ましい範囲 ( 4 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 4 - 2 ) において定義されているとおりであり；及び、

$L^1$ 、 $L^2$ 、 $X^b$  及び m は、好ましい範囲 ( 5 - 1 ) 又は好ましい範囲 ( 5 - 2 ) に記載されている意味を有する]

で表される化合物に関する。

20

## 【 0 0 3 0 】

好ましい範囲 ( 1 - 1 ) 又は ( 1 - 2 ) において、別途示されていない限り、

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素の群から選択され、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素の群から選択され；

ヘタリール ( 「ヘテロアリール」と同義；これは、より大きな単位 (例えば、ヘタリールアルキル) の一部分としてのヘタリールを包含する ) は、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、1, 2, 3 - トリアゾリル、1, 2, 4 - トリアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾリル、1, 2, 4 - オキサジアゾリル、1, 3, 4 - オキサジアゾリル、1, 2, 5 - オキサジアゾリル、1, 2, 3 - チアジアゾリル、1, 2, 4 - チアジアゾリル、1, 3, 4 - チアジアゾリル、1, 2, 5 - チアジアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、1, 2, 3 - トリアジニル、1, 2, 4 - トリアジニル、1, 3, 5 - トリアジニル、ベンゾフリル、ベンゾイソフリル、ベンゾチエニル、ベンゾイソチエニル、インドリル、イソインドリル、インダゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイソチアゾリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、2, 1, 3 - ベンゾオキサジアゾール、キノリニル、イソキノリニル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、ベンゾトリアジニル、プリニル、プテリジニル及びインドリジニルからなる群から選択され；

30

ヘテロシクリルは、1 個若しくは 2 個の窒素原子及び / 又は 1 個の酸素原子及び / 又は 1 個の硫黄原子を含んでいる ( しかしながら、2 個の窒素原子は直接隣接することはできない ) 3 員、4 員、5 員又は 6 員の飽和環、例えば、アジリジニル、アゼチジニル、アゾリジニル、アジナニル、オキシラニル、オキセタニル、オキソラニル、オキサニル、ジオキサニル、チイラニル、チエタニル、チオラニル、チアニル及びテトラヒドロフリルなどを表す。

40

## 【 0 0 3 1 】

好ましい範囲 ( 2 - 1 ) 又は ( 2 - 2 ) において、別途示されていない限り、

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素を表し；

ヘタリール (これは、より大きな単位 (例えば、ヘタリールアルキル) の一部分としてのヘタリールを包含する) は、ピリジル、ピリミジニル、チアゾリル、オキサゾリル、ピラ

50

ゾリル、チエニル、フラニル、ベンジル、ピリジニルメチル及びチアゾリルメチルを表し；及び、

ヘテロシクリル（これは、より大きな単位（例えば、ヘテロシクリルアルキル）の一部分としてのヘテロシクリルを包含する）は、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は1個の酸素原子及び／又は1個の硫黄原子を含んでいる（しかしながら、2個の窒素原子は直接隣接することはできない）3員、4員又は5員の飽和又は不飽和の環、例えば、1 - アジリジニル若しくは2 - アジリジニル、2 - オキシラニル、2 - チイラニル、1 - アゼチジニル若しくは2 - アゼチジニル、2 - オキセタニル若しくは3 - オキセタニル、2 - チエタニル若しくは3 - チエタニル、1, 3 - ジオキセタン - 2 - イル、1 - ピロリジニル、2 - ピロリジニル若しくは3 - ピロリジニルなどを表す。

10

【0032】

好ましい範囲（3 - 1）又は（3 - 2）において、別途示されていない限り、

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素及びヨウ素を表し、好ましくは、フッ素、塩素及び臭素を表し；及び、

ヘテロシクリル（これは、より大きな単位（例えば、ヘテロシクリルアルキル）の一部分としてのヘテロシクリルを包含する）は、1個若しくは2個の窒素原子及び／又は1個の酸素原子及び／又は1個の硫黄原子を含んでいる（しかしながら、2個の窒素原子は直接隣接することはできない）3員又は4員の飽和又は不飽和の環、例えば、1 - アジリジニル若しくは2 - アジリジニル、2 - オキシラニル、2 - チイラニル、1 - アゼチジニル若しくは2 - アゼチジニル、2 - オキセタニル若しくは3 - オキセタニル、2 - チエタニル若しくは3 - チエタニル、又は、1, 3 - ジオキセタン - 2 - イルなどを表す。ハロゲンで置換されているラジカル（例えば、ハロアルキル）は、別途特定されていない限り、1ハロゲン化されているか、又は、可能な置換基の最大数までポリハロゲン化されている。ポリハロゲン化されている場合、該ハロゲン原子は同一であっても又は異なってもよい。この場合、ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素であり、特に、フッ素、塩素又は臭素である。

20

【0033】

飽和又は不飽和の炭化水素ラジカル（例えば、アルキル又はアルケニル）は、それぞれ、可能である場合は、直鎖又は分枝鎖であることができ、このことは、例えばアルコキシにおける場合のように、ヘテロ原子と組み合わされている場合も包含する。

30

【0034】

別途示されていない限り、置換されていてもよいラジカルは、1置換又は多置換されることができ、ここで、多置換の場合における該置換基は、同一であっても又は異なってもよい。

【0035】

式（I）で表される化合物において、Tが酸素を表す場合、これらの化合物はN - オキシドとして存在している。

【0036】

式（I）で表される化合物において、Tが電子対を表す場合、これらの化合物はピリジンとして存在している。

40

【0037】

概括的に与えられているか又は好ましい範囲内において記載されているラジカルの定義又は説明は、対応するように、最終生成物に当てはまり、並びに、出発物質及び中間体に当てはまる。ラジカルについてのこれらの定義は、必用に応じて互いに組み合わせることが可能であり、即ち、それぞれの好ましい範囲の間の組合せを包含する。

【0038】

本発明によれば、好ましいのは、好ましいもの（好ましい範囲（1 - 1）又は（1 - 2））として上記で記載されている意味の組合せを含んでいる式（I）で表される化合物の使用である。

【0039】

50

本発明によれば、特に好ましいのは、特に好ましいもの（好ましい範囲（２－１）又は（２－２））として上記で記載されている意味の組合せを含んでいる式（Ⅰ）で表される化合物の使用である。

【００４０】

本発明によれば、極めて特に好ましいのは、極めて特に好ましいもの（好ましい範囲（３－１）又は（３－２））として上記で記載されている定義の組合せを含んでいる式（Ⅰ）で表される化合物の使用である。

【００４１】

本発明によれば、とりわけ好ましいのは、極めて特に好ましいもの（好ましい範囲（４－１）又は（４－２））として上記で記載されている定義の組合せを含んでいる式（Ⅰ）で表される化合物の使用である。

10

【００４２】

本発明によれば、一層さらに好ましいのは、極めて特に好ましいもの（好ましい範囲（５－１）又は（５－２））として上記で記載されている定義の組合せを含んでいる式（Ⅰ）で表される化合物の使用である。

【００４３】

以下において、式（Ⅰ）で表される化合物に関する記述は、もちろん、式（Ⅰ）に包含される式（Ⅰ－１）で表される化合物にも当てはまる。

【００４４】

#### 異性体

20

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

【００４５】

#### 方法及び使用

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

30

【００４６】

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

【００４７】

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

【００４８】

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

40

【００４９】

本特許出願に関連して、用語「衛生学（hygiene）」は、疾患（特に、感染症）を予防することことを目的とする任意の全ての手段、準備及び方法、並びに、ヒト及び動物の健康を保護するのに及び／又は環境を保護するのに及び／又は清潔を維持するのに役

50

立つ任意の全ての手段、準備及び方法を意味するものと理解されるべきである。本発明によれば、これには、特に、きれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段、例えば、繊維又は硬質表面（特に、ガラス製、木製、コンクリート製、磁器製、セラミック製、プラスチック製の表面、又は、金属（類）製の表面）を衛生害虫及び／又はその分泌物が存在していない状態に維持するための、それらをきれいにするための手段、消毒するための手段及び滅菌するための手段が包含される。これに関連して、ヒト又は動物の身体に対して施される外科的又は治療的な処置方法、及び、ヒト又は動物の身体に対してなされる診断方法は、本発明による保護の範囲から除外される。

#### 【 0 0 5 0 】

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

#### 【 0 0 5 1 】

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

#### 【 0 0 5 2 】

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

#### 【 0 0 5 3 】

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

節足動物門の害虫、特に、クモ綱（*Arachnida*）の、例えば、アカルス属種（*Acarus* spp.）、例えば、アカルス・シロ（*Acarus siro*）、アケリア・クコ（*Aceria kuko*）、アケリア・シェルドニ（*Aceria sheldoni*）、アクロプス属種（*Aculops* spp.）、アクルス属種（*Aculus* spp.）、例えば、アクルス・フォクケウイ（*Aculus fockeui*）、アクルス・シュレクテンダリ（*Aculus schlechtendali*）、アンブリオンマ属種（*Amblyomma* spp.）、アムフィテトラニクス・ビエネンシス（*Amphitetranychus viennensis*）、アルガス属種（*Argas* spp.）、ボオフィルス属種（*Boophilus* spp.）、ブレビバルプス属種（*Brevipalpus* spp.）、例えば、ブレビバルプス・ホエニシス（*Brevipalpus phoenicis*）、ブリオピア・グラミヌム（*Bryobia graminum*）、ブリオピア・プラエチオサ（*Bryobia praetiosa*）、セントロロイデス属種（*Centruroides* spp.）、コリオプテス属種（*Choriotptes* spp.）、デルマニクス・ガリナエ（*Dermanyssus gallinae*）、デルマトファゴイデス・プテロニシヌス（*Dermatophagoides pteronyssinus*）、デルマトファゴイデス・ファリナエ（*Dermatophagoides farinae*）、デルマセントロ属種（*Dermacentor* spp.）、エオテトラニクス属種（*Eotetranychus* spp.）、例えば、エオテトラニクス・ヒコリアエ（*Eotetranychus*

10

20

30

40

50

s h i c o r i a e)、エピトリメルス・ピリ (E p i t r i m e r u s p y r i)、  
 エウテトラニクス属種 (E u t e t r a n y c h u s s p p.)、例えば、エウテ  
 ラニクス・バンクシ (E u t e t r a n y c h u s b a n k s i)、エリオフィエス属  
 種 (E r i o p h y e s s p p.)、例えば、エリオフィエス・ピリ (E r i o p h y  
 e s p y r i)、グリシファグス・ドメスチクス (G l y c y p h a g u s d o m e  
 s t i c u s)、ハロチデウス・デストルクトル (H a l o t y d e u s d e s t r u  
 c t o r)、ヘミタロソネムス属種 (H e m i t a r s o n e m u s s p p.)、例え  
 ば、ヘミタロソネムス・ラツス (H e m i t a r s o n e m u s l a t u s) (=ポリ  
 ファゴタルソネムス・ラツス (P o l y p h a g o t a r s o n e m u s l a t u s)  
 )、ヒアロンマ属種 (H y a l o m m a s p p.)、イキシデス属種 (I x o d e s  
 s p p.)、ラトロデクツス属種 (L a t r o d e c t u s s p p.)、ロキソスケ  
 レス属種 (L o x o s c e l e s s p p.)、ネウトロムビクラ・アウツムナリス (N e  
 u t r o m b i c u l a a u t u m n a l i s)、ヌフェルサ属種 (N u p h e r s a  
 s p p.)、オリゴニクス属種 (O l i g o n y c h u s s p p.)、例えば、オリ  
 ゴニクス・コフエアエ (O l i g o n y c h u s c o f f e a e)、オリゴニクス・コ  
 ニフェラルム (O l i g o n y c h u s c o n i f e r a r u m)、オリゴニクス・イ  
 リシス (O l i g o n y c h u s i l i c i s)、オリゴニクス・インジクス (O l i  
 g o n y c h u s i n d i c u s)、オリゴニクス・マンギフェルス (O l i g o n y  
 c h u s m a n g i f e r u s)、オリゴニクス・プラテンシス (O l i g o n y c h  
 u s p r a t e n s i s)、オリゴニクス・プニカエ (O l i g o n y c h u s p u  
 n i c a e)、オリゴニクス・イオテルシ (O l i g o n y c h u s y o t h e r s i  
 )、オルニトドルス属種 (O r n i t h o d o r u s s p p.)、オルニトニス属種  
 (O r n i t h o n y s s u s s p p.)、パノニクス属種 (P a n o n y c h u s  
 s p p.)、例えば、パノニクス・シトリ (P a n o n y c h u s c i t r i) (=メ  
 タテトラニクス・シトリ (M e t a t e t r a n y c h u s c i t r i))、パノニク  
 ス・ウルミ (P a n o n y c h u s u l m i) (=メタテトラニクス・ウルミ (M e t  
 a t e t r a n y c h u s u l m i))、フィロコプトルタ・オレイボラ (P h y l l  
 o c o p t r u t a o l e i v o r a)、プラチテトラニクス・ムルチジギツリ (P l a  
 t y t e t r a n y c h u s m u l t i d i g i t u l i)、ポリファゴタルソネム  
 ス・ラツス (P o l y p h a g o t a r s o n e m u s l a t u s)、プソロプテス属  
 種 (P s o r o p t e s s p p.)、リピセファルス属種 (R h i p i c e p h a l u  
 s s p p.)、リゾグリフス属種 (R h i z o g l y p h u s s p p.)、サルコプ  
 テス属種 (S a r c o p t e s s p p.)、スコルピオ・マウルス (S c o r p i o  
 m a u r u s)、ステネオタルソネムス属種 (S t e n e o t a r s o n e m u s s p  
 p.)、ステネオタルソネムス・スピッキ (S t e n e o t a r s o n e m u s s p i  
 n k i)、タルソネムス属種 (T a r s o n e m u s s p p.)、例えば、タルソネム  
 ス・コンフス (T a r s o n e m u s c o n f u s u s)、タルソネムス・パリズス  
 (T a r s o n e m u s p a l l i d u s)、テトラニクス属種 (T e t r a n y c h  
 u s s p p.)、例えば、テトラニクス・カナデンシス (T e t r a n y c h u s c  
 a n a d e n s i s)、テトラニクス・シンナバリヌス (T e t r a n y c h u s c i  
 n n a b a r i n u s)、テトラニクス・ツルケスタニ (T e t r a n y c h u s t u  
 r k e s t a n i)、テトラニクス・ウルチカエ (T e t r a n y c h u s u r t i c  
 a e)、トロムビクラ・アルフレズゲシ (T r o m b i c u l a a l f r e d d u g e  
 s i)、バエジョビス属種 (V a e j o v i s s p p.)、バサテス・リコペルシシ (V  
 a s a t e s l y c o p e r s i c i) ;

ムカデ綱 (C h i l o p o d a) の、例えば、ゲオフィルス属種 (G e o p h i l u s  
 s p p.)、スクチゲラ属種 (S c u t i g e r a s p p.) ;

トビムシ目 (C o l l e m b o l a) 又はトビムシ綱の、例えば、オニキウルス・アル  
 マツス (O n y c h i u r u s a r m a t u s) ; スミンツルス・ビリジス (S m i  
 n t h u r u s v i r i d i s) ;

10

20

30

40

50



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

昆虫綱 (Insecta) の、例えば、ゴキブリ目 (Blattodea) の、例えば、ブラッタ・オリエンタリス (Blatta orientalis)、ブラッテラ・アサヒナイ (Blattella asahinai)、ブラッテラ・ゲルマニカ (Blattella germanica)、レウコファエ・マデラエ (Leucophaea maderae)、ロボプテラ・デシピエンス (Loboptera decipiens)、ネオスチロピガ・ロムビフォリア (Neostylopyga rhombifolia)、パンクロラ属種 (Panchlora spp.)、パルコブラッタ属種 (Parcoblatta spp.)、ペリプラネタ属種 (Periplaneta spp.)、例えば、ペリプラネタ・アメリカナ (Periplaneta americana)、ペリプラネタ・アウストララシアエ (Periplaneta australasiae)、ピクノセルス・スリナメンシス (Pycnoscelus surinamensis)、スベラ・ロンギパルパ (Supella longipalpa) ;

コウチュウ目 (Coleoptera) の、例えば、アカリンマ・ビタツム (Acalymma vittatum)、アcantセリデス・オブテクツス (Acanthoscelides obtectus)、アドレツス属種 (Adoretus spp.)、アエチナ・ツミダ (Aethina tumida)、アゲラスチカ・アルニ (Agelastica alni)、アグリオテス属種 (Agriotes spp.)、例えば、アグリオテス・リンネアツス (Agriotes linneatus)、アグリオテス・マンクス (Agriotes mancus)、アルフィトビウス・ジアペリヌス (Alphitobius diaperinus)、アムフィマロン・ソルスチチアリス (Amphimallon solstitialis)、アノビウム・プンクタツム (Anobium punctatum)、アノプロホラ属種 (Anoplophora spp.)、アントノムス属種 (Anthonomus spp.)、例えば、アントノムス・グランジス (Anthonomus grandis)、アントレヌス属種 (Anthrenus spp.)、アピオン属種 (Apion spp.)、アポゴニア属種 (Apogonia spp.)、アトマリア属種 (Atomaria spp.)、例えば、アトマリア・リネアル (Atomaria linearis)、アタゲヌス属種 (Attagenus spp.)、バリス・カエルレセンス (Baris caerulescens)、ブルキジウス・オブテクツス (Bruchidius obtectus)、ブルクス属種 (Bruchus spp.)、例えば、ブルクス・ピソルム (Bruchus pisorum)、ブルクス・ルフイマヌス (Bruchus rufimanus)、カッシダ属種 (Cassida spp.)、セロトマ・トリフルカタ (Cerotoma trifurcata)、セウトリンクス属種 (Ceutorrhynchus spp.)、例えば、セウトリンクス・アシミリス (Ceutorrhynchus assimilis)、セウトリンクス・クアドリデンス (Ceutorrhynchus quadridens)、セウトリンクス・ラパエ (Ceutorrhynchus rapae)、カエトクネマ属種 (Chaetocnema spp.)、例えば、カエトクネマ・コンフィニス (Chaetocnema confinis)、カエトクネマ・デンチクラタ (Chaetocnema denticulata)、カエトクネマ・エクチパ (Chaetocnema ectypa)、クレオヌス・メンジクス (Cleonus mendicus)、コノデルス属種 (Conoderus spp.)、コスモポリテス属種 (Cosmopolites spp.)、例えば、コスモポリテス・ソルジズス (Cosmopolites sordidus)、コステリトラ・ゼアランジカ (Costelytra zealandica)、クテニセラ属種 (Ctenicera spp.)、クルクリオ属種 (Curculio spp.)、例えば、クルクリオ・カリヤエ (Curculio caryae)、クルクリオ・カリヤトリベス (Curculio caryatrypes)、クルクリオ・オブツスス (C

10

20

30

40

50

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

)、メラノツス属種 (*Melanotus* spp.)、例えば、メラノツス・ロングルス・オレゴネンシス (*Melanotus longulus oregonensis*)、メリゲテス・アエネウス (*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属種 (*Melolontha* spp.)、例えば、メロロンタ・メロロンタ (*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属種 (*Migdolus* spp.)、モノカムス属種 (*Monochamus* spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス (*Naupactus xanthographus*)、ネクロビア属種 (*Necrobia* spp.)、ネオガレルセラ属種 (*Neogalerucella* spp.)、ニプツス・ホロレウクス (*Niptus hololeucus*)、オリクテス・リノセロス (*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス (*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファグス・オリザエ (*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス属種 (*Otiorhynchus* spp.)、例えば、オチオリンクス・クリブリコリス (*Otiorhynchus cribricollis*)、オチオリンクス・リグスチシ (*Otiorhynchus ligustici*)、オチオリンクス・オバツス (*Otiorhynchus ovatus*)、オチオリンクス・ルゴソストリアルス (*Otiorhynchus rugosostriatus*)、オチオリンクス・スルカツス (*Otiorhynchus sulcatus*)、オウレマ属種 (*Oulema* spp.)、例えば、オウレマ・メラノプス (*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリザエ (*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジユクンダ (*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ (*Phaedon cochleariae*)、フィロファガ属種 (*Phyllophaga* spp.)、フィロファガ・ヘレリ (*Phyllophaga helleri*)、フィロトレタ属種 (*Phyllotreta* spp.)、例えば、フィロトレタ・アルモラシアエ (*Phyllotreta armoraciae*)、フィロトレタ・プシラ (*Phyllotreta pusilla*)、フィロトレタ・ラモサ (*Phyllotreta ramosa*)、フィロトレタ・ストリオラタ (*Phyllotreta striolata*)、ポピリア・ジャポニカ (*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属種 (*Premnotrypes* spp.)、プロステファヌス・トルンカツス (*Prostephanus truncatus*)、プシリオデス属種 (*Psylliodes* spp.)、例えば、プシリオデス・アフニス (*Psylliodes affinis*)、プシリオデス・クリソセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プシリオデス・プンクツラタ (*Psylliodes punctulata*)、プチヌス属種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、リゾペルタ・ドミニカ (*Rhizopertha dominica*)、リンコホルス属種 (*Rhynchophorus* spp.)、リンコホルス・フェルギネウス (*Rhynchophorus ferrugineus*)、リンコホルス・パルマルム (*Rhynchophorus palmarum*)、シノキシロン・ペルホランス (*Sinoxylon perforans*)、シトフィルス属種 (*Sitophilus* spp.)、例えば、シトフィルス・グラナリウス (*Sitophilus granarius*)、シトフィルス・リネアリス (*Sitophilus linearis*)、シトフィルス・オリザエ (*Sitophilus oryzae*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノホルス属種 (*Sphenophorus* spp.)、ステゴビウム・パニセウム (*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属種 (*Sternechus* spp.)、例えば、ステルネクス・パルダツス (*Sternechus paludatus*)、シムフィレテス属種 (*Symphyletes* spp.)、タニメクス属種 (*Tanymecus* spp.)、例えば、タニメクス・ジラチコリス (*Tanymecus dilaticollis*)、タニメクス・インジクス (*Tanymecus indicus*)、タニメクス・パ

リアツス (*Tanymericus palliatus*)、テネブリオ・モリトル (*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス (*Tenebrio ides mauretanicus*)、トリボリウム属種 (*Tribolium* spp.)、例えば、トリボリウム・アウダキス (*Tribolium audax*)、トリボリウム・カスタネウム (*Tribolium castaneum*)、トリボリウム・コンフスム (*Tribolium confusum*)、トロゴデルマ属種 (*Trogoderma* spp.)、チキウス属種 (*Tychius* spp.)、キシロトレクス属種 (*Xylotrechus* spp.)、ザブルス属種 (*Zabrus* spp.)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebriooides*) ;

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

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

10

20

30

40

50

ura)、デリア・ラジクム(*Delia radicum*)、デルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属種(*Drosophila* spp.)、例えば、ドロソフィラ・メラノガステル(*Drosophila melanogaster*)、ドロソフィラ・スズキイ(*Drosophila suzukii*)、エキノクネムス属種(*Echinocnemus* spp.)、エウレイア・ヘラクレイ(*Euleia heraclei*)、ファンニア属種(*Fannia* spp.)、ガステロフィルス属種(*Gasterophilus* spp.)、グロッシナ属種(*Glossina* spp.)、ハエマトポタ属種(*Haematopota* spp.)、ヒドレリア属種(*Hydrellia* spp.)、ヒドレリア・グリセオラ(*Hydrellia griseola*)、ヒレミア属種(*Hylemya* spp.)、ヒツポドスカ属種(*Hippobosca* spp.)、ヒポデルマ属種(*Hypoderma* spp.)、リリオミザ属種(*Liriomyza* spp.)、例えば、リリオミザ・ブラシカエ(*Liriomyza brassicae*)、リリオミザ・フイドブレシス(*Liriomyza huidobrensis*)、リリオミザ・サチバエ(*Liriomyza sativae*)、ルシリア属種(*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・クプリナ(*Lucilia cuprina*)、ルトゾミヤ属種(*Lutzomyia* spp.)、マンソニア属種(*Mansonia* spp.)、ムスカ属種(*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・ドメスチカ(*Musca domestica*)、ムスカ・ドメスチカ・ビシナ(*Musca domestica vicina*)、オエストルス属種(*Oestrus* spp.)、オシネラ・フリト(*Oscinella frit*)、パラタニタルス属種(*Paratanytarsus* spp.)、パララウテルボルニエラ・スブシンクタ(*Paralauterborniella subcincta*)、ペゴミア又はペゴミヤ属種(*Pegomya* or *Pegomyia* spp.)、例えば、ペゴミア・ベタエ(*Pegomya betae*)、ペゴミア・ヒオシアミ(*Pegomya hyoscyami*)、ペゴミア・ルビボラ(*Pegomya rubivora*)、フレボトムス属種(*Phlebotomus* spp.)、ホルビア属種(*Phorbia* spp.)、ホルミア属種(*Phormia* spp.)、ピオフィラ・カセイ(*Piophilina casei*)、プラチパレア・ポエシロプテラ(*Platyparea poeciloptera*)、プロジプロシス属種(*Prodiptosis* spp.)、プシラ・ロサエ(*Psila rosae*)、ラゴレチス属種(*Rhagoletis* spp.)、例えば、ラゴレチス・シングラタ(*Rhagoletis cingulata*)、ラゴレチス・コムプレタ(*Rhagoletis completa*)、ラゴレチス・ファウスタ(*Rhagoletis fausta*)、ラゴレチス・インジフェレンス(*Rhagoletis indifferens*)、ラゴレチス・メンダキス(*Rhagoletis mendax*)、ラゴレチス・ボモネラ(*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属種(*Sarcophaga* spp.)、シムリウム属種(*Simulium* spp.)、例えば、シムリウム・メリジオナレ(*Simulium meridionale*)、ストモキス属種(*Stomoxys* spp.)、タバヌス属種(*Tabanus* spp.)、テタノポプス属種(*Tetanops* spp.)、チブラ属種(*Tipula* spp.)、例えば、チブラ・パルドサ(*Tipula paludosa*)、チブラ・シムプレキス(*Tipula simplex*)、トキシトリパナ・クルビカウダ(*Toxotrypana curvicauda*) ;

カメムシ目(*Hemiptera*)の、例えば、アシジア・アカシアエバイレイアナエ(*Acizzia acaciaebaileyanae*)、アシジア・ドドナエアエ(*Acizzia dodonaeae*)、アシジア・ウンカトイデス(*Acizzia uncatoides*)、アクリダ・ツリタ(*Acrida turrita*)、アシルトシポン属種(*Acyrtosiphon* spp.)、例えば、アシルトシホン・ピスム(*Acyrtosiphon pisum*)、アクロゴニア属種(*Acrogonia* spp.)、アエネオラミア属種(*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ

10

20

30

40

50

属種 (*Agonoscena* spp.)、アレウロカンツス属種 (*Aleurocanthus* spp.)、アレイロデス・プロレテラ (*Aleyrodes proletella*)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロコス (*Aleurothrixus floccosus*)、アロカリダラ・マライエンシス (*Allocaridara malayensis*)、アムラスカ属種 (*Amrasca* spp.)、例えば、アムラスカ・ビグツラ (*Amrasca bigutulla*)、アムラスカ・デバスタンス (*Amrasca devastans*)、アヌラフィス・カルズイ (*Anuraphis cardui*)、アオニジエラ属種 (*Aonidiella* spp.)、例えば、アオニジエラ・アウランチイ (*Aonidiella aurantii*)、アオニジエラ・シトリナ (*Aonidiella citrina*)、アオニジエラ・イノルナタ (*Aonidiella inornata*)、アフアノスチグマ・ピリ (*Aphanostigma piri*)、アフイス属種 (*Aphis* spp.)、例えば、アフイス・シトリコラ (*Aphis citricola*)、アフイス・クラシボラ (*Aphis craccivora*)、アフイス・ファバエ (*Aphis fabae*)、アフイス・ホルベシ (*Aphis forbesi*)、アフイス・グリシネス (*Aphis glycines*)、アフイス・ゴシパイ (*Aphis gossypii*)、アフイス・ヘデラエ (*Aphis hederiae*)、アフイス・イリノイセンシス (*Aphis illinoensis*)、アフイス・ミドレトニ (*Aphis middletoni*)、アフイス・ナスツルチイ (*Aphis nasturtii*)、アフイス・ネリイ (*Aphis nerii*)、アフイス・ポミ (*Aphis pomi*)、アフイス・スピラエコラ (*Aphis spiraeicola*)、アフイス・ビブルニフィラ (*Aphis viburniphila*)、アルボリジア・アピカリス (*Arboridia apicalis*)、アリタイニラ属種 (*Arytainilla* spp.)、アスピジエラ属種 (*Aspidiella* spp.)、アスピジオツス属種 (*Aspidiotus* spp.)、例えば、アスピジオツス・ネリイ (*Aspidiotus nerii*)、アタヌス属種 (*Atanus* spp.)、アウラコルトム・ソラニ (*Aulacorthum solani*)、ベミシア・タバシ (*Bemisia tabaci*)、ブラストプシラ・オッシデンタリス (*Blastopsylla occidentalis*)、ボレイオグリカスピス・メラレウカエ (*Boreioglycaspis melaleucae*)、ブラキカウズス・ヘリクリシ (*Brachycaudus helichrysi*)、ブラキコルス属種 (*Brachycolus* spp.)、ブレビコリネ・ブラシカエ (*Brevicoryne brassicae*)、カコプシラ属種 (*Cacopsylla* spp.)、例えば、カコプシラ・ピリコラ (*Cacopsylla pyricola*)、カリギボナ・マルギナタ (*Calligypona marginata*)、カプリニア属種 (*Capulinia* spp.)、カルネオセファラ・フルギダ (*Carneocephala fulgida*)、セラトバクナ・ラニゲラ (*Ceratovacuna lanigera*)、セルコピダエ (*Cercopidae*)、セロブラステス属種 (*Ceroplastes* spp.)、カエトシホン・フラガエホリイ (*Chaetosiphon fragaefolii*)、キオナスピス・テガレンシス (*Chionaspis tegalensis*)、クロリタ・オヌキイ (*Chlorita onukii*)、コンドラクリス・ロセア (*Chondracris rosea*)、クロマフィス・ジュグランジコラ (*Chromaphis juglandicola*)、クリソムファルス・アオニズム (*Chrysomphalus aonidum*)、クリソムファルス・フィクス (*Chrysomphalus ficus*)、シカズリナ・ムビラ (*Cicadulina mbila*)、コッコミチルス・ハリイ (*Coccomytilus halli*)、コックス属種 (*Coccus* spp.)、例えば、コックス・ヘスペリズム (*Coccus hesperidum*)、コックス・ロングルス (*Coccus longulus*)、コックス・プセウドマグノリアルム (*Coccus pseudomagnoliarum*)、コックス・ビリジス (*Coccus vir*

*idris*)、クリプトミズス・リビス(*Cryptomyzus ribis*)、クリプトネオサ属種(*Cryptoneossa* spp.)、クテナリタイナ属種(*Ctenarytaina* spp.)、ダルブルス属種(*Dalbulus* spp.)、ジアレウロデス・キテンデニ(*Dialeurodes chittendeni*)、ジアレウロデス・シトリ(*Dialeurodes citri*)、ジアホリナ・シトリ(*Diaphorina citri*)、ジアスピス属種(*Diaspis* spp.)、ジウラフィス属種(*Diuraphis* spp.)、ドラリス属種(*Doralis* spp.)、ドロシカ属種(*Drosicha* spp.)、ジサフィス属種(*Dysaphis* spp.)、例えば、ジサフィス・アピイホリア(*Dysaphis apiifolia*)、ジサフィス・プランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジサフィス・ツリパエ(*Dysaphis tulipae*)、ジスミコックス属種(*Dysmicoccus* spp.)、エムポアスカ属種(*Empoasca* spp.)、例えば、エムポアスカ・アブルプタ(*Empoasca abrupta*)、エムポアスカ・ファバエ(*Empoasca fabae*)、エムポアスカ・マリグナ(*Empoasca maligna*)、エムポアスカ・ソラナ(*Empoasca solana*)、エムポアスカ・ステベンシ(*Empoasca stevensi*)、エリオソマ属種(*Eriosoma* spp.)、例えば、エリオソマ・アメリカヌム(*Eriosoma americanum*)、エリオソマ・ラニゲルム(*Eriosoma lanigerum*)、エリオソマ・ピリコラ(*Eriosoma pyricola*)、エリトロネウラ属種(*Erythroneura* spp.)、エウカリプトリマ属種(*Eucalyptolyma* spp.)、エウフィルラ属種(*Euphyllura* spp.)、エウセリス・ビロバツス(*Euscelis bilobatus*)、フェリシア属種(*Ferrisia* spp.)、フィオリニア属種(*Fiorinia* spp.)、フルカスピス・オセアニカ(*Furcaspis oceanica*)、ゲオコックス・コフェアエ(*Geococcus coffeae*)、グリカスピス属種(*Glycaspis* spp.)、ヘテロプシラ・クバナ(*Heteropsylla cubana*)、ヘテロプシラ・スピヌロサ(*Heteropsylla spinulosa*)、ホマロジスカ・コアグラタ(*Homalodisca coagulata*)、ヒアロプテルス・アルンジニス(*Hyalopterus arundinis*)、ヒアロプテルス・プルニ(*Hyalopterus pruni*)、イセリア属種(*Icerya* spp.)、例えば、イセリア・ブルカシ(*Icerya purchasi*)、イジオセルス属種(*Idiocerus* spp.)、イジオスコプス属種(*Idioscopus* spp.)、ラオデルファキス・ストリアテルス(*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属種(*Lecanium* spp.)、例えば、レカニウム・コルニ(*Lecanium corni*) (= パルテノレカニウム・コルニ(*Parthenolecanium corni*))、レピドサフェス属種(*Lepidosaphes* spp.)、例えば、レピドサフェス・ウルミ(*Lepidosaphes ulmi*)、リパフィス・エリシミ(*Lipaphis erysimi*)、ロホレウカスピス・ジャポニカ(*Lopholeucaspis japonica*)、リコルマ・デリカツラ(*Lycorma delicatula*)、マクロシフム属種(*Macrosiphum* spp.)、例えば、マクロシフム・エウホルビアエ(*Macrosiphum euphorbiae*)、マクロシフム・リリイ(*Macrosiphum lili*)、マクロシフム・ロサエ(*Macrosiphum rosae*)、マクロステレス・ファシフロンス(*Macrosteles fascifrons*)、マハナルバ属種(*Mahanarva* spp.)、メラナフィス・サッカリ(*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属種(*Metcalfiella* spp.)、メトカルファ・プルイノサ(*Metcalfa pruinosa*)、メトポロフィウム・ジロズム(*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス(*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス(*Monelliopsis pecan*)、ミズス属種(*Myzus* spp.)、例え

ば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ  
 (*Myzus cerasi*)、ミズス・リグストリ (*Myzus ligustri*)  
 、ミズス・オルナツス (*Myzus ornatus*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzu  
s persicae*)、ミズス・ニコチアナエ (*Myzus nicotianae*)  
 、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribisnigri*)、ネオマス  
 ケリア属種 (*Neomaskellia* spp.)、ネホテッチキス属種 (*Nepho  
tettix* spp.)、例えば、ネホテッチキス・シンクチセプス (*Nephote  
tettix cincticeps*)、ネホテッチキス・ニグロピクツス (*Nephote  
tettix nigropictus*)、ネチゴニセラ・スペクトラ (*Nettigoni  
cilla spectra*)、ニラパルバタ・ルゲンス (*Nilaparvata lu  
gens*)、オンコメトピア属種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・  
 ブラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、オキシヤ・キネンシス (*Ox  
ya chinensis*)、パキプシラ属種 (*Pachypsylla* spp.)、  
 パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属  
 種 (*Paratrioza* spp.)、例えば、パラトリオザ・コクケレリ (*Para  
trioza cockerelli*)、パルラトリア属種 (*Parlatoria* s  
pp.)、ペムフィグス属種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス  
 ・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、ペムフィグス・ポプリベ  
 ナエ (*Pemphigus populivenae*)、ペレグリヌス・マイジス (*Pe  
regrinus maidis*)、ペルキンシエラ属種 (*Perkinsiella* 10  
spp.)、フェナコックス属種 (*Phenacoccus* spp.)、例えば、フェ  
 ナ  
 コックス・マデイレンシス (*Phenacoccus madeirensis*)、プロ  
 エオミズス・パッセリニイ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホロド  
 ン・フムリ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属種 (*Phylloxera*  
*spp.*)、例えば、フィロキセラ・デバストラトリキス (*Phylloxera  
devastatrix*)、フィロキセラ・ノタビリス (*Phylloxera no  
tabilis*)、ピンナスピス・アスピジストラエ (*Pinnaspis aspid  
istrae*)、プラノコックス属種 (*Planococcus* spp.)、例えば、  
 プラノコックス・シトリ (*Planococcus citri*)、プロソピドプシラ・ 30  
 フラバ (*Prosopidopsylla flava*)、プロトブルビナリア・ピリホル  
 ミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プセウダウラカス  
 ピス・ペンタゴナ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プセウド  
 コックス属種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、プセウドコックス・カル  
 セオラリアエ (*Pseudococcus calceolariae*)、プセウドコ  
 ックス・コムストッキ (*Pseudococcus comstocki*)、プセウドコ  
 ックス・ロンギスピヌス (*Pseudococcus longispinus*)、プセ  
 ウドコックス・マリチムス (*Pseudococcus maritimus*)、プセウ  
 ドコックス・ビブルニ (*Pseudococcus viburni*)、プシロプシス属  
 種 (*Psyllopsis* spp.)、プシラ属種 (*Psylla* spp.)、例え 40  
 ば、プシラ・ブキシ (*Psylla buxi*)、プシラ・マリ (*Psylla mal  
i*)、プシラ・ピリ (*Psylla pyri*)、プテロマルス属種 (*Pteromal  
us* spp.)、ブルビナリア属種 (*Pulvinaria* spp.)、ピリラ属種  
 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピジオツス属種 (*Quadraspidio  
tus* spp.)、例えば、クアドラスピジオツス・ジュグランズレギアエ (*Quad  
raspidiotus juglansregiae*)、クアドラスピジオツス・オス  
 トレアエホルミス (*Quadraspidiotus ostreaeformis*)、  
 クアドラスピジオツス・ペルニシオス (*Quadraspidiotus perni  
ciosus*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコックス  
 属種 (*Rastrococcus* spp.)、ロパロシフム属種 (*Rhopalosi 50*



phum spp. )、例えば、ロパロシフム・マイジス (Rhopalosiphum maidis)、ロパロシフム・オキシアカンタエ (Rhopalosiphum oxyacanthae)、ロパロシフム・パジ (Rhopalosiphum padi)、ロパロシフム・ルフィアブドミナレ (Rhopalosiphum rufiabdominale)、サイセチア属種 (Saissetia spp. )、例えば、サイセチア・コフエアエ (Saissetia coffeae)、サイセチア・ミランダ (Saissetia miranda)、サイセチア・ネグレクトア (Saissetia neglecta)、サイセチア・オレアエ (Saissetia oleae)、スカホイデウス・チタヌス (Scaphoideus titanus)、スキザフィス・グラミヌム (Schizaphis graminum)、セレナスピズス・アルチクラツス (Selenaspidus articulatus)、シファ・フラバ (Sipha flava)、シトビオン・アベナエ (Sitobion avenae)、ソガタ属種 (Sogata spp. )、ソガテラ・フルシフェラ (Sogatella furcifera)、ソガトデス属種 (Sogatodes spp. )、スチクトセファラ・フェスチナ (Stictocephala festina)、シホニヌス・フィリレアエ (Siphoninus phillyreae)、テナラファラ・マライエンシス (Tenalaphara malayensis)、テトラゴノセフェラ属種 (Tetragnonocephala spp. )、チノカリス・カリアエホリアエ (Tinocallis caryaefoliae)、トマスпис属種 (Tomaspis spp. )、トキソプテラ属種 (Toxoptera spp. )、例えば、トキソプテラ・アウランチイ (Toxoptera aurantii)、トキソプテラ・シトリシズス (Toxoptera citricidus)、トリアレウロデス・バボラリオルム (Trialeurodes vaporariorum)、トリオザ属種 (Trioza spp. )、例えば、トリオザ・ジオスピリ (Trioza diospyri)、チフロシバ属種 (Typhlocyba spp. )、ウナスпис属種 (Unaspis spp. )、ビテウス・ビチホリイ (Viteus vitifolii)、ジギナ属種 (Zygina spp. ) ;

カメムシ亜目 (Heteroptera) の、例えば、アエリア属種 (Aelia spp. )、アナサ・トリスチス (Anasa tristis)、アンテスチオプシス属種 (Antestiopsis spp. )、ボイセア属種 (Boisea spp. )、ブリスス属種 (Blissus spp. )、カロコリス属種 (Calocoris spp. )、カムピロンマ・リビダ (Campylomma livida)、カベレリウス属種 (Cavelerius spp. )、シメキス属種 (Cimex spp. )、例えば、シメキス・アドジュンクツス (Cimex adjunctus)、シメキス・ヘミプテルス (Cimex hemipterus)、シメキス・レクツラリウス (Cimex lectularius)、シメキス・ピロセルス (Cimex pilosellus)、コラリア属種 (Collaria spp. )、クレオンチアデス・ジルツス (Creontiades dilutus)、ダシヌス・ビペリス (Dasynus piperis)、ジケロプス・フルカツス (Dichelops furcatus)、ジコノコリス・ヘウエッチ (Diconocoris hewetti)、ジスデルクス属種 (Dysdercus spp. )、エウスキスツス属種 (Euschistus spp. )、例えば、エウスキスツス・ヘロス (Euschistus hero s)、エウスキスツス・セルプス (Euschistus servus)、エウスキスツス・トリスチグムス (Euschistus tristigmus)、エウスキスツス・バリオラリウス (Euschistus variolarius)、エウリデマ属種 (Eurydema spp. )、エウリガステル属種 (Eurygaster spp. )、ハリオモルファ・ハリス (Halyomorpha halys)、ヘリオバルチス属種 (Heliopeltis spp. )、ホルシアス・ノビレルス (Horcias nobilellus)、レプトコリサ属種 (Leptocorisa spp. )、レプトコリサ・バリコルニス (Leptocorisa varicornis)、

10

20

30

40

50

レプトグロスス・オッシデンタリス (*Leptoglossus occidentalis*)、レプトグロスス・フィロプス (*Leptoglossus phyllopus*)、リゴコリス属種 (*Lygocoris* spp.)、例えば、リゴコリス・パブリヌス (*Lygocoris pabulinus*)、リグス属種 (*Lygus* spp.)、例えば、リグス・エリスス (*Lygus elisus*)、リグス・ヘスペルス (*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス (*Lygus lineolaris*)、マクロペス・エキスカバツス (*Macropes excavatus*)、メガコプタ・クリブラリア (*Megacopta cribraria*)、ミリダエ (*Miridae*)、モナロニオン・アトラツム (*Monalonion atratum*)、ネザラ属種 (*Nezara* spp.)、例えば、ネザラ・ビリズラ (*Nezara viridula*)、ニシウス属種 (*Nysius* spp.)、オエバルス属種 (*Oebalus* spp.)、ペントミダエ (*Pentomidae*)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・ゲイルジニイ (*Piezodorus guildinii*)、プサルス属種 (*Psallus* spp.)、プセウダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、ロドニウス属種 (*Rhodnius* spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (*Sahlbergella singularis*)、スカプトコリス・カスタネア (*Scaptocoris castanea*)、スコチノホラ属種 (*Scotinophora* spp.)、ステファニチス・ナシ (*Stephanitis nashi*)、チブラカ属種 (*Tibraca* spp.)、トリアトマ属種 (*Triatoma* spp.) ;

10

20

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

30

40

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

シロアリ目 (*Isoptera*) の、例えば、コプトテルメス属種 (*Coptotermes* spp.)、例えば、コプトテルメス・ホルモサヌス (*Coptotermes formosanus*)、コルニテルメス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属種 (*Cryptotermes* spp.)、インシシテルメス属種 (*Incisitermes* spp.)、カロテルメス属種 (*Kaloterme* spp.)、ミクロテルメス・オベシ (*Microtermes obesi*)、ナスチテルメス属種 (*Nasutitermes* spp.)、オドントテ

50

ルメス属種 (*Odontotermes* spp.)、ポロテルメス属種 (*Porotermes* spp.)、レチクリテルメス属種 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、レチクリテルメス・フラビペス (*Reticulitermes flavipes*)、レチクリテルメス・ヘスペルス (*Reticulitermes hesperus*) ;

チョウ目 (*Lepidoptera*) の、例えば、アクロイア・グリセラ (*Achroia grisella*)、アクロニクタ・マジョル (*Acronicta major*)、アドキソフィエス属種 (*Adoxophyes* spp.)、例えば、アドキソフィエス・オラナ (*Adoxophyes orana*)、アエジア・レウコメラス (*Aedia leucomelas*)、アグロチス属種 (*Agrotis* spp.)、例えば、アグロチス・セゲツム (*Agrotis segetum*)、アグロチス・イプシロン (*Agrotis ipsilon*)、アラバマ属種 (*Alabama* spp.)、例えば、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミエロイス・トランシテラ (*Amyelois transitella*)、アナルシア属種 (*Anarsia* spp.)、アンチカルシア属種 (*Anticarsia* spp.)、例えば、アンチカルシア・ゲンマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルギロプロセ属種 (*Argyroproctis* spp.)、アウトグラファ属種 (*Autographa* spp.)、バラトラ・ブラシカエ (*Barathra brassicae*)、ブラストデクナ・アトラ (*Blastodacna atra*)、ボルボ・シンナラ (*Borbo cinnara*)、ブククラトリキス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberiella*)、ブパルス・ピニアリウス (*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属種 (*Busseola* spp.)、カコエシア属種 (*Cacoecia* spp.)、カロプチリア・テイボラ (*Caloptilia theivora*)、カプア・レチクラナ (*Capua reticulana*)、カルボカプサ・ポモネラ (*Carpocapsa pomonella*)、カルボシナ・ニボネンシス (*Carposina niponensis*)、ケイマトビア・ブルマタ (*Cheimatobia brumata*)、キロ属種 (*Chilo* spp.)、例えば、キロ・プレジャデルス (*Chilo plejadellus*)、キロ・スプレッサリス (*Chilo suppressalis*)、コレウチス・パリアナ (*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属種 (*Choristoneura* spp.)、クリソデイキス・カルシテス (*Chrysodeixis chalcites*)、クリシア・アムビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属種 (*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス (*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属種 (*Cnephasia* spp.)、コノボモルファ属種 (*Conopomorpha* spp.)、コノトラケルス属種 (*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属種 (*Copitarsia* spp.)、シジア属種 (*Cydia* spp.)、例えば、シジア・ニグリカナ (*Cydia nigricana*)、シジア・ポモネラ (*Cydia pomonella*)、ダラカ・ノクツイデス (*Dalaca noctuides*)、ジアファニア属種 (*Diaphania* spp.)、ジパロプシス属種 (*Diparopsis* spp.)、ジアトラエア・サッカラリス (*Diatraea saccharalis*)、エアリアス属種 (*Earias* spp.)、エクジトロファ・アウランチュム (*Ecdytolopha aurantium*)、エラスモパルプス・リグノセルス (*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属種 (*Ephestia* spp.)、例えば、エフェスチア・エルテラ (*Ephestia elutella*)、エフェスチア・クエーニエラ (*Ephestia kuehniella*)、エピノチア属種 (*Epinothia* spp.)、エピフィアス・ポストビッタナ (*Epiphyas postvittana*)、エランニス属種 (*Erannis* spp.)、エルスコビエラ・ムスクラナ (*Erschoviella musculana*)、エチエラ属

10

20

30

40

50

種 (*Etiella* spp.)、エウドシマ属種 (*Eudocima* spp.)、エウリア属種 (*Eulia* spp.)、エウボエシリア・アムビグエラ (*Eupoecilia ambiguelia*)、エウプロクチス属種 (*Euproctis* spp.)、例えば、エウプロクチス・クリソロエア (*Euproctis chrysorrhoea*)、エウキソア属種 (*Euxoa* spp.)、フェルチア属種 (*Feltia* spp.)、ガレリア・メロネラ (*Galleria mellonella*)、グラシラリア属種 (*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属種 (*Grapholitha* spp.)、例えば、グラホリタ・モレスタ (*Grapholitha molesta*)、グラホリタ・プルニボラ (*Grapholitha prunivora*)、ヘジレプタ属種 (*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルパ属種 (*Helicoverpa* spp.)、例えば、ヘリコベルパ・アルミゲラ (*Helicoverpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、ヘリオチス属種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオチス・ビレセンス (*Heliothis virescens*)、ホフマンノフィラ・プセウドスプレテラ (*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ属種 (*Homoiosoma* spp.)、ホモナ属種 (*Homona* spp.)、ヒポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、カキボリア・フラボファシアタ (*Kakivoria flavofasciata*)、ランピデス属種 (*Lampides* spp.)、ラフィグマ属種 (*Laphygma* spp.)、ラスペイレシア・モレスタ (*Laspeyresia molesta*)、レウシノデス・オルボナリス (*Leucinodes orbonalis*)、レウコプテラ属種 (*Leucoptera* spp.)、例えば、レウコプテラ・コフェエラ (*Leucoptera coffeella*)、リトコレチス属種 (*Lithocolletis* spp.)、例えば、リトコレチス・ブランカルデラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア属種 (*Lobesia* spp.)、例えば、ロベシア・ボトラナ (*Lobesia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis albicosta*)、リマントリア属種 (*Lymantria* spp.)、例えば、リマントリア・ジスパル (*Lymantria dispar*)、リオネチア属種 (*Lyonetia* spp.)、例えば、リオネチア・クレルケラ (*Lyonetia clerkella*)、マラコソマ・ネウストリア (*Malacosoma neustria*)、マルカ・テストラリス (*Maruca testulalis*)、マメストラ・ブラシカエ (*amestra brassicae*)、メラニチス・レダ (*Melanitis leda*)、モシス属種 (*Mocis* spp.)、モノピス・オブビエラ (*Monopis obviella*)、ミチムナ・セパラタ (*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセルス (*Nemapogon cloacellus*)、ニムフラ属種 (*Nymphula* spp.)、オイケチクス属種 (*Oiketeticus* spp.)、オンフィサ属種 (*Omphisa* spp.)、オペロフテラ属種 (*Operophtera* spp.)、オリア属種 (*Oria* spp.)、オルタガ属種 (*Orthaga* spp.)、オストリニア属種 (*Ostrinia* spp.)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、パノリス・フランメア (*Panolis flammea*)、パルナラ属種 (*Parnara* spp.)、ペクチノホラ属種 (*Pectinophora* spp.)、例えば、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ペリレウコプテラ属種 (*Perileucoptera* spp.)、フトリマエア属種 (*Phthorimaea* spp.)、例えば、フトリマエア・オペルクレラ (*Phthorimaea operculella*)、フィロクニスチス・シトレラ (*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属種 (*Phyllonorycter* spp.)、例えば、フィロノリクテル・ブランカルデラ (*Phyllonorycter blancardella*)、フィロノリクテル・クラタエゲラ (*Phyllonoryc*

ter crataegella)、ピエリス属種(Pieris spp.)、例えば、  
 ピエリス・ラパエ(Pieris rapae)、プラチノタ・スツルタナ(Platynota stultana)、プロジア・インテルプンクテラ(Plodia interpunctella)、プルシア属種(Plusia spp.)、プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella)(=プルテラ・マクリペンニス(Plutella maculipennis))、プライス属種(Prays spp.)、プロデニア属種(Prodenia spp.)、プロトバルセ属種(Protoparce spp.)、プセウダレチア属種(Pseudaletia spp.)、例えば、プセウダレチア・ウニプンクタ(Pseudaletia unipuncta)、プセウドプルシア・インクルデンス(Pseudoplusia includens)、ピラウスタ・ヌビラリス(Pyrausta nubilalis)、ラキブルシア・ヌ(Rachiplusia nu)、スコエノビウス属種(Schoenobius spp.)、例えば、スコエノビウス・ビプンクチフェル(Schoenobius bipunctifer)、シルポファガ属種(Scirpophaga spp.)、例えば、シルポファガ・インノタタ(Scirpophaga innotata)、スコチア・セゲツム(Scotia segetum)、セサミア属種(Sesamia spp.)、例えば、セサミア・インフェレンス(Sesamia inferens)、スパルガノチス属種(Sparganothis spp.)、スポドプテラ属種(Spodoptera spp.)、例えば、スポドプテラ・エラジアナ(Spodoptera eradiana)、スポドプテラ・エキシグア(Spodoptera exigua)、スポドプテラ・フルギベルダ(Spodoptera frugiperda)、スポドプテラ・ブラエフィカ(Spodoptera praefica)、スタトモポダ属種(Stathmopoda spp.)、ステノマ属種(Stenomoma spp.)、ストモプテリキス・スブセシベラ(Stomopteryx subsceivella)、シナンテドン属種(Synanthedon spp.)、テシア・ソラニボラ(Tecia solanivora)、タウメトポエア属種(Thaumetopoea spp.)、テルメシア・ゲンマタリス(Thermesia gemmatalis)、チネア・クロアセラ(Tinea cloacella)、チネア・ペリオネラ(Tinea pellionella)、チネオラ・ビッセリエラ(Tineola bisselliella)、トルトリキス属種(Tortrix spp.)、トリコファガ・タベトゼラ(Trichophaga tapetzella)、トリコプルシア属種(Trichoplusia spp.)、例えば、トリコプルシア・ニ(Trichoplusia ni)、トリボリザ・インセルツラス(Tryporyza incertulas)、ツタ・アブソルタ(Tuta absoluta)、ピラコラ属種(Virachola spp.) ;

バッタ目(Orthoptera)又は(Saltatoria)の、例えば、アケタ・ドメスチクス(Acheta domesticus)、ジクロプルス属種(Dichroplus spp.)、グリロタルパ属種(Gryllotalpa spp.)、例えば、グリロタルパ・グリロタルパ(Gryllotalpa gryllotalpa)、ヒエログリフス属種(Hieroglyphus spp.)、ロクスタ属種(Locusta spp.)、例えば、ロクスタ・ミグラトリア(Locusta migratoria)、メラノプルス属種(Melanoplus spp.)、例えば、メラノプルス・デバスタトル(Melanoplus devastator)、パラトランチクス・ウスリエンシス(Paratlanticus ussuriensis)、スキストセルカ・グレガリア(Schistocerca gregaria) ;

シラミ目(Phthiraptera)の、例えば、ダマリニア属種(Damalinia spp.)、ハエマトピヌス属種(Haematopinus spp.)、リノグナツス属種(Linognathus spp.)、ペジクルス属種(Pediculus spp.)、フィロキセラ・バスタトリキス(Phylloxera vastata

10

20

30

40

50

trix)、フチルス・プビス(Phthirus pubis)、トリコデクテス属種(Trichodectes spp.);

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

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

アザミウマ目 (Thysanoptera) の、例えば、アナホトリプス・オブスクルス (Anaphothrips obscurus)、バリオトリプス・ビホルミス (Baliothrips biformis)、カエタナホトリプス・レエウウェニ (Chaetanaphothrips leeuweni)、ドレパノトリプス・レウテリ (Drepanothrips reuteri)、エンネオトリプス・フラベンス (Enneothrips flavens)、フランクリニエラ属種 (Frankliniella spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ (Frankliniella fusca)、フランクリニエラ・オッシデンタリス (Frankliniella

occidentalis)、フランクリエラ・スクルトゼイ(Frankliniella schultzei)、フランクリエラ・トリチシ(Frankliniella tritici)、フランクリエラ・バシニイ(Frankliniella vaccini)、フランクリエラ・ウィリアムシ(Frankliniella williamsi)、ハプロトリプス属種(Haplothrips spp.)、ヘリオトリプス属種(Heliothrips spp.)、ヘルシノトリプス・フェモリス(Hercinothrips femoralis)、カコトリプス属種(Kakothrips)、リピホロトリプス・クルエンタツス(Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトトリプス属種(Scirtothrips spp.)、タエノトリプス・カルダモミ(Taeniothrips cardamomi)、トリプス属種(Thrips spp.)、例えば、トリプス・パルミ(Thrips palmi)、トリプス・タバシ(Thrips tabaci)；

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

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

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

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

ンクス属種 (*Aglenchus* spp.)、例えば、アグレンクス・アグリコラ (*Aglenchus agricola*)、アングイナ属種 (*Anguina* spp.)、  
 例え、アングイナ・トリチシ (*Anguina tritici*)、アフエレンコイ  
 デス属種 (*Aphelenchoides* spp.)、例え、アフエレンコイデス・  
 アラキジス (*Aphelenchoides arachidis*)、アフエレンコイデ  
 ス・フラガリアエ (*Aphelenchoides fragariae*)、ベロノライ  
 ムス属種 (*Belonolaimus* spp.)、例え、ベロノライムス・グラシリ  
 ス (*Belonolaimus gracilis*)、ベロノライムス・ロンギカウザツ  
 ス (*Belonolaimus longicaudatus*)、ベロノライムス・ノル  
 トニ (*Belonolaimus nortonii*)、ブルサフェレンクス属種 (*Bur* 10  
*saphelenchus* spp.)、例え、ブルサフェレンクス・ココフィルス (*Bur*  
*saphelenchus cocophilus*)、ブルサフェレンクス・エレ  
 ムス (*Bursaphelenchus eremus*)、ブルサフェレンクス・キシロ  
 フィルス (*Bursaphelenchus xylophilus*)、カコパウルス属  
 種 (*Cacopaurus* spp.)、例え、カコパウルス・ペスチス (*Cacop*  
*aurus pestis*)、クリコネメラ属種 (*Criconemella* spp.)、  
 例え、クリコネメラ・クルバタ (*Criconemella curvata*)、  
 クリコネメラ・オノエンシス (*Criconemella onoensis*)、クリコ  
 ネメラ・オルナタ (*Criconemella ornata*)、クリコネメラ・ルシウ  
 ム (*Criconemella rusium*)、クリコネメラ・キセノブラキス (*Cr* 20  
*iconemella xenoplax*) (=メソクリコネマ・キセノブラキス (*Me*  
*socriconema xenoplax*))、クリコネモイデス属種 (*Cricon*  
*emoides* spp.)、例え、クリコネモイデス・フェルニアエ (*Cricon*  
*emoides ferniae*)、クリコネモイデス・オノエンセ (*Criconem*  
*oides onoense*)、クリコネモイデス・オルナツム (*Criconemoi*  
*des ornatum*)、ジチレンクス属種 (*Ditylenchus* spp.)、  
 例え、ジチレンクス・ジブサシ (*Ditylenchus dipsaci*)、ドリコ  
 ドルス属種 (*Dolichodorus* spp.)、グロボデラ属種 (*Globode*  
*ra* spp.)、例え、グロボデラ・パリダ (*Globodera pallida*)、  
 グロボデラ・ロストキエンシス (*Globodera rostochiensis* 30  
*)*、ヘリコチレンクス属種 (*Helicotylenchus* spp.)、例え、ヘ  
 リコチレンクス・ジヒステラ (*Helicotylenchus dihystra*)、  
 ヘミクリコネモイデス属種 (*Hemicriconemoides* spp.)、ヘミ  
 シクリオホラ属種 (*Hemicyccliophora* spp.)、ヘテロデラ属種 (*H*  
*eterodera* spp.)、例え、ヘテロデラ・アベナエ (*Heteroder*  
*a avenae*)、ヘテロデラ・グルシネス (*Heterodera glycine*  
*s*)、ヘテロデラ・スカクチイ (*Heterodera schachtii*)、ヒルス  
 クマニエラ属種 (*Hirschmaniella* spp.)、ホプロライムス属種 (*H*  
*oplolaimus* spp.)、ロンギドルス属種 (*Longidorus* spp 40  
*)*、例え、ロンギドルス・アフリカヌス (*Longidorus africanu*  
*s*)、メロイドギネ属種 (*Meloidogyne* spp.)、例え、メロイドギネ  
 ・キトウオオジ (*Meloidogyne chitwoodii*)、メロイドギネ・ファ  
 ラキス (*Meloidogyne fallax*)、メロイドギネ・ハブラ (*Meloi*  
*dogyne hapla*)、メロイドギネ・インコグニタ (*Meloidogyne*  
*incognita*)、メロイネマ属種 (*Meloinema* spp.)、ナコップス  
 属種 (*Nacobbus* spp.)、ネオチレンクス属種 (*Neotylenchus*  
*spp.*)、パラロンギドルス属種 (*Paralongidorus* spp.)、パ  
 ラフェレンクス属種 (*Paraphelenchus* spp.)、パラトリコドルス属  
 種 (*Paratrichodorus* spp.)、例え、パラトリコドルス・ミノル  
 (*Paratrichodorus minor*)、パラチレンクス属種 (*Paraty* 50

lenchus spp.)、プラチレンクス属種 (Pratylenchus spp.)、例えば、プラチレンクス・ペネトランス (Pratylenchus penetrans)、プセウドハレンクス属種 (Pseudohalenchus spp.)、プシレンクス属種 (Psilenchus spp.)、プンクトデラ属種 (Punctodera spp.)、クイニスルシウス属種 (Quinisulcius spp.)、ラドホルス属種 (Radopholus spp.)、例えば、ラドホルス・シトロフィルス (Radopholus citrophilus)、ラドホルス・シミリス (Radopholus similis)、ロチレンクルス属種 (Rotylenchulus spp.)、ロチレンクス属種 (Rotylenchus spp.)、スクテロネマ属種 (Scutellonema spp.)、スバングイナ属種 (Subanguina spp.)、トリコドルス属種 (Trichodorus spp.)、例えば、トリコドルス・オブツス (Trichodorus obtusus)、トリコドルス・プリミチブス (Trichodorus primitivus)、チレンコリンクス属種 (Tylenchorhynchus spp.)、例えば、チレンコリンクス・アンヌラツス (Tylenchorhynchus annulatus)、チレンクルス属種 (Tylenchulus spp.)、例えば、チレンクルス・セミペネトランス (Tylenchulus semipenetrans)、キシフィネマ属種 (Xiphinema spp.)、例えば、キシフィネマ・インデキス (Xiphinema index)。

10

#### 【0054】

20

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

#### 【0055】

##### 製剤

30

本発明は、さらに、式 (I) で表される少なくとも1種類の化合物を含んでいる、殺有害生物剤としての製剤及びその製剤から調製される使用形態 (例えば、灌注液、滴下液及び散布液) にも関する。場合により、該使用形態は、さらなる殺有害生物剤、及び/又は、作用を向上させるアジュバント、例えば、浸透剤、例えば、植物油 (例えば、ナタネ油、ヒマワリ油)、鉱油 (例えば、パラフィン油)、植物性脂肪酸アルキルエステル (例えば、ナタネ油メチルエステル又はダイズ油メチルエステル)、又は、アルカノールアルコキシレート類、及び/又は、展着剤、例えば、アルキルシロキサン類及び/又は塩、例えば、有機又は無機のアンモニウム塩又はホスホニウム塩 (例えば、硫酸アンモニウム又はリン酸水素二アンモニウム)、及び/又は、保持促進剤 (retention promoter) (例えば、スルホコハク酸ジオクチル又はヒドロキシプロピルグアーポリマー)、及び/又は、湿潤剤 (例えば、グリセロール)、及び/又は、肥料 (例えば、アンモニウム含有肥料、カリウム含有肥料又はリン含有肥料) を含有する。

40

#### 【0056】

慣習的な製剤は、例えば、以下のものである： 水溶性液剤 (SL)、乳剤 (EC)、水中油型エマルジョン剤 (EW)、懸濁製剤 (SC、SE、FS、OD)、顆粒水和剤 (WG)、顆粒剤 (GR)、及び、カプセル製剤 (capsule concentrates) (CS)； これらの製剤型及び別の可能な製剤型は、例えば、以下のものに記載されている： Crop Life International and in Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specificati

50



ons for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173 (作製元: the FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576)。該製剤は、式(I)で表される1種類以上の化合物に加えて、場合により、さらなる農薬活性化合物を含有する。

【0057】

好ましいのは、補助剤〔例えば、増量剤、溶媒、自発性促進剤(spontaneity promoter)、担体、乳化剤、分散剤、凍結防止剤(frost protection agent)、殺生物剤、増粘剤及び/又は他の補助剤(例えば、アジュバント)など〕を含有している製剤又は使用形態である。これに関連して、アジュバントは、当該製剤の生物学的効果を高める成分であって、その成分自体は生物学的効果を有するものではない。アジュバントの例は、葉の表面への保持、拡張(spreading)、付着を促進する作用物質又は浸透を促進する作用物質である。

10

【0058】

これらの製剤は、既知方法で、例えば、式(I)で表される化合物を補助剤(例えば、増量剤、溶媒及び/若しくは固体担体、並びに/又は、別の補助剤、例えば、界面活性剤)と混合させることにより製造する。そのような製剤は、適切な設備で製造するか、又は、施用前若しくは施用中に製造する。

【0059】

20

使用する補助剤は、式(I)で表される化合物の製剤又はそのよう製剤から調製された使用形態(例えば、即時使用可能な(ready-to-use)殺有害生物剤、例えば、散布液又は種子粉衣製品)に、特別な特性、例えば、特定の物理的特性、技術的特性及び/又生物学的特性などを付与するのに適している物質であり得る。

【0060】

適切な増量剤は、例えば、水、並びに、極性及び非極性の有機化学的液体、例えば、以下の類から選択されるものである： 芳香族及び非芳香族の炭化水素類(例えば、パラフィン類、アルキルベンゼン類、アルキルナフタレン類、クロロベンゼン類)、アルコール類及びポリオール類(これらは、適切な場合には、置換されていてもよく、エーテル化されていてもよく、及び/又は、エステル化されていてもよい)、ケトン類(例えば、アセトン、シクロヘキサノン)、エステル類(これは、脂肪類及び油類を包含する)及び(ポリ)エーテル類、単純アミン類及び置換されているアミン類、アミド類、ラクタム類(例えば、N-アルキルピロリドン類)、及び、ラクトン類、スルホン類及びスルホキシド類(例えば、ジメチルスルホキシド)。

30

【0061】

使用する増量剤が水である場合、例えば有機溶媒を補助溶媒として使用することもできる。有用な液体溶媒は、本質的に以下のものである： 芳香族化合物、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族化合物又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン類、クロロエチレン類又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン又はパラフィン類、例えば、鉱油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、ブタノール又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルホルムアミド及びジメチルスルホキシド、及び、さらに、水。

40

【0062】

原則として、適切な全ての溶媒を使用することが可能である。適切な溶媒の例は、芳香族炭化水素、例えば、キシレン、トルエン又はアルキルナフタレン類、塩素化芳香族炭化水素又は塩素化脂肪族炭化水素、例えば、クロロベンゼン、クロロエチレン又は塩化メチレン、脂肪族炭化水素、例えば、シクロヘキサン、パラフィン類、石油留分、鉱油及び植物油、アルコール類、例えば、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール

50

又はグリコールとそれらのエーテル及びエステル、ケトン類、例えば、アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン又はシクロヘキサノン、強極性溶媒、例えば、ジメチルスルホキシド、及び、水である。

【 0 0 6 3 】

原則として、適切な全ての担体を使用することが可能である。有用な担体としては、特に、以下のものを挙げることができる： 例えば、アンモニウム塩、及び、微粉碎された天然岩石、例えば、カオリン、アルミナ、タルク、チョーク、石英、アタパルジャイト、モンモリロナイト又はケイ藻土、及び、微粉碎された合成岩石、例えば、高分散シリカ、酸化アルミニウム、及び、天然シリケート又は合成シリケート、樹脂、蠟、及び／又は、固形肥料。そのような担体の混合物も同様に使用することができる。粒剤に関して有用な担体としては、以下のものを挙げることができる： 例えば、粉碎して分別した天然岩石、例えば、方解石、大理石、軽石、海泡石、苦灰岩、並びに、無機及び有機の粉末からなる合成顆粒、並びに、さらに、有機材料（例えば、おがくず、紙、ココナッツ殻、トウモロコシの穂軸及びタバコの葉柄など）からなる顆粒。

10

【 0 0 6 4 】

液化ガスの増量剤又は溶媒を使用することも可能である。特に適している増量剤又は担体は、標準温度及び大気圧下では気体である増量剤又は担体、例えば、エアロゾル噴射剤、例えば、ハロゲン化炭化水素類、及び、さらに、ブタン、プロパン、窒素及び二酸化炭素などである。

【 0 0 6 5 】

20

イオン特性若しくは非イオン特性を有する乳化剤及び／若しくは泡形成剤、分散剤又は湿潤剤の例、又は、これらの界面活性物質の混合物の例は、以下のものである： ポリアクリル酸の塩、リグノスルホン酸の塩、フェノールスルホン酸若しくはナフタレンスルホン酸の塩、エチレンオキシドと脂肪アルコールの重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪酸の重縮合物若しくはエチレンオキシドと脂肪アミンの重縮合物、エチレンオキシドと置換されているフェノール（好ましくは、アルキルフェノール又はアリアルフェノール）の重縮合物、スルホコハク酸エステルの塩、タウリン誘導体（好ましくは、アルキルタウレート）、ポリエトキシ化アルコールのリン酸エステル若しくはポリエトキシ化フェノールのリン酸エステル、ポリオール脂肪酸エステル、並びに、硫酸アニオン、スルホン酸アニオン及びリン酸アニオンを含んでいる該化合物の誘導体、例えば、アルキルアリアルポリグリコールエーテル類、アルキルスルホネート類、アルキルスルフェート類、アリアルスルホネート類、タンパク質加水分解物、リグノスルファイト廃液、及び、メチルセルロース。式（Ⅰ）で表される化合物のうちの１種類及び／又は該不活性担体のうちの１種類が水不溶性であり且つ施用が水で行われる場合は、界面活性剤を存在させることが有利である。

30

【 0 0 6 6 】

該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に存在させ得るさらなる補助剤としては、着色剤、例えば、無機顔料、例えば、酸化鉄、酸化チタン及びプルシアンブルー（P r u s s i a n B l u e）、並びに、有機染料、例えば、アリザリン染料、アゾ染料及び金属フタロシアニン染料、並びに、栄養素及び微量栄養素、例えば、鉄塩、マンガン塩、ホウ素塩、銅塩、コバルト塩、モリブデン塩及び亜鉛塩などがある。

40

【 0 0 6 7 】

存在させ得るさらなる成分は、安定剤（例えば、低温安定剤）、防腐剤、酸化防止剤、光安定剤、又は、化学的及び／若しくは物理的安定性を向上させる別の作用剤である。さらに、泡生成剤又は消泡剤も存在させることができる。

【 0 0 6 8 】

さらにまた、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態には、付加的な補助剤として、粘着剤、例えば、カルボキシメチルセルロース、並びに、粉末又は顆粒又はラテックスの形態にある天然ポリマー及び合成ポリマー、例えば、アラビアゴム、ポリビニルアルコール及びポリ酢酸ビニル、又は、天然リン脂質、例えば、セファリン及びレシチン、及び

50

、合成リン脂質なども含有させることができる。さらなる補助剤は、鉱油及び植物油であり得る。

【 0 0 6 9 】

適切な場合には、該製剤及びその製剤から誘導される使用形態の中に、さらなる補助剤も存在させることができる。そのような添加剤の例は、芳香物質、保護コロイド、結合剤、接着剤、増粘剤、揺変剤、浸透剤、保持促進剤、安定化剤、金属イオン封鎖剤、錯化剤、湿潤剤、展着剤である。一般的に、式(Ⅰ)で表される化合物は、製剤を目的として通常使用される固体又は液体の任意の添加剤と組み合わせることができる。

【 0 0 7 0 】

有用な保持促進剤には、動的表面張力を低減させる全ての物質(例えば、スルホコハク酸ジオクチル)又は粘弾性を増大させる全ての物質(例えば、ヒドロキシプロピルグアールポリマー)が包含される。

【 0 0 7 1 】

本発明に関連して有用な浸透剤は、植物体内への農薬活性成分の浸透を向上させるために典型的に使用される全ての物質である。これに関連して、浸透剤は、それらが、(一般には、水性の)施用液から、及び/又は、散布による被膜から、植物のクチクラの中に浸透し、それによって、活性成分のクチクラ内での移動性を増強することができる能力によって定義される。この特性を確認するために、文献(Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152)に記載されている方法を用いることができる。その例としては、アルコールアルコキシレート、例えば、ココナツ脂肪エトキシレート(cocconut fatty ethoxylate)(10)若しくはイソトリデシルエトキシレート(12)、脂肪酸エステル、例えば、ナタネ油メチルエステル若しくはダイズ油メチルエステル、脂肪アミンアルコキシレート、例えば、獣脂アミンエトキシレート(15)、又は、アンモニウム塩及び/若しくはホスホニウム塩、例えば、硫酸アンモニウム若しくはリン酸水素二アンモニウムなどを挙げることができる。

【 0 0 7 2 】

該製剤は、その製剤の重量に基づいて、好ましくは、0.00000001重量%~98重量%の式(Ⅰ)で表される化合物を含んでおり、さらに好ましくは、0.01重量%~95重量%の式(Ⅰ)で表される化合物を含んでおり、最も好ましくは、0.5重量%~90重量%の式(Ⅰ)で表される化合物を含んでいる。

【 0 0 7 3 】

該製剤(特に、殺有害生物剤)から調製された使用形態の中の式(Ⅰ)で表される化合物の含有量は、広い範囲内でさまざまであり得る。該使用形態中の式(Ⅰ)で表される化合物の濃度は、その使用形態の重量に基づいて、一般に、0.00000001重量%~95重量%の式(Ⅰ)で表される化合物、好ましくは、0.00001重量%~1重量%の式(Ⅰ)で表される化合物である。施用は、その使用形態に適した慣習的な方法で行う。

【 0 0 7 4 】

混合物

式(Ⅰ)で表される化合物は、例えば、作用スペクトルを拡大するために、作用の期間を長くするために、作用速度を増大させるために、忌避性を防止するために、又は、抵抗性の発達を防止するために、1種類以上の適切な殺菌剤、殺細菌剤、殺ダニ剤、軟体動物駆除剤、殺線虫剤、殺虫剤、微生物剤(microbiological agent)、有益生物、除草剤、肥料、鳥忌避剤、植物強化剤(phytonic)、不妊剤、薬害軽減剤、情報化学物質及び/又は植物成長調節剤との混合物において使用することもできる。さらに、この種の活性成分組合せは、植物の成長を向上させることが可能であり、及び/又は、非生物的要因(例えば、高温又は低温)に対する耐性、渇水に対する耐性又は水中若しくは土壤中の塩分の含有量の上昇に対する耐性を向上させることが可能である。さらにまた、開花性能及び結果性能を改善することも可能であり、発芽能力及び根の

発達を最適化することも可能であり、収穫を容易にすることも可能であり、収穫高を向上させることも可能であり、成熟に影響を及ぼすことも可能であり、収穫された生産物の品質及び／若しくは栄養価を向上させることも可能であり、収穫された生産物の貯蔵寿命を長くすることも可能であり、並びに／又は、収穫された生産物の加工性を改善することも可能である。

【0075】

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

10

【0076】

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

【0077】

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

20

【0078】

殺虫剤／殺ダニ剤／殺線虫剤

本明細書中において「一般名」によって特定されている活性成分は、既知であり、そして、例えば、「*The Pesticide Manual*”, 16th ed., British Crop Protection Council 2012」に記載されているか、又は、インターネット上で検索することができる(例えば、「<http://www.alanwood.net/pesticides>」)。その分類は、本特許出願の出願時点において適用できる「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいている。

【0079】

30

(1) アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害薬、例えば、

カーバメート系、例えば、アラニカルブ、アルジカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メソミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカーブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオファノックス、トリアザメート、トリメタカルブ、XMC、及び、キシリルカルブ；又は、

有機リン酸エステル系、例えば、アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、カズサホス、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、ジメトン-S-メチル、ダイアジノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ダイスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファムフル、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、O-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチル酸イソプロピル、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシジメトン-メチル、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロピタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、キナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、及び、バミドチオン。

40

50

## 【 0 0 8 0 】

( 2 ) G A B A 制御塩化物チャンネル遮断薬、例えば、シクロジエン - 有機塩素系、例えば、クロルダン、及び、エンドスルファン；又は、フェニルピラゾール系（フィプロール系）、例えば、エチプロール、及び、フィプロニル。

## 【 0 0 8 1 】

( 3 ) ナトリウムチャンネルモジュレーター、例えば、ピレスロイド系、例えば、アクリナトリン、アレスリン、d - シス - トランスアレスリン、d - トランスアレスリン、ピフェントリン、ピオアレスリン、ピオアレスリン S - シクロペンテニル異性体、ピオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シベルメトリン、アルファ - シベルメトリン、ベータ - シベルメトリン、シータ - シベルメトリン、ゼータ - シベルメトリン、シフェノトリン [ ( 1 R ) - トランス異性体 ]、デルタメトリン、エムペントリン [ ( E Z ) - ( 1 R ) 異性体 ]、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロックス、イミプロトリン、カデトリン、モンフルオロトリン、ベルメトリン、フェノトリン [ ( 1 R ) - トランス異性体 ]、ブラレトリン、ピレトリン類（除虫菊（pyrethrum））、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメトリン、テトラメトリン [ ( 1 R ) 異性体 ]、トラロメトリン、及び、トランスフルトリン；又は、DDT；又は、メトキシクロル。

## 【 0 0 8 2 】

( 4 ) ニコチン性アセチルコリン受容体（n A C h R）競合的モジュレーター、例えば、ネオニコチノイド系、例えば、アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド、及び、チアメトキサム；又は、ニコチン；又は、スルホキサフロル、又は、フルピラジフロル。

## 【 0 0 8 3 】

( 5 ) ニコチン性アセチルコリン受容体（n A C h R）アロステリックモジュレーター、例えば、スピノシン系、例えば、スピネトラム、及び、スピノサド。

## 【 0 0 8 4 】

( 6 ) グルタミン酸制御塩化物チャンネル（G l u C l）アロステリックモジュレーター、例えば、アベルメクチン系 / ミルベマイシン系、例えば、アバメクチン、エマメクチン安息香酸塩、レピメクチン、及び、ミルベメクチン。

## 【 0 0 8 5 】

( 7 ) 幼若ホルモン模倣物質、例えば、幼若ホルモン類似体、例えば、ハイドロプレノ、キノプレノ、及び、メトプレノ；又は、フェノキシカルブ；又は、ピリプロキシフェン。

## 【 0 0 8 6 】

( 8 ) 種々の特定されていない（多部位）阻害薬、例えば、ハロゲン化アルキル系、例えば、臭化メチル、及び、別のハロゲン化アルキル；又は、クロロピクリン；又は、フッ化スルフリル；又は、ホウ砂；又は、吐酒石、又は、イソシアン酸メチル生成物質、例えば、ダゾメット（d i a z o m e t）及びメタム。

## 【 0 0 8 7 】

( 9 ) 弦音器官モジュレーター、例えば、ピメトロジン；又は、フロニカミド。

10

20

30

40

50

## 【0088】

(10) ダニ成長阻害薬、例えば、  
クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及び、ジフロピダジン；又は、  
エトキサゾール。

## 【0089】

(11) 昆虫中腸膜の微生物ディスラプター、例えば、  
バシルス・ツリングエンシス・亜種・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis subspecies israelensis*)、バシルス・ス  
ファエリクス (*Bacillus sphaericus*)、バシルス・ツリングエンシ  
ス・亜種・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subspecies aizawai*)、バシルス・ツリングエンシス・亜種・クルスタキ (*Bacillus thuringiensis subspecies kurstaki*)、  
バシルス・ツリングエンシス・亜種・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis subspecies tenebrionis*)、及び、Bt植物  
タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry  
2Ab、VIP3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/  
35Ab1。

10

## 【0090】

(12) ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター  
、例えば、  
ジアフェンチウロン；又は、  
有機スズ化合物、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン、及び、酸化フェンブタスズ  
；又は、  
プロパルギット；又は、テトラジホン。

20

## 【0091】

(13) プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、  
クロルフェナピル、DNOC、及び、スルフルアミド。

## 【0092】

(14) ニコチン性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬、例えば、  
ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、及び、チオスルタップ・ナトリウ  
ム。

30

## 【0093】

(15) キチン生合成の阻害薬（タイプ0）、例えば、  
ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フ  
ルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テ  
フルベンズロン、及び、トリフルムロン。

## 【0094】

(16) キチン生合成の阻害薬（タイプ1）、例えば、  
ブプロフェジン。

## 【0095】

(17) 脱皮ディスラプター（特に、双翅目の場合）、例えば、  
シロマジン。

40

## 【0096】

(18) エクジソン受容体作動薬、例えば、  
クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、及び、テブフェノジド。

## 【0097】

(19) オクトパミン受容体作動薬、例えば、  
アミトラズ。

## 【0098】

(20) ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬、例えば、

50

ヒドラメチルノン；又は、アセキノシル；又は、フルアクリピリム。

【0099】

(21) ミトコンドリア複合体Ⅰ電子伝達阻害薬、例えば、  
METI殺ダニ剤、例えば、フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、  
ピリダベン、テブフェンピラド、及び、トルフェンピラド；又は、  
ロテノン(Derris)。

【0100】

(22) 電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬、例えば、  
インドキサカルブ；又は、メタフルミゾン。

【0101】

(23) アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬、例えば、  
テトロン酸誘導体及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシ  
フェン、及び、スピロテトラマト。

【0102】

(24) ミトコンドリア複合体Ⅳ電子伝達阻害薬、例えば、  
ホスフィン系、例えば、リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィン、及び、  
リン化亜鉛；又は、  
シアン化物、シアン化カルシウム、シアン化カリウム、及び、シアン化ナトリウム。

【0103】

(25) ミトコンドリア複合体Ⅱ電子伝達阻害薬、例えば、  
- ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェン、及び、シフルメトフェン、及び  
、カルボキシアニリド、例えば、ピフルブミド。

【0104】

(28) リアノジン受容体モジュレーター、例えば、  
ジアミド系、例えば、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、及び、フ  
ルベンジアミド。

【0105】

さらなる活性成分、例えば、アフィドピロペン、アフォキシレイナー、アザジラクチン  
、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロフラニリド(broflan  
ilide)、プロモプロピレート、キノメチオナート、クロロプラレトリン(chl  
oroprallethrin)、氷晶石(cryolite)、シクラニリプロール、  
シクロキサプリド(cycloxadiprid)、シハロジアミド(cyhalodiam  
ide)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)、ジコホル、  
- メ  
トフルトリン(epsilon metofluthrin)、  
- モムフルトリン(e  
psilon momfluthrin)、フロメトキン、フルアザインドリジン(fl  
uaza indolizine)、フルエンスルホン、フルフェネリム、フルフェノキシ  
ストロピン、フルフィプロール、フルヘキサホン(fluhexafon)、フルオピラ  
ム、フルララネル、フルキサメタミド、フフェノジド(fufenozide)、グアジ  
ピル(guadipyr)、ヘプタフルトリン、イミダクロチズ、イプロジオン、  
- ビ  
フェントリン、  
- テフルトリン、ロチラネル(lotilaner)、メベルフルトリ  
ン、パイコングディング(paichongding)、ピリダリル、ピリフルキナゾン  
、ピリミノストロピン、スピロブジクロフェン(spirobudiclofen)、テ  
トラメチルフルトリン、テトラニリプロール(tetraniliprole)、テトラ  
クロラントラニリプロール(tetrachlorantraniliprole)、チ  
オキサザフェン、チオフルオキシメート(thiofluoximate)、トリフルメ  
ゾピリム、及び、ヨードメタン；さらに、バシルス・フィルムス(Bacillus f  
irmus)に基づく調製物(I-1582, BioNeem, Votivo)、及  
び、以下の化合物：  
1 - { 2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [ ( 2 , 2 , 2 - トリフル  
オロエチル ) スルフィニル ] フェニル } - 3 - ( トリフルオロメチル ) - 1 H - 1 , 2 ,  
4 - トリアゾール - 5 - アミン ( WO 2 0 0 6 / 0 4 3 6 3 5 から既知 ) ( CAS 8 8

10

20

30

40

50

5026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-エン-1-イル]-5-フルオロスピロ[インドール-3,4'-ピペリジン]-1(2H)-イル}(2-クロロピリジン-4-イル)メタノン(WO2003/106457から既知)(CAS 637360-23-7)、2-クロロ-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-クロロフェニル)プロパ-2-エン-1-イル]ピペリジン-4-イル}-4-(トリフルオロメチル)フェニル]イソニコチンアミド(WO2006/003494から既知)(CAS 872999-66-1)、3-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-4-ヒドロキシ-8-メトキシ-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2-オン(WO2010052161から既知)(CAS 1225292-17-0)、3-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-8-メトキシ-2-オキソ-1,8-ジアザスピロ[4.5]デカ-3-エン-4-イル エチルカルボネート(EP2647626から既知)(CAS-1440516-42-6)、4-(ブタ-2-イン-1-イルオキシ)-6-(3,5-ジメチルピペリジン-1-イル)-5-フルオロピリミジン(WO2004/099160から既知)(CAS 792914-58-0)、PF1364(JP2010/018586から既知)(CAS Reg. No. 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]ピリジン-2(1H)-イリデン]-2,2,2-トリフルオロアセトアミド(WO2012/029672から既知)(CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-1,1,1-トリフルオロプロパン-2-オン(WO2013/144213から既知)(CAS 1461743-15-6)、N-[3-(ベンジルカルバモイル)-4-クロロフェニル]-1-メチル-3-(ペンタフルオロエチル)-4-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(WO2010/051926から既知)(CAS 1226889-14-0)、5-プロモ-4-クロロ-N-[4-クロロ-2-メチル-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)ピラゾール-3-カルボキサミド(CN103232431から既知)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(シス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミド、4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(トランス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミド及び4-[(5S)-5-(3,5-ジクロロフェニル)-4,5-ジヒドロ-5-(トリフルオロメチル)-3-イソオキサゾリル]-2-メチル-N-(シス-1-オキシド-3-チエタニル)ベンズアミド(WO2013/050317A1から既知)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド、(+)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド及び(-)-N-[3-クロロ-1-(3-ピリジニル)-1H-ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-[(3,3,3-トリフルオロプロピル)スルフィニル]プロパンアミド(WO2013/162715A2、WO2013/162716A2、US2014/0213448A1から既知)(CAS 1477923-37-7)、5-[[[(2E)-3-クロロ-2-プロペン-1-イル]アミノ]-1-[2,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル(CN101337937Aから既知)(CAS 1105672-77-2)、3-プロモ-N-[4-クロロ-2-メチル-6-[(メチルアミノ)チオキソメチル]フェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド、(Liudai ben jia x u a n a n、CN103109816Aから既知)(CAS 1232543-85-9); N-[4-クロロ-2-[[[(1,1-ジメチルエチル)アミノ]カルボニル]-6-

10

20

30

40

50



メチルフェニル] - 1 - ( 3 - クロロ - 2 - ピリジニル ) - 3 - ( フルオロメトキシ ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド ( WO 2 0 1 2 / 0 3 4 4 0 3 A 1 から既知 ) ( CAS 1 2 6 8 2 7 7 - 2 2 - 0 )、N - [ 2 - ( 5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル ) - 4 - クロロ - 6 - メチルフェニル ] - 3 - プロモ - 1 - ( 3 - クロロ - 2 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド ( WO 2 0 1 1 / 0 8 5 5 7 5 A 1 から既知 ) ( CAS 1 2 3 3 8 8 2 - 2 2 - 8 )、4 - [ 3 - [ 2 , 6 - ジクロロ - 4 - [ ( 3 , 3 - ジクロロ - 2 - プロペン - 1 - イル ) オキシ ] フェノキシ ] プロポキシ ] - 2 - メトキシ - 6 - ( トリフルオロメチル ) ピリミジン ( CN 1 0 1 3 3 7 9 4 0 A ) ( CAS 1 1 0 8 1 8 4 - 5 2 - 6 から既知 ) ; ( 2 E ) - 及び 2 ( Z ) - 2 - [ 2 - ( 4 - シアノフェニル ) - 1 - [ 3 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] エチリデン ] - N - [ 4 - ( ジフルオロメトキシ ) フェニル ] ヒドラジンカルボキサミド ( CN 1 0 1 7 1 5 7 7 4 A から既知 ) ( CAS 1 2 3 2 5 4 3 - 8 5 - 9 ) ; シクロプロパンカルボン酸 3 - ( 2 , 2 - ジクロロエテニル ) - 2 , 2 - ジメチル - 4 - ( 1 H - ベンズイミダゾール - 2 - イル ) フェニルエステル ( CN 1 0 3 5 2 4 4 2 2 A から既知 ) ( CAS 1 5 4 2 2 7 1 - 4 6 - 4 ) ; ( 4 a S ) - 7 - クロロ - 2 , 5 - ジヒドロ - 2 - [ [ ( メトキシカルボニル ) [ 4 - [ ( トリフルオロメチル ) チオ ] フェニル ] アミノ ] カルボニル ] インデノ [ 1 , 2 - e ] [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアジン - 4 a ( 3 H ) - カルボン酸メチルエステル ( CN 1 0 2 3 9 1 2 6 1 A から既知 ) ( CAS 1 3 7 0 3 5 8 - 6 9 - 2 ) ; 6 - デオキシ - 3 - O - エチル - 2 , 4 - ジ - O - メチル - 1 - [ N - [ 4 - [ 1 - [ 4 - ( 1 , 1 , 2 , 2 , 2 - ペンタフルオロエトキシ ) フェニル ] - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 3 - イル ] フェニル ] カルバメート ] - L - マンノピラノース ( US 2 0 1 4 / 0 2 7 5 5 0 3 A 1 から既知 ) ( CAS 1 1 8 1 2 1 3 - 1 4 - 8 ) ; 8 - ( 2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ ) - 3 - ( 6 - トリフルオロメチルピリダジン - 3 - イル ) - 3 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン ( CAS 1 2 5 3 8 5 0 - 5 6 - 4 )、( 8 - アンチ ) - 8 - ( 2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ ) - 3 - ( 6 - トリフルオロメチルピリダジン - 3 - イル ) - 3 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン ( CAS 9 3 3 7 9 8 - 2 7 - 7 )、( 8 - シン ) - 8 - ( 2 - シクロプロピルメトキシ - 4 - トリフルオロメチルフェノキシ ) - 3 - ( 6 - トリフルオロメチルピリダジン - 3 - イル ) - 3 - アザビシクロ [ 3 . 2 . 1 ] オクタン ( WO 2 0 0 7 0 4 0 2 8 0 A 1、WO 2 0 0 7 0 4 0 2 8 2 A 1 から既知 ) ( CAS 9 3 4 0 0 1 - 6 6 - 8 )、及び、N - [ 3 - クロロ - 1 - ( 3 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - イル ] - N - エチル - 3 - [ ( 3 , 3 , 3 - トリフルオロプロピル ) チオ ] プロパンアミド ( WO 2 0 1 5 / 0 5 8 0 2 1 A 1、WO 2 0 1 5 / 0 5 8 0 2 8 A 1 から既知 ) ( CAS 1 4 7 7 9 1 9 - 2 7 - 9 )。

#### 【 0 1 0 6 】

##### 殺菌剤

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

#### 【 0 1 0 7 】

クラス ( 1 ) ~ ( 1 5 ) に記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することができる。クラス ( 1 ) ~ ( 1 5 ) の記載されている全ての殺菌剤混合成分は、場合により、互変異性体形態を包含し得る。

#### 【 0 1 0 8 】

( 1 ) エルゴステロール生合成の阻害薬、例えば、( 1 . 0 0 1 ) シプロコナゾール、( 1 . 0 0 2 ) ジフェノコナゾール、( 1 . 0 0 3 ) エポキシコナゾール、( 1 . 0 0

10

20

30

40

50

4) フェンヘキサミド、(1.005) フェンプロピジン、(1.006) フェンプロピモルフ、(1.007) フェンピラザミン、(1.008) フルキンコナゾール、(1.009) フルトリアホール、(1.010) イマザリル、(1.011) 硫酸イマザリル、(1.012) イブコナゾール、(1.013) メトコナゾール、(1.014) ミクロブタニル、(1.015) バクロブトラゾール、(1.016) プロクロラズ、(1.017) プロピコナゾール、(1.018) プロチオコナゾール、(1.019) ピリソキサゾール、(1.020) スピロキサミン、(1.021) テブコナゾール、(1.022) テトラコナゾール、(1.023) トリアジメノール、(1.024) トリデモルフ、(1.025) トリチコナゾール、(1.026) (1R, 2S, 5S) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.027) (1S, 2R, 5R) - 5 - (4 - クロロベンジル) - 2 - (クロロメチル) - 2 - メチル - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) シクロペンタノール、(1.028) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール (1.029) (2R) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.030) (2R) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.031) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1R) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.032) (2S) - 2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 4 - [(1S) - 2, 2 - ジクロロシクロプロピル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ブタン - 2 - オール、(1.033) (2S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 1 - (1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール、(1.034) (R) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.035) (S) - [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.036) [3 - (4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル) - 5 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 2 - オキサゾール - 4 - イル] (ピリジン - 3 - イル) メタノール、(1.037) 1 - ({(2R, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル}メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.038) 1 - ({(2S, 4S) - 2 - [2 - クロロ - 4 - (4 - クロロフェノキシ) フェニル] - 4 - メチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル}メチル) - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール、(1.039) 1 - {[3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.040) 1 - {[rel(2R, 3R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.041) 1 - {[rel(2R, 3S) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) オキシラン - 2 - イル]メチル} - 1H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 5 - イルチオシアネート、(1.042) 2 - [(2R, 4R, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.043) 2 - [(2R, 4R, 5S) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、(1.044) 2 - [(2R, 4S, 5R) - 1 - (2, 4 - ジクロロフェニル) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4

10

20

30

40

50

- イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 5 ) 2 - [ ( 2 R , 4 S , 5 S ) - 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 6 ) 2 - [ ( 2 S , 4 R , 5 R ) - 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 7 ) 2 - [ ( 2 S , 4 R , 5 S ) - 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 8 ) 2 - [ ( 2 S , 4 S , 5 R ) - 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 4 9 ) 2 - [ ( 2 S , 4 S , 5 S ) - 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 5 0 ) 2 - [ 1 - ( 2, 4 - ジクロロフェニル ) - 5 - ヒドロキシ - 2, 6, 6 - トリメチルヘプタン - 4 - イル] - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 5 1 ) 2 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 2, 4 - ジクロロフェノキシ ) フェニル ] - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、( 1 . 0 5 2 ) 2 - [ 2 - クロロ - 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) フェニル ] - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ブタン - 2 - オール、( 1 . 0 5 3 ) 2 - [ 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) - 2 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ブタン - 2 - オール、( 1 . 0 5 4 ) 2 - [ 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) - 2 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ) ペンタン - 2 - オール、( 1 . 0 5 5 ) 2 - [ 4 - ( 4 - クロロフェノキシ ) - 2 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル ) プロパン - 2 - オール、( 1 . 0 5 6 ) 2 - { [ 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 5 7 ) 2 - { [ r e l ( 2 R , 3 R ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 5 8 ) 2 - { [ r e l ( 2 R , 3 S ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 2, 4 - ジヒドロ - 3 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - チオン、( 1 . 0 5 9 ) 5 - ( 4 - クロロベンジル ) - 2 - ( クロロメチル ) - 2 - メチル - 1 - ( 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル ) シクロペンタノール、( 1 . 0 6 0 ) 5 - ( アリルスルファニル ) - 1 - { [ 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、( 1 . 0 6 1 ) 5 - ( アリルスルファニル ) - 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 R ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、( 1 . 0 6 2 ) 5 - ( アリルスルファニル ) - 1 - { [ r e l ( 2 R , 3 S ) - 3 - ( 2 - クロロフェニル ) - 2 - ( 2, 4 - ジフルオロフェニル ) オキシラン - 2 - イル ] メチル } - 1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール、( 1 . 0 6 3 ) N ' - ( 2, 5 - ジメチル - 4 - { [ 3 - ( 1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ ) フェニル ] スルファニル } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、( 1 . 0 6 4 ) N ' - ( 2, 5 - ジメチル - 4 - { [ 3 - ( 2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ ) フェニル ] スルファニル } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、( 1 . 0 6 5 ) N ' - ( 2, 5 - ジメチル - 4 - { [ 3 - ( 2, 2, 3, 3 - テトラフルオロプロボキシ ) フェニル ] スルファニル } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、( 1 . 0 6 6 ) N ' - ( 2, 5 - ジメチル - 4 - { [ 3 - ( ペンタフルオロエトキシ ) フェニル ] スルファニル } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、( 1 . 0 6 7 ) N ' - ( 2, 5 - ジメ

チル - 4 - { 3 - [ ( 1 , 1 , 2 , 2 - テトラフルオロエチル ) スルファニル ] フェノキシ } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 6 8 ) N ' - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [ ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) スルファニル ] フェノキシ } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 6 9 ) N ' - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [ ( 2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロプロピル ) スルファニル ] フェノキシ } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 0 ) N ' - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - { 3 - [ ( ペンタフルオロエチル ) スルファニル ] フェノキシ } フェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 1 ) N ' - ( 2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシフェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 2 ) N ' - ( 4 - { [ 3 - ( ジフルオロメトキシ ) フェニル ] スルファニル } - 2 , 5 - ジメチルフェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 3 ) N ' - ( 4 - { 3 - [ ( ジフルオロメチル ) スルファニル ] フェノキシ } - 2 , 5 - ジメチルフェニル ) - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 4 ) N ' - [ 5 - ブロモ - 6 - ( 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 2 - イルオキシ ) - 2 - メチルピリジン - 3 - イル ] - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 5 ) N ' - { 4 - [ ( 4 , 5 - ジクロロ - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) オキシ ] - 2 , 5 - ジメチルフェニル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 6 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( 1 R ) - 1 - ( 3 , 5 - ジフルオロフェニル ) エトキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 7 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( 1 S ) - 1 - ( 3 , 5 - ジフルオロフェニル ) エトキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 8 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( シス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル ) オキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 7 9 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ ( トランス - 4 - イソプロピルシクロヘキシル ) オキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド、 ( 1 . 0 8 0 ) N ' - { 5 - ブロモ - 6 - [ 1 - ( 3 , 5 - ジフルオロフェニル ) エトキシ ] - 2 - メチルピリジン - 3 - イル } - N - エチル - N - メチルイミドホルムアミド。

# 【 0 1 0 9 】

( 2 ) 複合体 I 又は複合体 I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、 ( 2 . 0 0 1 ) ペンゾピンジフルピル、 ( 2 . 0 0 2 ) ビキサフェン、 ( 2 . 0 0 3 ) ボスカリド、 ( 2 . 0 0 4 ) カルボキシシン、 ( 2 . 0 0 5 ) フルオピラム、 ( 2 . 0 0 6 ) フルトラニル、 ( 2 . 0 0 7 ) フルキサピロキサド、 ( 2 . 0 0 8 ) フラメトピル、 ( 2 . 0 0 9 ) イソフエタミド、 ( 2 . 0 1 0 ) イソピラザム ( アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 S ) 、 ( 2 . 0 1 1 ) イソピラザム ( アンチ - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 R ) 、 ( 2 . 0 1 2 ) イソピラザム ( アンチ - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 S R ) 、 ( 2 . 0 1 3 ) イソピラザム ( シン - エピマー性ラセミ化合物 ( 1 R S , 4 S R , 9 R S ) とアンチ - エピマー性ラセミ化合物 ( 1 R S , 4 S R , 9 S R ) の混合物 ) 、 ( 2 . 0 1 4 ) イソピラザム ( シン - エピマー性エナンチオマー 1 R , 4 S , 9 R ) 、 ( 2 . 0 1 5 ) イソピラザム ( シン - エピマー性エナンチオマー 1 S , 4 R , 9 S ) 、 ( 2 . 0 1 6 ) イソピラザム ( シン - エピマー性ラセミ化合物 1 R S , 4 S R , 9 R S ) 、 ( 2 . 0 1 7 ) ペンフルフェン、 ( 2 . 0 1 8 ) ペンチオピラド、 ( 2 . 0 1 9 ) ピジフルメトフェン ( pydiflumetofen ) 、 ( 2 . 0 2 0 ) ピラジフルミド、 ( 2 . 0 2 1 ) セダキサソ、 ( 2 . 0 2 2 ) 1 , 3 - ジメチル - N - ( 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ) - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 3 ) 1 , 3 - ジメチル - N - [ ( 3 R ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、 ( 2 . 0 2 4 ) 1 , 3 - ジメチル - N - [ ( 3 S ) - 1 , 1 , 3 - トリメチル - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - インデン - 4 - イル ] - 1 H - ピラゾール - 4 -

カルボキサミド、(2.025)1-メチル-3-(トリフルオロメチル)-N-[2'-  
 -(トリフルオロメチル)ピフェニル-2-イル]-1H-ピラゾール-4-カルボキサ  
 ミド、(2.026)2-フルオロ-6-(トリフルオロメチル)-N-(1,1,3-  
 トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)ベンズアミド、(2.02  
 7)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチル-2,3-  
 ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2  
 .028)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3R)-1,1,3-トリ  
 メチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラゾール-4-カル  
 ボキサミド、(2.029)3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-[(3S)-  
 1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1H-ピラ  
 ザール-4-カルボキサミド、(2.030)3-(ジフルオロメチル)-N-(7-フル  
 オロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)-1  
 -メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.031)3-(ジフルオロメ  
 チル)-N-[(3R)-7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-2,3-ジヒドロ-  
 1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2  
 .032)3-(ジフルオロメチル)-N-[(3S)-7-フルオロ-1,1,3-  
 トリメチル-2,3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル]-1-メチル-1H-ピラ  
 ザール-4-カルボキサミド、(2.033)5,8-ジフルオロ-N-[2-(2-フル  
 オロ-4-{[4-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]オキシ}フェニル)  
 エチル]キナゾリン-4-アミン、(2.034)N-(2-シクロペンチル-5-フル  
 オロベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-  
 メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.035)N-(2-tert-  
 ブチル-5-メチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-  
 フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.036)N-(2-  
 tert-ブチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-  
 フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.037)N-  
 (5-クロロ-2-エチルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)  
 -5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.038)  
 N-(5-クロロ-2-イソプロピルベンジル)-N-シクロプロピル-3-(ジフルオ  
 ロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2  
 .039)N-[(1R,4S)-9-(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラ  
 ヒドロ-1,4-メタノナフタレン-5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチ  
 ル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.040)N-[(1S,4R)-9-  
 -(ジクロロメチレン)-1,2,3,4-テトラヒドロ-1,4-メタノナフタレン-  
 5-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキ  
 サミド、(2.041)N-[1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-メトキシプロパ  
 ン-2-イル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カル  
 ボキサミド、(2.042)N-[2-クロロ-6-(トリフルオロメチル)ベンジル]  
 -N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-  
 ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.043)N-[3-クロロ-2-フルオロ-6  
 -(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)  
 -5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.044)  
 N-[5-クロロ-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-N-シクロプロピル-3-  
 (ジフルオロメチル)-5-フルオロ-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサ  
 ミド、(2.045)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチル)-5-フルオロ-  
 1-メチル-N-[5-メチル-2-(トリフルオロメチル)ベンジル]-1H-ピラゾ  
 ール-4-カルボキサミド、(2.046)N-シクロプロピル-3-(ジフルオロメチ  
 ル)-5-フルオロ-N-(2-フルオロ-6-イソプロピルベンジル)-1-メチル-  
 1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、(2.047)N-シクロプロピル-3-(ジ  
 フルオロメチル)-5-フルオロ-N-(2-イソプロピル-5-メチルベンジル)-1

10

20

30

40

50

- メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 4 8 ) N - シクロプロピル  
 - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 -  
 メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボチオアミド、( 2 . 0 4 9 ) N - シクロプロピル  
 - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - N - ( 2 - イソプロピルベンジル ) - 1 -  
 メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 0 ) N - シクロプロピル -  
 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - N - ( 5 - フルオロ - 2 - イソプロピルベン  
 ジル ) - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 1 ) N - シク  
 ロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 2 - エチル - 4 , 5 - ジメチルベンジル  
 ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 2  
 ) N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 2 - エチル - 5 - フルオロベ  
 ンジル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 .  
 0 5 3 ) N - シクロプロピル - 3 - ( ジフルオロメチル ) - N - ( 2 - エチル - 5 - メチ  
 ルベンジル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド、( 2 .  
 0 5 4 ) N - シクロプロピル - N - ( 2 - シクロプロピル - 5 - フルオロベンジル )  
 - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カル  
 ボキサミド、( 2 . 0 5 5 ) N - シクロプロピル - N - ( 2 - シクロプロピル - 5 - メチ  
 ルベンジル ) - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾー  
 ル - 4 - カルボキサミド、( 2 . 0 5 6 ) N - シクロプロピル - N - ( 2 - シクロプロピ  
 ルベンジル ) - 3 - ( ジフルオロメチル ) - 5 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - ピラゾー  
 ル - 4 - カルボキサミド。

10

20

## 【 0 1 1 0 】

( 3 ) 複合体 I I I における呼吸鎖の阻害薬、例えば、( 3 . 0 0 1 ) アメトクトラ  
 ジン、( 3 . 0 0 2 ) アミスルプロム、( 3 . 0 0 3 ) アゾキシストロビン、( 3 . 0 0  
 4 ) クメトキシストロビン ( c o u m e t h o x y s t r o b i n )、( 3 . 0 0 5 ) ク  
 モキシストロビン、( 3 . 0 0 6 ) シアゾファミド、( 3 . 0 0 7 ) ジモキシストロビン  
 、( 3 . 0 0 8 ) エノキサストロビン、( 3 . 0 0 9 ) ファモキサドン、( 3 . 0 1 0 )  
 フェンアミドン、( 3 . 0 1 1 ) フルフェノキシストロビン ( f l u f e n o x y s t r  
 o b i n )、( 3 . 0 1 2 ) フルオキサストロビン、( 3 . 0 1 3 ) クレソキシム - メチ  
 ル、( 3 . 0 1 4 ) メトミノストロビン、( 3 . 0 1 5 ) オリサストロビン、( 3 . 0 1  
 6 ) ピコキシストロビン、( 3 . 0 1 7 ) ピラクロストロビン、( 3 . 0 1 8 ) ピラメ  
 ストロビン、( 3 . 0 1 9 ) ピラオキシストロビン、( 3 . 0 2 0 ) トリフロキシスト  
 ロビン、( 3 . 0 2 1 ) ( 2 E ) - 2 - { 2 - [ ( { [ ( 1 E ) - 1 - ( 3 - { [ ( E ) -  
 1 - フルオロ - 2 - フェニルビニル ] オキシ } フェニル ) エチリデン ] アミノ } オキシ )  
 メチル ] フェニル } - 2 - ( メトキシイミノ ) - N - メチルアセトアミド、( 3 . 0 2 2  
 ) ( 2 E , 3 Z ) - 5 - { [ 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル  
 ] オキシ } - 2 - ( メトキシイミノ ) - N , 3 - ジメチルペンタ - 3 - エンアミド、( 3  
 . 0 2 3 ) ( 2 R ) - 2 - { 2 - [ ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル }  
 - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、( 3 . 0 2 4 ) ( 2 S ) - 2 - { 2 - [ ( 2  
 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミ  
 ド、( 3 . 0 2 5 ) ( 3 S , 6 S , 7 R , 8 R ) - 8 - ベンジル - 3 - [ ( { 3 - [ ( イ  
 ソブチリルオキシ ) メトキシ ] - 4 - メトキシピリジン - 2 - イル } カルボニル ) アミノ  
 ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロ  
 パノエート、( 3 . 0 2 6 ) 2 - { 2 - [ ( 2 , 5 - ジメチルフェノキシ ) メチル ] フェ  
 ニル } - 2 - メトキシ - N - メチルアセトアミド、( 3 . 0 2 7 ) N - ( 3 - エチル - 3  
 , 5 , 5 - トリメチルシクロヘキシル ) - 3 - ホルムアミド - 2 - ヒドロキシベンズアミ  
 ド、( 3 . 0 2 8 ) ( 2 E , 3 Z ) - 5 - { [ 1 - ( 4 - クロロ - 2 - フルオロフェニル  
 ) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル ] オキシ } - 2 - ( メトキシイミノ ) - N , 3 - ジメチ  
 ルペンタ - 3 - エンアミド。

30

40

## 【 0 1 1 1 】

( 4 ) 有糸分裂及び細胞分裂の阻害薬、例えば、( 4 . 0 0 1 ) カルベンダジム、(

50

4 . 0 0 2 ) ジエトフェンカルブ、( 4 . 0 0 3 ) エタボキサム、( 4 . 0 0 4 ) フルオ  
 ピコリド、( 4 . 0 0 5 ) ペンシクロン、( 4 . 0 0 6 ) チアベンダゾール、( 4 . 0 0  
 7 ) チオファネート - メチル、( 4 . 0 0 8 ) ゾキサミド、( 4 . 0 0 9 ) 3 - クロロ -  
 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 6 - メチル - 5 - フェニルピリダジン、( 4 . 0  
 1 0 ) 3 - クロロ - 5 - ( 4 - クロロフェニル ) - 4 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル )  
 - 6 - メチルピリダジン、( 4 . 0 1 1 ) 3 - クロロ - 5 - ( 6 - クロロピリジン - 3 -  
 イル ) - 6 - メチル - 4 - ( 2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル ) ピリダジン、( 4 . 0  
 1 2 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル )  
 ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 3 ) 4 - ( 2 - ブロ  
 モ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - ブロモ - 6 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジ  
 メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 4 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオ  
 ロフェニル ) - N - ( 2 - ブロモフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5  
 - アミン、( 4 . 0 1 5 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロ  
 ロ - 6 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4  
 . 0 1 6 ) 4 - ( 2 - ブロモ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロフェニル ) -  
 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 7 ) 4 - ( 2 - ブロモ -  
 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピ  
 ラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 1 8 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N  
 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン  
 、( 4 . 0 1 9 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロ - 6 -  
 フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 0  
 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - N - ( 2 - クロロフェニル ) - 1 , 3 -  
 ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 1 ) 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フル  
 オロフェニル ) - N - ( 2 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール  
 - 5 - アミン、( 4 . 0 2 2 ) 4 - ( 4 - クロロフェニル ) - 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロ  
 フェニル ) - 3 , 6 - ジメチルピリダジン、( 4 . 0 2 3 ) N - ( 2 - ブロモ - 6 - フル  
 オロフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H  
 - ピラゾール - 5 - アミン、( 4 . 0 2 4 ) N - ( 2 - ブロモフェニル ) - 4 - ( 2 - ク  
 ロロ - 4 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン、( 4  
 . 0 2 5 ) N - ( 4 - クロロ - 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 - ( 2 - クロロ - 4  
 - フルオロフェニル ) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5 - アミン。

#### 【 0 1 1 2 】

( 5 ) 多部位に活性を示し得る化合物、例えば、( 5 . 0 0 1 ) ボルドー液、( 5 .  
 0 0 2 ) カプタホール、( 5 . 0 0 3 ) キャプタン、( 5 . 0 0 4 ) クロロタロニル ( c  
 h l o r t h a l o n i l )、( 5 . 0 0 5 ) 水酸化銅、( 5 . 0 0 6 ) ナフテン酸銅、  
 ( 5 . 0 0 7 ) 酸化銅、( 5 . 0 0 8 ) 塩基性塩化銅、( 5 . 0 0 9 ) 硫酸銅 ( 2 + )、  
 ( 5 . 0 1 0 ) ジチアノン、( 5 . 0 1 1 ) ドジン、( 5 . 0 1 2 ) ホルベット、( 5 .  
 0 1 3 ) マンゼブ、( 5 . 0 1 4 ) マンネブ、( 5 . 0 1 5 ) メチラム、( 5 . 0 1 6 )  
 メチラム亜鉛 ( z i n c m e t i r a m )、( 5 . 0 1 7 ) オキシシン銅 ( c o p p e r  
 o x i n e )、( 5 . 0 1 8 ) プロピネブ、( 5 . 0 1 9 ) 硫黄及び硫黄剤、例えば、  
 多硫化カルシウム、( 5 . 0 2 0 ) チウラム、( 5 . 0 2 1 ) ジネブ、( 5 . 0 2 2 ) ジ  
 ラム。

#### 【 0 1 1 3 】

( 6 ) 宿主の防御を誘発し得る化合物、例えば、( 6 . 0 0 1 ) アシベンゾラル - S  
 - メチル、( 6 . 0 0 2 ) イソチアニル、( 6 . 0 0 3 ) プロベナゾール、( 6 . 0 0 4  
 ) チアジニル。

#### 【 0 1 1 4 】

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

10

20

30

40

50

6) 3 - ( 5 - フルオロ - 3 , 3 , 4 , 4 - テトラメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン。

【 0 1 1 5 】

( 8 ) A T P 産生阻害薬、例えば、( 8 . 0 0 1 ) シルチオフアム。

【 0 1 1 6 】

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

10

【 0 1 1 7 】

( 1 0 ) 脂質及び膜の合成の阻害薬、例えば、( 1 0 . 0 0 1 ) プロパモカルブ、( 1 0 . 0 0 2 ) プロパモカルブ塩酸塩、( 1 0 . 0 0 3 ) トルクロホス - メチル。

【 0 1 1 8 】

( 1 1 ) メラニン生合成阻害薬、例えば、( 1 1 . 0 0 1 ) トリシクラゾール、( 1 1 . 0 0 2 ) 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル { 3 - メチル - 1 - [ ( 4 - メチルベンゾイル ) アミノ ] ブタン - 2 - イル } カルバメート。

20

【 0 1 1 9 】

( 1 2 ) 核酸合成阻害薬、例えば、( 1 2 . 0 0 1 ) ベナラキシル、( 1 2 . 0 0 2 ) ベナラキシル - M ( キララキシル )、( 1 2 . 0 0 3 ) メタラキシル、( 1 2 . 0 0 4 ) メタラキシル - M ( メフェノキサム )。

【 0 1 2 0 】

( 1 3 ) シグナル伝達阻害薬、例えば、( 1 3 . 0 0 1 ) フルジオキソニル、( 1 3 . 0 0 2 ) イプロジオン、( 1 3 . 0 0 3 ) プロシミドン、( 1 3 . 0 0 4 ) プロキナジド、( 1 3 . 0 0 5 ) キノキシフェン、( 1 3 . 0 0 6 ) ピンクロゾリン。

【 0 1 2 1 】

( 1 4 ) 脱共役剤として作用し得る化合物、例えば、( 1 4 . 0 0 1 ) フルアジナム、( 1 4 . 0 0 2 ) メブチルジノカップ。

30

【 0 1 2 2 】

( 1 5 ) さらなる化合物、例えば、( 1 5 . 0 0 1 ) アブシジン酸、( 1 5 . 0 0 2 ) ベンチアゾール、( 1 5 . 0 0 3 ) ベトキサジン、( 1 5 . 0 0 4 ) カプシマイシン ( c a p s i m y c i n )、( 1 5 . 0 0 5 ) カルボン、( 1 5 . 0 0 6 ) キノメチオネート、( 1 5 . 0 0 7 ) クフラネブ、( 1 5 . 0 0 8 ) シフルフェナミド、( 1 5 . 0 0 9 ) シモキサニル、( 1 5 . 0 1 0 ) シプロスルファミド、( 1 5 . 0 1 1 ) フルチアニル、( 1 5 . 0 1 2 ) ホセチル - アルミニウム、( 1 5 . 0 1 3 ) ホセチル - カルシウム、( 1 5 . 0 1 4 ) ホセチル - ナトリウム、( 1 5 . 0 1 5 ) イソチオシアン酸メチル、( 1 5 . 0 1 6 ) メトラフェノン、( 1 5 . 0 1 7 ) ミルディオマイシン、( 1 5 . 0 1 8 ) ナタマイシン、( 1 5 . 0 1 9 ) ジメチルジチオカルバミン酸ニッケル、( 1 5 . 0 2 0 ) ニトロタル - イソプロピル、( 1 5 . 0 2 1 ) オキサモカルブ ( o x a m o c a r b )、( 1 5 . 0 2 2 ) オキサチアピプロリン、( 1 5 . 0 2 3 ) オキシフェンチン ( o x y f e n t h i i n )、( 1 5 . 0 2 4 ) ペンタクロロフェノール及び塩、( 1 5 . 0 2 5 ) ホスホン酸及びその塩、( 1 5 . 0 2 6 ) プロパモカルブ - ホセチレート ( p r o p a m o c a r b - f o s e t y l a t e )、( 1 5 . 0 2 7 ) ピリオフェノン ( クラザフェノン ( c h l a z a f e n o n e ) )、( 1 5 . 0 2 8 ) テブフロキン、( 1 5 . 0 2 9 ) テクロフタラム、( 1 5 . 0 3 0 ) トルニファニド、( 1 5 . 0 3 1 ) 1 - ( 4 - { 4 - [ ( 5 R ) - 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル ] - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル } ピペリジン - 1 - イル ) -

40

50



2 - [ 5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] エタノ  
 ン、( 1 5 . 0 3 2 ) 1 - ( 4 - { 4 - [ ( 5 S ) - 5 - ( 2 , 6 - ジフルオロフェニル  
 ) - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル ] - 1 , 3 - チアゾール - 2 -  
 イル } ピペリジン - 1 - イル ) - 2 - [ 5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H  
 - ピラゾール - 1 - イル ] エタノン、( 1 5 . 0 3 3 ) 2 - ( 6 - ベンジルピリジン - 2  
 - イル ) キナゾリン、( 1 5 . 0 3 4 ) 2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [ 1 , 4 ] ジチ  
 イノ [ 2 , 3 - c : 5 , 6 - c ' ] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 ( 2 H , 6 H ) - テトロ  
 ン、( 1 5 . 0 3 5 ) 2 - [ 3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1  
 - イル ] - 1 - [ 4 - ( 4 - { 5 - [ 2 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニ  
 ル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2  
 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] エタノン、( 1 5 . 0 3 6 ) 2 - [ 3 , 5 - ビス (ジフ  
 ルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] - 1 - [ 4 - ( 4 - { 5 - [ 2 - クロロ  
 - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 - イルオキシ) フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 -  
 オキサゾール - 3 - イル } - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] エ  
 タノン、( 1 5 . 0 3 7 ) 2 - [ 3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール  
 - 1 - イル ] - 1 - [ 4 - ( 4 - { 5 - [ 2 - フルオロ - 6 - (プロパ - 2 - イン - 1 -  
 イルオキシ) フェニル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 3 - イル } - 1 ,  
 3 - チアゾール - 2 - イル ) ピペリジン - 1 - イル ] エタノン、( 1 5 . 0 3 8 ) 2 - [ 6  
 - ( 3 - フルオロ - 4 - メトキシフェニル ) - 5 - メチルピリジン - 2 - イル ] キナゾ  
 リン、( 1 5 . 0 3 9 ) 2 - { ( 5 R ) - 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3 , 5 - ビス (ジフルオ  
 ロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1 , 3  
 - チアゾール - 4 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3  
 - クロロフェニル メタンスルホネート、( 1 5 . 0 4 0 ) 2 - { ( 5 S ) - 3 - [ 2 -  
 ( 1 - { [ 3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル  
 } ピペリジン - 4 - イル ) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 ,  
 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - クロロフェニル メタンスルホネート、( 1 5 . 0  
 4 1 ) 2 - { 2 - [ ( 7 , 8 - ジフルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル ) オキシ ] -  
 6 - フルオロフェニル } プロパン - 2 - オール、( 1 5 . 0 4 2 ) 2 - { 2 - フルオロ -  
 6 - [ ( 8 - フルオロ - 2 - メチルキノリン - 3 - イル ) オキシ ] フェニル } プロパン -  
 2 - オール、( 1 5 . 0 4 3 ) 2 - { 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3 , 5 - ビス (ジフルオロメ  
 チル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン - 4 - イル ) - 1 , 3 - チ  
 アゾール - 4 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾール - 5 - イル } - 3 - ク  
 ロロフェニル メタンスルホネート、( 1 5 . 0 4 4 ) 2 - { 3 - [ 2 - ( 1 - { [ 3 ,  
 5 - ビス (ジフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル ] アセチル } ピペリジン -  
 4 - イル ) - 1 , 3 - チアゾール - 4 - イル ] - 4 , 5 - ジヒドロ - 1 , 2 - オキサゾ  
 ール - 5 - イル } フェニル メタンスルホネート、( 1 5 . 0 4 5 ) 2 - フェニルフェノ  
 ール及びその塩、( 1 5 . 0 4 6 ) 3 - ( 4 , 4 , 5 - トリフルオロ - 3 , 3 - ジメチル -  
 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン、( 1 5 . 0 4 7 ) 3 - ( 4 , 4 -  
 ジフルオロ - 3 , 3 - ジメチル - 3 , 4 - ジヒドロイソキノリン - 1 - イル ) キノリン、  
 ( 1 5 . 0 4 8 ) 4 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 - オール ( 互変異性形態 : 4  
 - アミノ - 5 - フルオロピリミジン - 2 ( 1 H ) - オン )、( 1 5 . 0 4 9 ) 4 - オキシ  
 - 4 - [ ( 2 - フェニルエチル ) アミノ ] 酪酸、( 1 5 . 0 5 0 ) 5 - アミノ - 1 , 3 ,  
 4 - チアジアゾール - 2 - チオール、( 1 5 . 0 5 1 ) 5 - クロロ - N ' - フェニル - N  
 ' - (プロパ - 2 - イン - 1 - イル ) チオフエン 2 - スルホノヒドラジド、( 1 5 . 0  
 5 2 ) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - フルオロベンジル ) オキシ ] ピリミジン - 4 - アミン  
 、( 1 5 . 0 5 3 ) 5 - フルオロ - 2 - [ ( 4 - メチルベンジル ) オキシ ] ピリミジン -  
 4 - アミン、( 1 5 . 0 5 4 ) 9 - フルオロ - 2 , 2 - ジメチル - 5 - (キノリン - 3 -  
 イル) - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 , 4 - ベンゾオキサゼピン、( 1 5 . 0 5 5 ) ブタ - 3 -  
 イン - 1 - イル { 6 - [ ( { [ ( Z ) - ( 1 - メチル - 1 H - テトラゾール - 5 - イル )  
 (フェニル) メチレン ] アミノ } オキシ ) メチル ] ピリジン - 2 - イル } カルバメート、

10

20

30

40

50

(15.056)(2Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニルアクリル酸エチル、  
(15.057)フェナジン-1-カルボン酸、(15.058)3,4,5-トリヒドロキシ安息香酸プロピル、(15.059)キノリン-8-オール、(15.060)キノリン-8-オールスルフェート(2:1)、(15.061){6-[({[(1-メチル-1H-テトラゾール-5-イル)(フェニル)メチレン]アミノ}オキシ)メチル]ピリジン-2-イル}カルバミン酸tert-ブチル。

#### 【0123】

混合成分としての生物学的殺有害生物剤

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

#### 【0124】

生物学的殺有害生物剤としては、特に、細菌類、菌類、酵母類、植物抽出物及び微生物によって形成される生成物(例えば、タンパク質及び二次代謝産物)などがある。

#### 【0125】

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

#### 【0126】

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

バシルス・アミロリクエファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)株FZB42(DSM 231179)、又は、バシルス・セレウス(*Bacillus cereus*)、特に、バシルス・セレウス(*B. cereus*)株CN CM I-1562、又は、バシルス・フィルムス(*Bacillus firmus*)株I-1582(受託番号 CNCM I-1582)、又は、バシルス・プミルス(*Bacillus pumilus*)、特に、株GB34(受託番号 ATCC 700814)及び株QST2808(受託番号 NRRL B-30087)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)、特に、株GB03(受託番号 ATCC SD-1397)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)株QST713(受託番号 NRRL B-21661)、又は、バシルス・スブチリス(*Bacillus subtilis*)株OST 30002(受託番号 NRRL B-50421)、バシルス・ツリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*)、特に、バシルス・ツリングエンシス 亜種 イスラエレンシス(*B. thuringiensis subspecies israelensis*)(抗原型 H-14)株AM65-52(受託番号 ATCC 1276)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 アイザワイ(*B. thuringiensis subsp. aizawai*)、特に、株ABTS-1857(SD-1372)、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 クルスタキ(*B. thuringiensis subsp. kurstaki*)株HD-1、又は、バシルス・ツリングエンシス 亜種 テネブリオニス(*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*)株NB 176(SD-5428)、パステウリア・ペネトランス(*Pasteuria penetrans*)、パステウリア属種(*Pasteuria spp.*)(ロチレンクルス・レニホルミス(*Rotylenchulus reniformis*)線虫)-PR3(受託番号 ATCC SD-5834)、ストレプトミセス・ミクロフラブス(*Streptomyces microflavus*)株AQ6121(=QRD 31.013、NRRL B-50550)、ストレプトミセス・ガルブス(*Streptomyces galbus*)株AQ 6047(受託番号 NRRL 30232)。

#### 【0127】

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

ベアウベリア・バシアナ(*Beauveria bassiana*)、特に、株ATCC

10

20

30

40

50

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

#### 【0128】

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

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

#### 【0129】

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

アグロバクテリウム属種(*Agrobacterium* spp.)、アゾリゾビウム・カウリノダンス(*Azorhizobium caulinodans*)、アゾスピリillum属種(*Azospirillum* spp.)、アゾトバクテル属種(*Azotobacter* spp.)、ブラジリゾビウム属種(*Bradyrhizobium* spp.)、ブルクホルデリア属種(*Burkholderia* spp.)、特に、ブルクホルデリア・セパシア(*Burkholderia cepacia*) (以前は、プセウドモナス・セパシア(*Pseudomonas cepacia*)として知られていた)、ギガスポラ属種(*Gigaspora* spp.)又はギガスポラ・モノスポルム(*Gigaspora monosporum*)、グロムス属種(*Glomus* spp.)、ラッカリア属種(*Laccaria* spp.)、ラクトバシルス・ブクネリ(*Lactobacillus buchneri*)、パラグロムス属種(*Paraglomus* spp.)、ピソリツス・チンクトルス(*Pisolithus tinctorius*)、プセウドモナス属種(*Pseudomonas* spp.)、リゾビウム属種(*Rhizobium* spp.)、特に、リゾビウム・トリホリイ(*Rhizobium trifolii*)、リゾポゴン属種(*Rhizopogon* spp.)、スクレロデルマ属種(*Scleroderma* spp.)、スイルス属種(*Suillus* spp.)、ストレプトミセス属種(*Streptomyces* spp.)。

## 【0130】

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

ニンニク (*Allium sativum*)、ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*)、アザジラクチン (*azadirachtin*)、Biokeeper WP、カシヤ・ニグリカンス (*Cassia nigricans*)、セラストルス・アングラツス (*Celastrus angulatus*)、アメリカアリタソウ (*Chenopodium anthelminticum*)、キチン、Armour-Zen、セイヨウオシダ (*Dryopteris filix-mas*)、スギナ (*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、Fungastop、Heads Up (キノア (*Chenopodium quinoa*) サボニン抽出物)、除虫菊 (*pyrethrum/pyrethrins*)、スリナムニガキ (*Quassia amara*)、コナラ属 (*Quercus*)、キラヤ属 (*Quillaja*)、Regalia、(「Requiem<sup>TM</sup> Insecticide」)、ロテノン、リアニアノリアノジン、ヒレハリソウ (*Symphytum officinale*)、ヨモギギク (*Tanacetum vulgare*)、チモール、Triact 70、TriCon、キンレンカ (*Tropaeolum majus*)、セイヨウイラクサ (*Urtica dioica*)、Veratrin、セイヨウヤドリギ (*Viscum album*)、アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特に、ナタネ粉末又はカラシナ粉末。

## 【0131】

混合成分としての薬害軽減剤

式 (I) で表される化合物は、薬害軽減剤、例えば、ベノキサコール、クロキントセツト (-メキシル)、シオメトリニル、シプロスルファミド、ジクロロミド、フェンクロラゾール (-エチル)、フェンクロリム、フルラゾール、フルキソフェニム、フリラゾール、イソキサジフェン (-エチル)、メフェンピル (-ジエチル)、ナフタル酸無水物、オキサベトリニル、2-メトキシ-N-( { 4-[ (メチルカルバモイル) アミノ] フェニル } スルホニル) ベンズアミド (CAS 129531-12-0)、4-(ジクロロアセチル)-1-オキサ-4-アザスピロ[4.5]デカン (CAS 71526-07-3)、2,2,5-トリメチル-3-(ジクロロアセチル)-1,3-オキサゾリジン (CAS 52836-31-4) などと組み合わせることができる。

## 【0132】

植物及び植物の部分

本発明に従って、全ての植物及び植物の部分进行处理することができる。ここで、植物は、望ましい及び望ましくない野生植物又は作物植物（天然に発生している作物植物を包含する）のような全ての植物及び植物個体群、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、ピーマン、キュウリ、メロン、ニンジン、スイカ、タマネギ、レタス、ハウレンソウ、リーキ、インゲンマメ、アブラナ科アブラナ属の植物 (*Brassica oleracea*) (例えば、キャベツ) 及び他の野菜種、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（ここで、果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウである）などを意味するものと理解される。作物植物は、慣習的な育種法と最適化法によって得ることができる植物であり得るか、又は、生物工学的な方法と遺伝子工学的な方法によって得ることができる植物であり得るか、又は、前記方法の組合せによって得ることができる植物であることができる。そのような作物植物には、トランスジェニック植物も包含され、また、植物育種家の権利によって保護され得る植物品種又は保護され得ない植物品種も包含される。植物は、全ての生育段階、例えば、種子、実生、及び、幼植物（未成熟植物）から成熟した植物までを、意味するものと理解されるべきである。植物の部分は、苗条、葉、花及び根などの、植物の地上部及び地下部の全ての部分及び器官を意味するものと理

解されるべきであり、挙げられる例は、葉、針状葉、茎、幹、花、子実体、果実及び種子、並びに、さらに、根、塊茎及び根茎などである。収穫された植物又は収穫された植物の部分、並びに、栄養繁殖器官 (vegetative propagation material) 及び生殖繁殖器官 (generative propagation material)、例えば、挿穂 (cutting)、塊茎、根茎、かき苗 (slip) 及び種子なども、植物の部分に包含される。

#### 【0133】

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

#### 【0134】

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

#### 【0135】

トランスジェニック植物、種子処理、及び、統合イベント (integration events)

特に有利で有益な特性 (「形質」) を植物に付与する遺伝物質を遺伝子修飾を介して受け取った全ての植物は、本発明に従って処理される好ましいトランスジェニック植物又は植物品種 (遺伝子工学により得られたもの) に包含される。そのような特性の例は、植物の向上した生育、高温又は低温に対する向上した耐性、湯水又は水中若しくは土壤中に含まれる塩分のレベルに対する向上した耐性、高められた開花能力、向上した収穫の容易性、促進された成熟、増加した収穫量、収穫された生産物の向上した品質及び / 又は向上した栄養価、収穫された生産物の改善された貯蔵寿命及び / 又は改善された加工性などである。そのような特性のさらに別の特に重要な例は、害虫及び有害微生物 (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類) に対する植物の向上した抵抗性、例えば、植物体内で形成された毒素による、特に、バシルス・ツリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する遺伝物質 (例えば、遺伝子 Cry I A (a)、Cry I A (b)、Cry I A (c)、Cry I I A、Cry I I I A、Cry I I I B 2、Cry 9 c、Cry 2 A b、Cry 3 B b 及び Cry I F 並びにそれらの組合せ) によって植物体内で形成された毒素による、害虫及び有害微生物 (例えば、昆虫類、クモ形類動物、線虫類、ダニ類、ナメクジ類及びカタツムリ類) に対する植物の向上した抵抗性、さらに、植物病原性の菌類、細菌類及び / 又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、例えば、全身獲得抵抗性 (SAR)、システミン (systemin)、フィトアレキシン、誘導因子並びに抵抗性遺伝子とそれにより発現されるタンパク質及び毒素による、植物病原性の菌類、細菌類及び / 又はウイルス類に対する植物の向上した抵抗性、及び、さらに、特定の除草活性化化合物 (例えば、イミダゾリノン系、スルホニル尿素系、グリホセート又はホスフィノトリシン) に対する植物の向上した耐性

である（例えば、「PAT」遺伝子）。望まれる当該特性（「形質」）を付与する遺伝子は、トランスジェニック植物体内で、互いに組み合わせて存在させることも可能である。上記トランスジェニック植物の例としては、重要な作物植物、例えば、穀類（コムギ、イネ、ライコムギ、オオムギ、ライムギ、エンバク）、トウモロコシ、ダイズ、ジャガイモ、テンサイ、サトウキビ、トマト、エンドウマメ及び他の種類の野菜、ワタ、タバコ、ナタネ、並びに、さらに、果実植物（ここで、該果実は、リンゴ、ナシ、柑橘類果実及びブドウである）などを挙げることができ、トウモロコシ、ダイズ、コムギ、イネ、ジャガイモ、ワタ、サトウキビ、タバコ及びナタネは特に重要である。特に重要な特性（「形質」）は、昆虫類、クモ形類動物、線虫類並びにナメクジ類及びカタツムリ類に対する植物の向上した抵抗性である。

10

#### 【0136】

##### 作物保護 - 処理の種類

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

20

#### 【0137】

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

#### 【0138】

浸透移行性活性化合物の場合、式（I）で表される化合物は、さらにまた、根系を介しても植物に達する。その場合、該植物は、その植物の生息環境に対して式（I）で表される化合物を作用させることによって処理する。これは、例えば、灌漑（drenching）によって、又は、土壌若しくは栄養溶液に混合させる（即ち、植物の成育場所（例えば、土壌、又は、水耕系）に式（I）で表される化合物の液体形態を含浸させる）ことによって、又は、土壌施用（即ち、本発明による式（I）で表される化合物を固体形態で（例えば、顆粒形態で）植物の成育場所に導入する）ことによって、達成することができる。水稻作物の場合には、これは、固体施用形態にある式（I）で表される化合物（例えば、粒剤として）を計量して湛水された水田に供給することによっても、達成することができる。

30

#### 【0139】

##### 種子の処理

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

40

50

## 【 0 1 4 0 】

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

## 【 0 1 4 1 】

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

10

## 【 0 1 4 2 】

本発明は、さらに、害虫に対して保護されるように、本発明による式（Ⅰ）で表される化合物で処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（Ⅰ）で表される化合物と混合成分によって同時に処理された種子にも関する。本発明は、さらに、式（Ⅰ）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子にも関する。式（Ⅰ）で表される化合物と混合成分によって異なった時点で処理された種子の場合、個々の物質は、その種子の表面上の異なった層の中に存在し得る。この場合、式（Ⅰ）で表される化合物と混合成分を含んでいる層は、場合により、中間層によって分離させることができる。本発明は、さらにまた、式（Ⅰ）で表される化合物と混合成分が被膜の一部として又は被膜に加えられたさらなる１つの層若しくは複数の層として施用されている種子にも関する。

20

## 【 0 1 4 3 】

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

## 【 0 1 4 4 】

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

## 【 0 1 4 5 】

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

30

## 【 0 1 4 6 】

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

## 【 0 1 4 7 】

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

40

## 【 0 1 4 8 】

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

## 【 0 1 4 9 】

50

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

#### 【０１５０】

本発明に関連して、式（Ⅰ）で表される化合物は、種子に対して施用する。該種子は、好ましくは、処理の過程で損傷が起こらないように十分に安定な状態で処理する。一般に、該種子は、収穫と播種の間の任意の時点で処理することができる。慣習的には、植物から分離されていて、穂軸、殻、葉柄、外皮、被毛又は果肉が除かれている種子を使用する。例えば、収穫され、不純物が取り除かれ、及び、貯蔵を可能とする含水量となるまで乾燥された種子を使用することができる。あるいは、乾燥後に例えば水で処理され、その後再度乾燥された種子（例えば、プライミング）を使用することもできる。イネの種子の場合、イネ胚の特定の段階（鳩胸段階）に達するまで、例えば水中に、浸漬させた種子を使用することも可能であり、それによって、発芽が刺激され、及び、出芽がより均一になる。

#### 【０１５１】

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

#### 【０１５２】

一般に、式（Ⅰ）で表される化合物は、適切な製剤の形態で種子に施用する。種子を処理するための適切な製剤及びプロセスは、当業者には知られている。

#### 【０１５３】

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

#### 【０１５４】

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

#### 【０１５５】

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

#### 【０１５６】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な湿潤剤は、農薬活性成分の製剤に関して慣習的な、湿潤を促進する全ての物質である。



好ましくは、アルキルナフタレンスルホネート類、例えば、ジイソプロピルナフタレンスルホネート又はジイソブチルナフタレンスルホネートなどを使用することができる。

【0157】

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

10

【0158】

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

【0159】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる防腐剤は、農薬組成物中で当該目的のために使用することが可能な全ての物質である。例として、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールなどを挙げることができる。

20

【0160】

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

【0161】

本発明に従って使用することが可能な種子粉衣製剤の中に存在させることができる有用な粘着剤は、種子粉衣製品中で使用可能な全ての慣習的な結合剤である。好ましい例としては、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール及びチロースなどを挙げることができる。

30

【0162】

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

【0163】

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

40

【0164】

50

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

#### 【0165】

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

#### 【0166】

##### 動物衛生

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

#### 【0167】

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

#### 【0168】

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

#### 【0169】

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

#### 【0170】

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

#### 【0171】

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

#### 【0172】

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

#### 【0173】

動物衛生の分野に関連して、用語「防除する（control）」又は「防除する（controlling）」は、本発明に関連しては、式（I）で表される化合物が、寄生生物に感染している動物におけるその個々の寄生生物の発生を害がない程度にまで低減さ

10

20

30

40

50

せることにおいて有効であることを意味する。さらに具体的には、「防除する」は、本発明に関連して、式(Ⅰ)で表される化合物が、個々の寄生生物を殺すこと、その成長を阻害すること、又は、その増殖を阻害することを意味する。

#### 【0174】

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

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

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

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

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

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

10

20

30

40

50

害虫。

【0175】

さらに、節足動物の場合、限定するものではないが、例として以下のダニ類も挙げるべきである：

ダニ亜綱 (Acarari (Acarina)) 及びメタスチグマタ目 (Metastigmata) の、例えば、ヒメダニ科 (Argasidae) の、例えば、アルガス属種 (Argas spp.)、オルニトドルス属種 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属種 (Otobius spp.)、マダニ科 (Ixodidae) の、例えば、アンブリオンマ属種 (Amblyomma spp.)、デルマセントル属種 (Dermacentor spp.)、ハエマフィサリス属種 (Haemaphysalis spp.)、ヒアロンマ属種 (Hyalomma spp.)、イキシデス属種 (Ixodes spp.)、リピセファルス (ボオフィルス) 属種 (Rhipicephalus (Boophilus) spp.)、リピセファルス属種 (Rhipicephalus spp. (多宿主ダニの原属))；メソスチグマタ目 (Mesostigmata) の、例えば、デルマニッス属種 (Dermanyssus spp.)、オルニトニッス属種 (Ornithonyssus spp.)、プネウモニッス属種 (Pneumonyssus spp.)、ライリエチア属種 (Raillietia spp.)、ステルノストマ属種 (Sternostoma spp.)、トロピラエラプス属種 (Tropilaelaps spp.)、バロア属種 (Varroa spp.)；アクチネジダ目 (Actinedida (Prostigmata)) の、例えば、アカラピス属種 (Acarapis spp.)、ケイレチエラ属種 (Cheyletiella spp.)、デモデキス属種 (Demodex spp.)、リストロホルス属種 (Listrophorus spp.)、ミオビア属種 (Myobia spp.)、ネオトロムビクラ属種 (Neotrombicula spp.)、オルニトケイレチア属種 (Ornithocheyletia spp.)、プソレルガテス属種 (Psorergates spp.)、トロムビクラ属種 (Trombicula spp.)；及び、アカリジダ目 (Acaridida (Astigmata)) の、例えば、アカルス属種 (Acarus spp.)、カログリフス属種 (Caloglyphus spp.)、コリオプテス属種 (Chorioptes spp.)、シトジテス属種 (Cytoletes spp.)、ヒポデクテス属種 (Hypodectes spp.)、クネミドコプテス属種 (Knemidocoptes spp.)、ラミノシオプテス属種 (Laminosioptes spp.)、ノトエドレス属種 (Notoedres spp.)、オトデクテス属種 (Otodectes spp.)、プソロプテス属種 (Psoroptes spp.)、プテロリクス属種 (Pterolichus spp.)、サルコプテス属種 (Sarcoptes spp.)、トリキサカルス属種 (Trixacarus spp.)、チロファグス属種 (Tyrophagus spp.)。

【0176】

寄生性原生動物の例としては、限定するものではないが、以下のものを挙げるができる：

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

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

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

10

20

30

40

50

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

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

アルベオラータ (Alveolata)、例えば、アピコンプレックス門 (Apicomplexa) (孢子虫類 (Sporozoa))、例えば、クリプトスポリジウム属種 (Cryptosporidium spp.) ; エイメリア目 (Eimeriida) の、例えば、ベスノイチア属種 (Besnoitia spp.)、シストイソスポラ属種 (Cystoisospora spp.)、エイメリア属種 (Eimeria spp.)、ハモンジア属種 (Hammondia spp.)、イソスポラ属種 (Isospora spp.)、ネオスポラ属種 (Neospora spp.)、サルコシスチス属種 (Sarcocystis spp.)、トキソプラズマ属種 (Toxoplasma spp.) ; アデレイダ目 (Adeleida) の、例えば、ヘパトゾオン属種 (Hepatozoon spp.)、クロシエラ属種 (Klossiella spp.) ; ハエモスポリダ目 (Haemosporida) の、例えば、レウコシトゾオン属種 (Leucocytozoon spp.)、プラスモジウム属種 (Plasmodium spp.) ; ピロプラスミダ目 (Piroplasmida) の、例えば、バベシア属種 (Babesia spp.)、シリオホラ属種 (Ciliophora spp.)、エキノゾオン属種 (Echinozoon spp.)、テイレリア属種 (Theileria spp.) ; ベシブリフェリダ目 (Vesiculiferida) の、例えば、バランチジウム属種 (Balantidium spp.)、ブキストネラ属種 (Buxtonella spp.) ;

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

#### 【0177】

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

#### 【0178】

例証的な蠕虫類としては、限定するものではないが、以下のものを挙げることができる :

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

条虫類 (Cestodes) : ギョウジョウチュウ目 (Pseudophyllidea) の、例えば、ボトリジウム属種 (Bothridium spp.)、ジフィロボトリウム属種 (Diphyllobothrium spp.)、ジフロゴノポルス属種 (Diplogonoporus spp.)、イクチオボトリウム属種 (Ichthy

10

20

30

40

50

obothrium spp.)、リグラ属種 (Ligula spp.)、シストセファルス属種 (Schistocephalus spp.)、スピロメトラ属種 (Spirometra spp.) ;

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

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

10

20

30

40

50

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

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

カンセンチュウ目 (Rhabditina) の、例えば： アエルロストロンギルス属種 (Aelurostrongylus spp.)、アミドストムム属種 (Amidostomum spp.)、アンシロストマ属種 (Ancylostoma spp.)、アンギオストロンギルス属種 (Angiostrongylus spp.)、ブロンコネマ属種 (Bronchonema spp.)、ブノストムム属種 (Bunostomum spp.)、カベルチア属種 (Chabertia spp.)、コオベリア属種 (Cooperia spp.)、コオベリオイデス属種 (Cooperioides spp.)、クレノソマ属種 (Crenosoma spp.)、シアトストムム属種 (Cyathostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyclococyclus spp.)、シクロドントストムム属種 (Cyclodontostomum spp.)、シクロコセルクス属種 (Cyllicocyclus spp.)、シリコステファヌス属種 (Cyllicostephanus spp.)、シリンドロファリンキス属種 (Cylindropharynx spp.)、シストカウルス属種 (Cystocaulus spp.)、ジクチオカウルス属種 (Dictyocaulus spp.)、エラホストロンギルス属種 (Elaphoststrongylus spp.)、フィラロイデス属種 (Filaroides spp.)、グロボセファルス属種 (Globocephalus spp.)、グラフィジウム属種 (Graphidium spp.)、ギアロセファルス属種 (Gyallocephalus spp.)、ハエモンクス属種 (Haemonchus spp.)、ヘリグモソモイデス属種 (Heligmosomoides spp.)、ヒオストロンギルス属種 (Hyoststrongylus spp.)、マルシャラギア属種 (Marshallagia spp.)、メタストロンギルス属種 (Metastrongylus spp.)、ムエレリウス属種 (Muellerius spp.)、ネカトル属種 (Necator spp.)、ネマトジルス属種 (Nematodirus spp.)、ネオストロンギルス属種 (Neostrongylus spp.)、ニッポストロンギルス属種 (Nippostrongylus spp.)、オベリスコイデス属種 (Obeliscoides spp.)、オエソファゴドンツス属種 (Oesophagodontus spp.)、オエソファゴストムム属種 (Oesophagostomum spp.)、オルラヌス属種 (Ollulanus spp.) ; オルニトストロンギルス属種 (Ornithoststrongylus spp.)、オスレルス属種 (Oslerus spp.)、オステルタギア属種 (Ostertagia spp.)、パラコオベリア属種 (Paracooperia spp.)、パラクレノソマ属種 (Paracrenosoma spp.)、パラフィラロイデス属種 (Parafilaroides spp.)、パレラホストロンギルス属種 (Parelaphoststrongylus spp.)、プネウモカウルス属種 (Pneumocaulus spp.)、プネウモストロンギルス属種 (Pneumoststrongylus spp.)、ポテリオストムム属種 (Poteriostomum spp.)、プロトストロンギルス属種 (Protoststrongylus spp.)、スピコカウルス属種 (Spicocaulus spp.)、ステファヌルス属種 (Stephanurus spp.)、ストロンギルス属種 (Strongylus spp.)、シンガムス属種 (Syngamus spp.)、テラドルサギア属種 (Teladorsagia spp.)、トリコネマ属種 (Trichonema spp.)、トリコストロンギルス属種 (Trichostrongylus sp

10

20

30

40

50

p. )、トリオドントホルス属種 (Triodontophorus spp. )、トログロストロンギルス属種 (Troglostrogylus spp. )、ウンシナリア属種 (Uncinariia spp. ) ;

センビセンチュウ目 (Spirurida) の、例えば： アカントケイロネマ属種 (Acanthocheilonema spp. )、アニサキス属種 (Anisakis spp. )、アスカリジア属種 (Ascaridia spp. ) ; アスカリス属種 (Ascaris spp. )、アスカロプス属種 (Ascarops spp. )、アスピクルリス属種 (Aspiculuris spp. )、バイリサスカリス属種 (Baylisascaris spp. )、ブルギア属種 (Brugia spp. )、セルコピチフィラリア属種 (Cercopithifilaria spp. )、クラシカウダ属種 (Crassicauda spp. )、ジペタロネマ属種 (Dipetalonema spp. )、ジロフィラリア属種 (Dirofilaria spp. )、ドラクンクルス属種 (Dracunculus spp. ) ; ドラスキア属種 (Draschia spp. )、エンテロビウス属種 (Enterobius spp. )、フィラリア属種 (Filaria spp. )、グナトストマ属種 (Gnathostoma spp. )、ゴンギロネマ属種 (Gongylonema spp. )、ハプロネマ属種 (Habronema spp. )、ヘテラキス属種 (Heterakis spp. ) ; リトモソイデス属種 (Litomosoides spp. )、ロア属種 (Loa spp. )、オンコセルカ属種 (Onchocerca spp. )、オキシウリス属種 (Oxyuris spp. )、パラブロンネマ属種 (Parabronema spp. )、パラフィラリア属種 (Parafilaria spp. )、パラスカリス属種 (Parascaris spp. )、パスサルルス属種 (Passalurus spp. )、フィサロプテラ属種 (Physaloptera spp. )、プロブストマイリア属種 (Probstmayria spp. )、プセウドフィラリア属種 (Pseudofilaria spp. )、セタリア属種 (Setaria spp. )、スクジュラビネマ属種 (Skjrabinema spp. )、スピロセルカ属種 (Spirocerca spp. )、ステファノフィラリア属種 (Stephanofilaria spp. )、ストロンギルリス (Strongyluris spp. )、シファシア属種 (Syphacia spp. )、テラジア属種 (Thelazia spp. )、トキサスカリス属種 (Toxascaris spp. )、トキシカラ属種 (Toxocara spp. )、ウケレリア属種 (Wuchereria spp. ) ;

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

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

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

#### 【0179】

獣医学の分野において、及び、畜産業において、式 (I) で表される化合物は、当技術分野において一般的に知られている方法によって、例えば、適切な調製物の形態で、経腸経路、非経口的経路、経皮的経路又は経鼻的経路を介して投与する。投与は、予防的、感染後防御的 (metaphylactic) 又は治療的であり得る。

#### 【0180】

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

10

20

30

40

50



物である。

【0181】

さらなる態様は、抗内部寄生生物剤として使用するための式(I)で表される化合物に関する。

【0182】

本発明のさらなる特定の態様は、抗蠕虫剤として使用するための、特に、殺線虫剤、殺扁形動物剤(platyhelminthicide)、殺鉤頭動物剤(acanthocephalicide)又は殺舌形動物剤(pentastomicide)として使用するための、式(I)で表される化合物に関する。

【0183】

本発明のさらなる特定の態様は、抗原生動物剤(antiprotozoic agent)として使用するための式(I)で表される化合物に関する。

【0184】

さらなる態様は、抗外部寄生生物剤として使用するための、特に、殺節足動物剤(arthropodicide)として使用するための、極めて特定のには、殺虫剤又は殺ダニ剤として使用するための、式(I)で表される化合物に関する。

【0185】

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

【0186】

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

【0187】

本発明の別の特定の態様は、上記態様による殺外部寄生生物薬製剤(ectoparasiticide formulations)及び殺内部寄生生物薬製剤(endoparasiticide formulations)の群から選択される獣医薬製剤、特に、駆虫薬製剤、抗原生動物薬製剤(antiprotozoic formulations)及び殺節足動物薬製剤(arthropodicide formulations)の群から選択される獣医薬製剤、極めて特に、殺線虫薬製剤(nematocidal formulations)、殺扁形動物薬製剤(platyhelminthicide formulations)、殺鉤頭動物薬製剤(acanthocephalicide formulations)、殺舌形動物薬製剤(pentastomicidal formulations)、殺虫薬製剤(insecticide formulations)及び殺ダニ薬製剤(acaricide formulations)の群から選択される獣医薬製剤、並びに、それらを製造する方法である。

【0188】

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

【0189】

別の態様は、寄生生物感染症、特に、上記で記載した外部寄生生物及び内部寄生生物の

10

20

30

40

50

群から選択される寄生生物に起因する感染症を治療する方法に関し、ここで、該方法は、そのような治療を必要とする動物（特に、非ヒト動物）において本明細書中で定義されている獣医薬製剤を使用することによる。

#### 【0190】

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

#### 【0191】

動物衛生又は獣医学に関連して、用語「処置（treatment）」は、予防的処置、感染後防御の処置又は治療的処置を包含する。

#### 【0192】

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

#### 【0193】

動物衛生の分野においては、「混合物」は、2種類の（又は、それより多い）異なる活性成分が共有の製剤に製剤され、それによって一緒に使用されることを意味するのみではなく、それぞれの活性成分に対して独立した製剤を含んでいる製品にも関する。従って、3種類上の活性成分を使用する場合、全ての活性成分を共有の製剤に製剤することができるか、又は、全ての活性成分を別々の製剤に製剤することが可能である；同様に、活性成分のうちの一部と一緒に製剤し且つ活性成分のうちの一部を別々に製剤するという混合形態も考えることができる。別々の製剤では、当該複数の活性成分を別々に施用することが可能であるか、又は、連続して施用することが可能である。

#### 【0194】

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

#### 【0195】

混合成分として該殺外部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性成分としては、決して限定することを意図するものではないが、上記において詳細に記載されている殺虫剤及び殺ダニ剤などを挙げることができる。使用することが可能なさらなる活性成分について、現在の「IRAC Mode of Action Classification Scheme」に基づいた上記分類に従って、以下に記載する：（1）アセチルコリン

エステラーゼ（AChE）阻害薬；（2）GABA制御塩化物チャンネル遮断薬；（3）ナトリウムチャンネルモジュレーター；（4）ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）競合的モジュレーター；（5）ニコチン作動性アセチルコリン受容体（nAChR）アロステリックモジュレーター；（6）グルタミン酸制御塩化物チャンネル（GluCl）アロステリックモジュレーター；（7）幼若ホルモン模倣物質；（8）種々の特定されていない（多部位）阻害薬；（9）弦音器官モジュレーター；（10）ダニ成長阻害薬；（12）ミトコンドリアATPシンターゼの阻害薬、例えば、ATPディスラプター；（13）プロトン勾配を破壊することによる酸化的リン酸化の脱共役剤；（14）ニコチン作動性アセチルコリン受容体チャンネル遮断薬；（15）キチン生合成の阻害薬（タイプ0）；（16）キチン生合成の阻害薬（タイプ1）；（17）脱皮ディスラプター（特に、双翅目の場合）；（18）エクジソン受容体作動薬；（19）オクトパミン受容体作動薬；（21）ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害薬；（25）mミトコンドリア複合体II電子伝達阻害薬；（20）ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害薬；（22）電位依存性ナトリウムチャンネル遮断薬；（23）アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害薬；（28）リアノジン受容体モジュレーター；

作用機序が知られていないか又は特定されていない活性成分、例えば、フェントリファ

10

20

30

40

50

ニル、フェノキサクリム、シクロブレン、クロロベンジレート、クロルジメホルム、フルベンジミン、ジシクラニル、アミドフルメト、キノメチオネート、トリアラテン、クロチアゾベン、テトラスル、オレイン酸カリウム、石油、メトキサジアゾン、ゴシブルレ、フルテンジン、プロモプロピレート、氷晶石 ( c r y o l i t e ) ;

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

10

有機塩素化合物、例えば、カンフェクロル、リンダン、ヘプタクロル ; 又は、フェニルピラゾール系、例えば、アセトプロール、ピラフルプロール、ピリプロール、パニリプロール、シサプロニル ; 又は、イソオキサゾリン系、例えば、サロラネル、アフォキシラネル、ロチラネル、フルララネル ;

ピレスロイド系、例えば、( シス - 、トランス - ) メトフルトリン、プロフルトリン、フルフェンプロックス、フルプロシトリネート、フブフェンプロックス、フェンフルトリン、プロトリフェンブト、ピレスメトリン、R U 1 5 5 2 5、テラレトリン、シス - レスメトリン、ヘプタフルトリン、ピオエタノメトリン、ピオペルメトリン、フェンピリトリン、シス - シペルメトリン、シス - ペルメトリン、クロシトリン、シハロトリン ( ラムダ - )、クロバポルトリン、又は、ハロゲン化炭化水素化合物 ( H C H s ) ;

20

ネオニコチノイド系、例えば、ニチアジン ;

ジクロロメゾチアズ ( d i c l o r o m e z o t i a z )、トリフルメゾピリム ;

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

トリブレン、エポフェノナン、ジオフェノラン ;

生物学的薬剤、ホルモン類、又は、フェロモン類、例えば、天然産物類、例えば、ツリンギエンシン ( t h u r i n g i e n s i n )、コドレモン、又は、ニーム成分 ;

30

ジニトロフェノール系、例えば、ジノカップ、ジノブトン、ビナバクリル ;

ベンゾイル尿素系、例えば、フルアズロン、ペンフルロン ;

アミジン誘導体、例えば、クロロメブホルム ( c h l o r m e b u f o r m )、シミアゾール、デミジトラズ ;

蜜蜂巣箱ミツバチヘギイタダニ殺ダニ剤 ( b e e h i v e v a r r o a a c a r i c i d e s )、例えば、有機酸、例えば、ギ酸、シュウ酸。

#### 【 0 1 9 6 】

混合成分として該殺内部寄生生物薬の群から選択される例示的な活性成分としては、限定するものではないが、駆虫活性成分及び抗原生動物活性成分などを挙げることができる。

40

#### 【 0 1 9 7 】

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

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

ベンゾイミダゾール類及びプロベンゾイミダゾール類のクラスの、例えば : オキシベンダゾール ( o x i b e n d a z o l e )、メベンダゾール、トリクラベンダゾール ( t r i c l a b e n d a z o l e )、チオファネート ( t h i o p h a n a t e )、パルベンダゾール ( p a r b e n d a z o l e )、オキシフェンダゾール ( o x f e n d a z o l

50

e)、ネトビミン(netobimin)、フェンベンダゾール、フェバンテル、チアベンダゾール(thiabendazole)、シクロベンダゾール、カムベンダゾール、アルベンダゾールスルホキシド、アルベンダゾール、フルベンダゾール；

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

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

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

アミノフェニルアミジン類のクラスの、例えば、：アミダントテル、デアシル化アミダントテル(dAMD)、トリベンジミジン；

アミノアセトニトリル類のクラスの、例えば：モネパンテル(monepantel)；

パラヘルクアミド類のクラスの、例えば：パラヘルクアミド、デルクアントテル；

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

置換フェノール類のクラスの、例えば：ニトロキシニル、ピチオノール、ジソフェノール、ヘキサクロロフェン、ニクロホラン、メニクロホラン(meniclopholan)；

有機リン酸エステル類のクラスの、例えば：トリクロロホン、ナフタロホス(naphthalofos)、ジクロロボス/DDVP、クルホメート、クマホス、ハロキソン；

ピペラジノン類/キノリン類のクラスの、例えば：プラジクアントテル(praziquantel)、エブシプランテル；

ピペラジン類のクラスの、例えば：ピペラジン、ヒドロキシジン；

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

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

#### 【0198】

抗原生動物活性成分としては、限定するものではないが、以下の活性成分を挙げることができる；

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

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

大環状ラクトン類のクラスの、例えば：ミルベマイシン、エリスロマイシン；

キノロン類のクラスの、例えば：エンロフロキサシン、プラドフロキサシン；

キノン類のクラスの、例えば：クロロキン；

ピリミジン類のクラスの、例えば：ピリメタミン；

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

チアミン類のクラスの、例えば：アンプロリウム；

リンコサミン類のクラスの、例えば：クリンダマイシン；

カルバニリド類のクラスの、例えば：イミドカルブ；

10

20

30

40

50

ニトロフラン類のクラスの、例えば：ニフルチモクス；

キナゾリンアルカロイド類のクラスの、例えば：ハロフギノン；

さまざまな別のクラスの、例えば：オキサムニキン、パロモマイシン；

ワクチン又は微生物の抗原のクラスの、例えば：バベシア・カニス・ロッシ (*Babesia canis rossii*)、エイメリア・テネラ (*Eimeria tenella*)、エイメリア・プラエコキス (*Eimeria praecox*)、エイメリア・ネカトリキス (*Eimeria necatrix*)、エイメリア・ミチス (*Eimeria mitis*)、エイメリア・マキシマ (*Eimeria maxima*)、エイメリア・ブルネッチ (*Eimeria brunetti*)、エイメリア・アセルブリナ (*Eimeria acervulina*)、バベシア・カニス・ボゲリ (*Babesia canis vogeli*)、レイシュマニア・インファンツム (*Leishmania infantum*)、バベシア・カニス・カニス (*Babesia canis canis*)、ジクチオカウルス・ビビパルス (*Dictyocaulus viviparus*)。

10

【0199】

記載されている全ての混合成分は、それらの官能基に基づいて可能であれば、場合により、適切な塩基又は酸と塩を形成することもできる。

【0200】

#### 媒介動物の防除

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

20

【0201】

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

(1) 蚊類

・ ハマダラカ (*Anopheles*)： マラリア、フィラリア症；

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

30

・ ヤブカ (*Aedes*)： 黄熱病、デング熱、別のウイルス性疾患、フィラリア症；

・ ブユ (*Simuliidae*)： 蠕虫類 (特に、回旋糸状虫 (*Onchocerca volvulus*)) の運搬；

・ チョウバエ (*Psychodidae*)： リーシュマニア症の伝染；

(2) シラミ類： 皮膚感染、流行性発疹チフス；

(3) ノミ類： 伝染病、発疹熱、糸虫；

(4) ハエ類： 睡眠病 (トリパノソーマ病)；コレラ、別の細菌性疾患；

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

40

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

【0202】

本発明に関連して、媒介動物の例は、植物ウイルスを植物に運ぶことが可能な昆虫類、例えば、アブラムシ類、ハエ類、ヨコバイ類又はアザミウマ類などである。植物ウイルス

50

を運ぶことが可能な別の媒介動物は、ハダニ類、シラミ類、甲虫類及び線虫類である。

【0203】

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

10

【0204】

式 (I) で表される化合物が抵抗性を打破する (*resistance-breaking*) 場合、媒介動物の防除は、同様に可能である。

【0205】

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

【0206】

20

工業材料の保護

式 (I) で表される化合物は、昆虫類〔例えば、コウチュウ目 (*Coleoptera*)、ハチ目 (*Hymenoptera*)、シロアリ目 (*Isoptera*)、チョウ目 (*Lepidoptera*)、チャタテムシ目 (*Psocoptera*) 及びシミ目 (*Zygentoma*) の昆虫類〕による攻撃又は破壊に対して工業材料を保護するのに適している。

【0207】

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

30

【0208】

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

【0209】

さらなる実施形態では、式 (I) で表される化合物は、即時使用可能な (*ready-to-use*) 殺有害生物剤の形態にある。このことは、それらが、さらなる変更を加えることなく、当該材料物質に施用することが可能であるということの意味する。有用なさらなる殺虫剤又は殺菌剤としては、特に、上記で挙げたものなどがある。

【0210】

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

40

【0211】

衛生分野における害虫の防除

式 (I) で表される化合物は、衛生分野において害虫を防除するのに適している。より特定のには、本発明は、家庭内保護分野において、衛生保護分野において、及び、貯蔵生産物の保護において、特に、密閉空間 (例えば、住居、工場の通路、オフィス、車両の客室、動物飼育施設) において遭遇する昆虫類、クモ形類動物、マダニ類及びダニ類を防除する為に、使用することができる。害虫を防除するために、式 (I) で表される化合物は

50

、単独で使用するか、又は、別の活性化合物及び／又は補助剤と組み合わせて使用する。それらは、好ましくは、家庭用殺虫剤製品に含ませて使用する。式（Ⅰ）で表される化合物は、感受性種及び抵抗性種に対して有効であり、さらに、全ての成育段階に対して有効である。

#### 【0212】

これらの害虫としては、例えば、クモ綱（Arachnida）のサソリ目（Scorpiones）、クモ目（Araneae）及びザトウムシ目（Opiliones）の害虫、ムカデ綱（Chilopoda）及びヤスデ綱（Diplopoda）の害虫、昆虫綱（Insecta）のゴキブリ目（Blattodea）、コウチュウ目（Coleoptera）、ハサミムシ目（Dermaptera）、ハエ目（Diptera）、カメムシ亜目（Heteroptera）、ハチ目（Hymenoptera）、シロアリ目（Isoptera）、チョウ目（Lepidoptera）、シラミ目（Phthiraptera）、チャタテムシ目（Psocoptera）、バッタ目（Saltatoria 又は Orthoptera）、ノミ目（Siphonaptera）及びシミ目（Zygentoma）の害虫、並びに、軟甲綱（Malacostraca）のワラジムシ目（Isopoda）の害虫などをあげることができる。

#### 【0213】

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

#### 【0214】

##### 調製方法及び中間体の説明

式（Ⅰ-A）〔式中、Qは酸素を表す〕で表される化合物は、例えばスキーム1において示されている調製方法で、合成することができる。式（Ⅰ-B）〔式中、Qは硫黄を表す〕で表される化合物は、例えばスキーム2に従って、式（Ⅰ-A）で表される化合物から得ることができる。スキーム1及びスキーム2に示されている調製方法において、いずれの場合にも式の中で使用されているラジカルW、Y、V、A、L<sup>1</sup>及びL<sup>2</sup>は、別途示されていない限り、好ましい範囲（1）～好ましい範囲（5）において与えられている意味を有する。

#### 【0215】

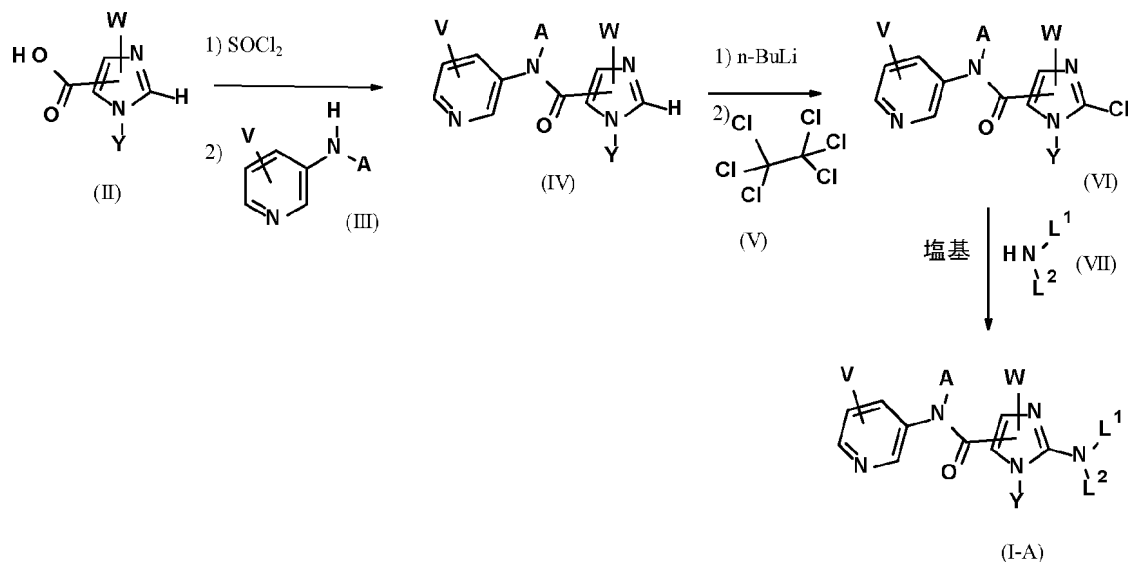
式（Ⅰ-A）で表される化合物は、スキーム1において示されているように、最初に、式（ⅠⅠ）で表されるイミダゾールカルボン酸を式（ⅠⅠⅠ）で表されるアミノピリジンと反応させて式（ⅠⅣ）で表される化合物を生成させること（cf. アミド化プロセス）によって、合成することができる。次いで、式（ⅠⅣ）で表される化合物を、既知調製方法と同様にして、溶媒（例えば、テトラヒドロフラン又はジエチルエーテル）の中で低温（-75～-100）で強塩基（例えば、n-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミン又はリチウムtert-ブトキシド）を用いて脱プロトン化し（deprotonated）、次いで、塩素化剤（例えば、式（Ⅴ）で表されるヘキサクロロエタン）と反応させて、式（ⅤⅠ）で表されるクロロイミダゾールを生成させる（cf. EP1988081；US20050250948）。次いで、式（ⅤⅠ）で表されるクロロイミダゾールを式（ⅤⅠⅠ）で表される窒素求核試薬と反応させて、式（Ⅰ-1）で表される化合物を生成させることができる。ここで、式（ⅤⅠⅠ）で表される化合物は、場合により、塩基を用いて脱プロトン化することが必要であり得る。例としてあげることができる塩基は、以下のものである：水酸化カリウム、カリウムtert-ブトキシド、トリエチルアミン、さらに、慣習的な全ての無機塩基又は有機塩基、例えば、有機アミン、例えば、ジ

イソプロピルエチルアミン、N - メチルモルホリン、ピリジン又はN , N - ジメチルアミノピリジン、アルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム；アルカリ金属重炭酸塩、例えば、重炭酸ナトリウム又は重炭酸カリウム。イミダゾールの2位の塩素原子をさまざまなアミノ化合物で置換することに関して、多くの種類の反応条件がすでに記載されている[cf., 例え、US 2005250948 ; WO2010144338 ; Jablonski, J. A. et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. 2009, 19, 903-907 ; US2009186879]。

【0216】

スキーム 1

【化6】



【0217】

該調製方法に必要な式(II)で表されるイミダゾリルカルボン酸は、市販されているか、又は、例えば、文献(例えば、H. Rapoport et al.; Synthesis 1988, 10, 767-771, BASF Aktiengesellschaft patent: US4864030A1, 1989, Takeda Pharmaceutical Company Limited patent: EP2530078A1, 2012, TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD. patent: US2012/10414A1, 2012, Subrayan, Ramachandran P.; Thurber, Ernest L.; Rasmussen, Paul G. Tetrahedron, 1994, 50, 2641-2656)から知られている調製方法で、調製することができる。

【0218】

該調製方法に必要な式(III)で表される3-アミノピリジンは、市販されているか、又は、例えば、文献(例えば、Liu, Zhen-Jiang; Vors, Jean-Pierre; Gesing, Ernst R. F.; Bolm, Carsten, Advanced Synthesis and Catalysis, 2010, 352, 3158-3162, BAYER CROPS SCIENCE AG patent: US2010/305124A1, 2010, Shafir, Alexandr; Buchwald, Stephen L., Journal of the American Chemical Society, 2006, 128, 8742-8743)から知られている調製方法で、調製することができる。

【0219】



該調製方法に必要な式 (V I I I) で表される NH 化合物 (例えば、アルキルアミン類、ジアルキルアミン類、環状アミン類、ヒドラジン類、ピラゾール類、イミダゾール類、トリアゾール類など) は、市販されているか、又は、有機化学において知られている一般的な調製方法で調製することができる。

【0220】

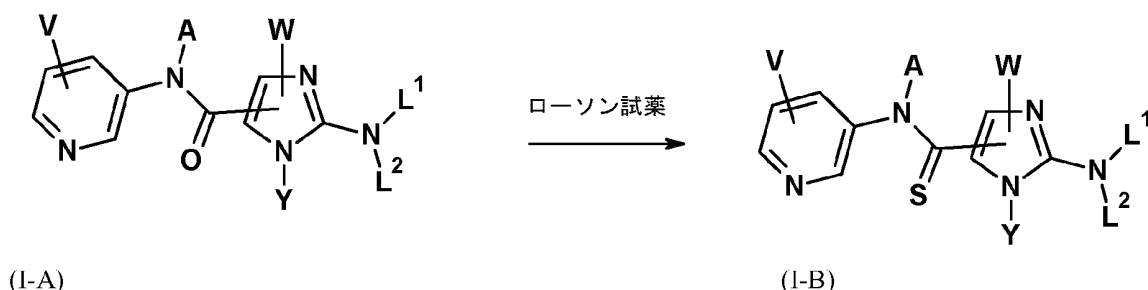
式 (I - B) で表されるチオアミドは、スキーム 2 において示されているように、一般的に知られている調製方法と同様に、式 (I - A) で表される化合物を硫化剤 (例えば、五硫化二リン又はローソン試薬と反応させることによって合成することができる (c f . , 例えば、C . P . Dell in Comprehensive Organic Functional Group Transformations, Vol. 5, Ed.: A. R. Katritzky, O. Meth-Cohn, C. W. Rees, Pergamon, Oxford, 1995, S. 565 - 628; M. Jesberger, T. P. Davis, L. Barner, Synthesis 2003, 13, 1929)。

10

【0221】

スキーム 2

【化 7】



20

【0222】

アミド化プロセス

本発明による調製方法における式 (I V) で表される化合物は、文献から知られているアミド化反応を用いて合成することができるか、又は、明示的に記載されている実施例と同様に合成することができる。

30

【0223】

当該アミド化段階に関して、多くの反応条件が記載されている、例えば、「G. Benz in Comprehensive Organic Synthesis, 1<sup>st</sup> Ed., Pergamon Press, Oxford, 1991, Vol. 6, pp. 381 - 417」、 「P. D. Bailey et al. in Comprehensive Organic Functional Group Transformation, 1<sup>st</sup> Ed., Elsevier Science Ltd., Oxford, 1995, Vol. 5, pp. 257 - 308」、及び、「R. C. Larock in Comprehensive Organic Transformations, 2<sup>nd</sup> Ed., Wiley-VCH, New York, Weinheim, 1999, pp. 1929 - 1994」。これらの反応の一部は、中間体カルボニルクロリド類を介して進行し、その中間体カルボニルクロリドは、単離された形態で使用するすることができるか、又は、その場で生成された形態で使用するすることができる。

40

【0224】

該アミド化反応は、場合により縮合剤の存在下で、場合により酸受容体の存在下で、及び、場合により溶媒の存在下で、実施する。

【0225】

有用な縮合剤は、そのようなアミド化反応に関して典型的に使用可能な全ての縮合剤で

50

ある。例としては、以下のものを挙げることができる：活性化剤、例えば、ホスゲン、三塩化リン、オキシ塩化リン、塩化オキサリル、臭化オキサリル又は塩化チオニル；カルボジイミド、例えば、N, N' - ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC) 及び 1 - (3 - ジメチルアミノプロピル) - 3 - エチルカルボジイミド (EDCI)、又は、別の慣習的な縮合剤、例えば、五酸化リン、ポリリン酸、N, N' - カルボニルジイミダゾール、2 - クロロピリジン 1 - メトヨージド (2 - chloropyridine 1 - methiodide) (ムカイヤマ試薬)、2 - エトキシ - N - エトキシカルボニル - 1, 2 - ジヒドロキノリン (EEDQ)、トリフェニルホスフィン / 四塩化炭素、プロモトリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート (BROP)、O - (1H - ベンゾトリアゾール - 1 - イルオキシ) トリス (ジメチルアミノ) ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート (BOP)、N, N, N', N' - ビス (テトラメチレン) クロロウロニウムテトラフルオロボレート、O - (1H - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート (HBTU)、O - (1H - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - ビス (テトラメチレン) ウロニウムヘキサフルオロホスフェート、O - (1H - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (TBTU)、O - (1H - ベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - ビス (テトラメチレン) ウロニウムテトラフルオロボレート、O - (7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート (HATU)、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBt)、及び、4 - (4, 6 - ジメトキシ - 1, 3, 5 - トリアジン - 2 - イル) - 4 - メチルモルホリニウム塩 (DMTMM)、通常、塩化物として入手可能である。これらの試薬は、独立して使用し得るか、又は、組合せて使用することができる。

#### 【0226】

適切な酸受容体は、慣習的な全ての無機塩基又は有機塩基、例えば、有機アミン、例えば、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、N - メチルモルホリン、ピリジン又は N, N - ジメチルアミノピリジン、アルカリ金属炭酸塩及びアルカリ土類金属炭酸塩、例えば、炭酸リチウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム；アルカリ金属重炭酸塩、例えば、重炭酸ナトリウム又は重炭酸カリウムなどである。本発明による調製方法におけるアミド化反応は、場合により、適切な反応助剤 (例えば、N, N - ジメチルホルムアミド、又は、N, N - ジメチルアミノピリジン) の存在下で、実施する。適切な溶媒又は希釈剤は、全ての不活性有機溶媒、例えば、以下のものである：脂肪族又は芳香族の炭化水素類 (例えば、石油エーテル、トルエン、シクロヘキサン)、ハロゲン化炭化水素類 (例えば、クロロトルエン、ジクロロベンゼン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2 - ジクロロエタン)、エーテル類 (例えば、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、1, 2 - ジメトキシエタン)、エステル類 (例えば、酢酸エチル、又は、酢酸メチル)、ニトロ炭化水素類 (例えば、ニトロメタン、ニトロエタン、ニトロベンゼン)、ニトリル類 (例えば、アセトニトリル、プロピオニトリル、ブチロニトリル、ベンゾニトリル)、アミド類 (例えば、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 - メチルホルムアニリド、N - メチルピロリドン、ヘキサメチルホスホルアミド)、及び、さらに、ジメチルスルホキシド、又は、水、又は、上記溶媒の混合物。

#### 【0227】

式 (III) で表される化合物を調製するために、混合無水物を使用することも可能である (cf. J. Am. Chem. Soc. 1967, 5012)。この調製方法において、クロロギ酸エステル、例えば、クロロギ酸メチル、クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル及びクロロギ酸イソプロピルなどを使用することができる。同様に、この目的のために、ジエチルアセチルクロリド、トリメチルアセチルクロリド及び類似した化合物を使用することができる。

#### 【0228】

10

20

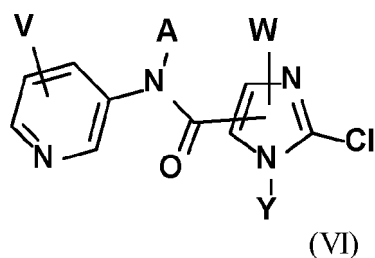
30

40

50

本発明は、さらにまた、式 (VI)

【化 8】



【0229】

〔式中、ラジカルは、好ましい範囲(1-1)~(5-1)又は好ましい範囲(1-2)~(5-2)のうちの1つに記載されている意味を有し、及び、特に好ましくは、好ましい範囲(5-1)又は好ましい範囲(5-2)に記載されている意味を有する〕

で表される中間体も提供する。

【実施例】

【0230】

#### 調製実施例

以下の調製実施例及び使用実施例によって本発明について例証するが、それらの実施例は、本発明を限定するものではない。

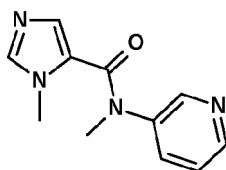
【0231】

#### 合成実施例 No. 1

N, 1-ジメチル-N-(ピリジン-3-イル)-2-[3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1H-イミダゾール-5-カルボキサミド(化合物 No. I-1-007)

段階1: N, 1-ジメチル-N-(ピリジン-3-イル)-1H-イミダゾール-5-カルボキサミド

【化 9】



【0232】

12 g (95.2 mmol) の 1-メチルイミダゾール-5-カルボン酸を 72 mL のトルエンに懸濁させた懸濁液に 12.71 g (104.7 mmol) の塩化チオニルを添加し、その混合物を 130 で一晩撹拌した。その反応混合物を減圧下で濃縮した。その残渣に、10.3 g (95.2 mmol) の 3-メチルアミノピリジンと 72 mL のピリジンに溶解させた溶液を添加し、得られた反応混合物を 115 で 4 時間加熱した。次いで、その混合物を減圧下で再度濃縮し、その残渣を移動相〔アセトニトリル/メタノール(3:1)〕を使用するシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製した。これによって、8.1 g (理論値の 39.3%) の標題化合物及び 9.5 g (理論値の 37.1%) の標題化合物 HCl 塩が得られた。

【0233】

HPLC-MS: log P[n] = 0.44; 質量(m/z): 217, 1;

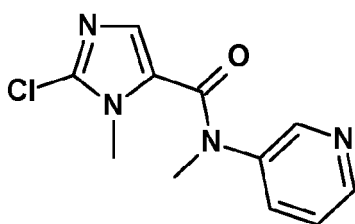
<sup>1</sup>H-NMR(CD<sub>3</sub>CN, 400 MHz); δ = 3.39 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 6.17 (s, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.67-7.70 (m, 1H), 8.41 (m, 1H), 8.47 (m, 1H) ppm.

【0234】

段階2: 2-クロロ-N, 1-ジメチル-N-(ピリジン-3-イル)-1H-イミ

## ダゾール - 5 - カルボキサミド

【化 10】



【0235】

10

10.0 g (46.2 mmol) の N, 1 - ジメチル - N - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミドを 150 mL の乾燥 THF に溶解させ、-78℃まで冷却した。n - ヘキサン中の n - BuLi の 2.5 モル溶液 20.34 mL (50.8 mmol) のを 5 分間かけて滴下して加え、その混合物を -78℃ でさらに 30 分間撹拌した。次いで、100 mL の THF に溶解させた 12.0 g (50.8 mmol) のヘキサクロロエタンを 5 分間かけて滴下して加えた。その混合物を -78℃ でさらに 45 分間撹拌し、次いで、60 分間かけて室温まで昇温させた。その混合物を 400 mL の飽和塩化アンモニウム溶液の中に注ぎ入れ、ジクロロメタンで繰り返し抽出した。その有機相を合し、少量の水で洗浄し、硫酸マグネシウムで脱水した。溶媒を留去し、その残渣を移動相〔水/アセトニトリル〕を使用する分取逆相 HPLC で精製した。これによって、7.27 g (理論値の 62%) の 2 - クロロ - N, 1 - ジメチル - N - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミドが得られた。

20

【0236】

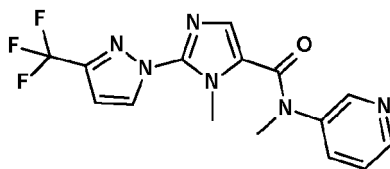
HPLC - MS :  $\log P[n] = 0.88$  ; 質量 (m/z) : 251.1 ;  
 $^1\text{H} - \text{NMR} (\text{D}^6 - \text{DMSO}, 400 \text{ MHz})$  ;  $\delta = 3.37 (\text{s}, 3\text{H})$  ,  $3.75 (\text{s}, 3\text{H})$  ,  $6.20 (\text{s}, 1\text{H})$  ,  $7.45 (\text{m}, 1\text{H})$  ,  $7.86 (\text{m}, 1\text{H})$  ,  $8.49 (\text{m}, 1\text{H})$  ,  $8.53 (\text{m}, 1\text{H})$  ppm。

【0237】

段階 3 : N, 1 - ジメチル - N - (ピリジン - 3 - イル) - 2 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミド (化合物 No. I - 1 - 007)

30

【化 11】



【0238】

40

ジメチルホルムアミド (5.0 mL) の中に 2 - クロロ - N, 1 - ジメチル - N - (ピリジン - 3 - イル) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミド (150 mg、0.59 mmol) を最初に装入し、炭酸セシウム (389.9 mg、1.19 mmol) を添加した。その反応混合物を 120℃で一晩撹拌し、次いで、溶媒を減圧下で完全に留去した。その残渣を移動相〔酢酸エチル/メタノール (80:20)〕を使用するシリカゲルクロマトグラフィーに付した。これによって、61 mg (理論値の 29.1%) の N, 1 - ジメチル - N - (ピリジン - 3 - イル) - 2 - [3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミドが得られた。

【0239】

HPLC - MS :  $\log P[n] = 1.87$  ; 質量 (m/z) : 351.1 ;  
 $^1\text{H} - \text{NMR} (\text{D}^6 - \text{DMSO}, 400 \text{ MHz})$  ;  $\delta = 3.42 (\text{s}, 3\text{H})$  ,  $3.81$

50

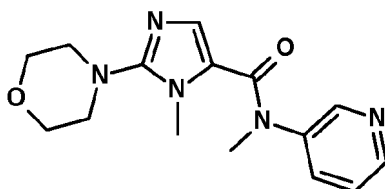
( s , 3 H ) , 6 . 2 8 ( s , 1 H ) , 6 . 8 3 ( m , 1 H ) , 7 . 3 9 ( m , 1 H ) , 7 . 7 3 ( m , 1 H ) , 8 . 0 8 ( m , 1 H ) , 8 . 4 9 ( m , 2 H ) p p m .

【 0 2 4 0 】

合成実施例 No . 2

N , 1 - ジメチル - 2 - ( モルホリン - 4 - イル ) - N - ( ピリジン - 3 - イル ) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミド ( 化合物 No . I - 1 - 0 0 9 )

【 化 1 2 】



10

【 0 2 4 1 】

2 - クロロ - N , 1 - ジメチル - N - ( ピリジン - 3 - イル ) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミド ( 1 5 0 m g 、 0 . 5 9 m m o l ) とモルホリン ( 2 1 6 m g 、 2 . 4 8 m m o l ) を 1 0 0 で一晩攪拌した。その混合物を水の中に注ぎ入れ、酢酸エチルで繰り返し抽出した。その有機相を合して硫酸マグネシウムで脱水し、溶媒を減圧下で留去し、その残渣を移動相〔水 / アセトニトリル〕を使用する分取逆相 H P L C で精製した。これによって、1 3 5 m g ( 理論値の 7 5 . 8 % ) の N , 1 - ジメチル - 2 - ( モルホリン - 4 - イル ) - N - ( ピリジン - 3 - イル ) - 1 H - イミダゾール - 5 - カルボキサミドが得られた。

20

【 0 2 4 2 】

H P L C - M S :  $\log P [ n ] = 0 . 8 5$  ; 質量 ( m / z ) : 3 0 2 . 1 ;  
 $^1\text{H} - \text{NMR} ( \text{CD}_3\text{CN} , 4 0 0 \text{ MHz} )$  ;  $\delta = 3 . 2 6 ( \text{m} , 2 \text{ H} ) , 3 . 3 0 ( \text{s} , 3 \text{ H} ) , 3 . 4 4 ( \text{m} , 2 \text{ H} ) , 3 . 5 7 ( \text{s} , 3 \text{ H} ) , 3 . 8 0 ( \text{m} , 2 \text{ H} ) , 3 . 9 3 ( \text{m} , 2 \text{ H} ) , 5 . 9 0 ( \text{s} , 1 \text{ H} ) , 7 . 6 - 8 . 0 ( \text{m} , 2 \text{ H} ) , 8 . 3 8 - 8 . 4 7 ( \text{m} , 1 \text{ H} ) , 8 . 5 9 - 8 . 6 7 ( \text{m} , 1 \text{ H} ) \text{ p p m} .$

【 0 2 4 3 】

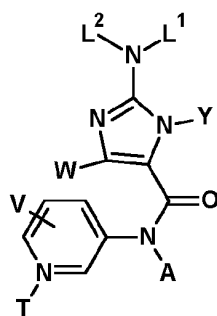
上記実施例と同様にして調製した式 ( I ) で表されるさらなる化合物が、表 1 に記載されている。

30

【 表 1 】

表 1

式 ( I - 1 ) で表される化合物

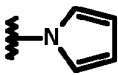
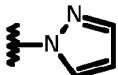
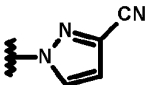
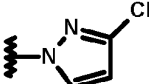
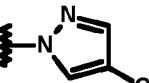
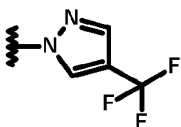
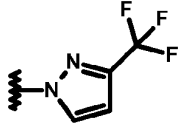
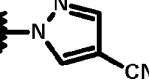
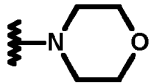
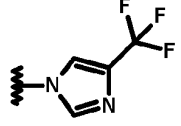
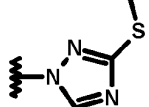


(I-1)

40

〔式中、Tは自由電子対を表し、及び、その他の置換基は下記表において与えられている意味を有する〕

50

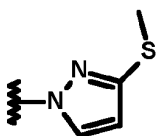
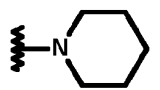
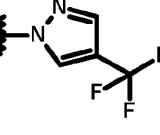
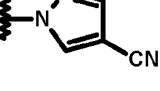
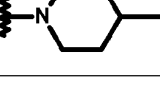
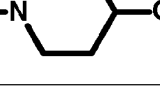
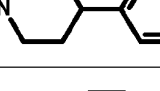

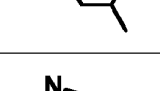
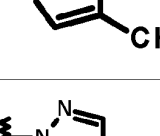
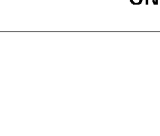
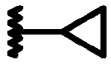
Ex. No.	$L^1-N-L^2$	Y	A	V	W	Logp [n] <sup>a)</sup>
I-1-001		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,27
I-1-002		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,01
I-1-003		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,31
I-1-004		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,48
I-1-005		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,49
I-1-006		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,82
I-1-007		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,87
I-1-008		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,14
I-1-009		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0,85
I-1-010		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,38
I-1-011		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,27

10

20

30

40

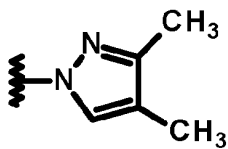
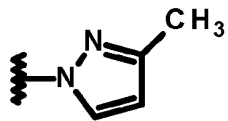
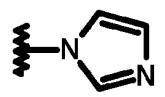
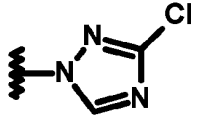
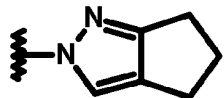
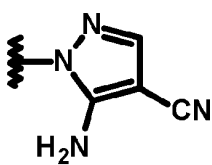
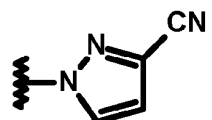
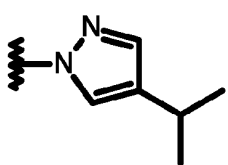
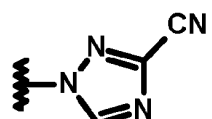
Ex. No.	$L^1-N-L^2$	Y	A	V	W	Logp [n] <sup>a)</sup>
I-1-012		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,57
I-1-013		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,53
I-1-014		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	2,09
I-1-015		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	1,42
I-1-016		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,87
I-1-017		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,16
I-1-018		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	2,38
I-1-019		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,19
I-1-020		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	2,21
I-1-021		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,29
I-1-022		CH <sub>3</sub>		H	H	1,4

10

20

30

40

Ex. No.	L <sup>1</sup> -N-L <sup>2</sup>	Y	A	V	W	Logp [n] <sup>a)</sup>
I-1-023		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,42
I-1-024		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,18
I-1-025		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0,56
I-1-026		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,17
I-1-027		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,5
I-1-028		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	0,78
I-1-029		CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	1,53
I-1-030		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,84
I-1-031		CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	1,22

10

20

30

40



【表 2】

表 2 : 表 1 の選択された実施例の<sup>1</sup>H-NMRデータ<sup>b)</sup>

実施例 I-1-001: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>5</sub> -DMSO): δ= 8,313(1,1);7,941(1,1);7,921(1,3);7,887(0,4);7,871(0,4);7,140(3,4);6,290(5,7);6,240(0,4);3,938(2,9);3,670(16,0);3,403(17,1);3,315(45,9);3,225(0,4);2,891(0,5);2,731(0,5);2,675(1,7);2,671(2,3);2,666(1,7);2,576(0,7);2,558(1,0);2,510(135,7);2,506(266,3);2,502(355,6);2,497(274,4);2,493(144,5);2,456(0,4);2,333(1,5);2,328(2,1);2,324(1,6);2,117(0,3);1,140(0,7);0,146(2,0);0,033(0,7);0,028(0,7);0,008(17,1);0,000(428,7);-0,008(18,8);-0,150(2,0)	
実施例 I-1-002: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>5</sub> -DMSO): δ= 8,578(0,8);8,510(1,1);8,312(4,7);8,192(2,1);8,185(2,1);7,918(0,8);7,897(1,0);7,866(2,3);7,862(2,5);7,840(0,7);7,489(0,8);7,478(0,8);7,469(0,9);7,455(1,0);7,443(0,7);7,433(0,6);7,421(0,5);6,561(1,5);6,556(1,9);6,550(1,5);6,484(1,4);6,274(2,3);3,936(8,9);3,795(16,0);3,469(0,4);3,433(0,5);3,427(0,5);3,410(14,5);3,402(9,1);3,382(1,0);3,363(2,6);3,355(2,0);3,343(2,8);3,314(1369,0);3,278(1,0);3,270(0,5);3,253(0,4);3,243(0,4);2,895(0,6);2,885(0,3);2,784(0,4);2,772(0,3);2,740(0,3);2,675(7,9);2,670(11,0);2,666(8,4);2,637(0,8);2,621(0,7);2,593(1,0);2,523(27,6);2,519(41,7);2,510(558,5);2,506(1165,3);2,501(1606,2);2,496(1235,8);2,492(633,2);2,447(0,8);2,432(0,5);2,407(0,9);2,332(7,6);2,328(10,8);2,323(8,1);0,146(1,5);0,008(9,5);0,000(316,0);-0,008(12,1);-0,150(1,4)	10
実施例 I-1-003: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,483(2,0);8,127(2,6);8,121(2,6);7,744(1,2);7,724(1,3);7,410(1,0);7,398(1,1);7,390(1,0);7,378(0,9);6,976(2,6);6,970(2,5);6,293(2,9);5,447(16,0);3,827(14,2);3,429(14,1);2,174(2,6);1,952(2,6);1,951(2,6);1,946(4,4);1,941(5,8);1,935(4,2);1,929(2,2);0,000(24,6)	
実施例 I-1-004: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,491(1,3);8,488(1,4);8,479(1,7);8,475(2,8);8,467(2,0);7,950(2,8);7,943(2,8);7,741(0,7);7,737(0,9);7,734(0,9);7,730(0,7);7,720(0,8);7,716(1,0);7,714(1,0);7,710(0,8);7,404(1,1);7,392(1,1);7,383(1,0);7,371(1,0);6,481(2,7);6,475(2,7);6,244(2,9);5,447(3,2);3,817(16,0);3,756(0,6);3,421(15,9);3,387(0,6);3,260(0,5);2,156(17,7);1,958(0,6);1,952(3,6);1,946(6,7);1,940(9,0);1,933(6,1);1,927(3,1);0,008(0,7);0,000(18,4);-0,009(0,7)	20
実施例 I-1-005: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,492(1,1);8,488(1,2);8,480(1,2);8,476(1,5);8,472(1,8);8,466(1,7);8,051(3,8);7,756(3,2);7,744(0,7);7,740(0,8);7,737(0,8);7,734(0,7);7,723(0,8);7,720(0,9);7,717(0,9);7,713(0,8);7,406(1,0);7,394(1,0);7,386(0,9);7,374(0,8);6,249(2,7);5,446(12,0);3,814(16,0);3,420(15,6);2,155(6,6);1,964(0,3);1,958(0,8);1,952(4,7);1,946(8,7);1,939(11,9);1,933(8,3);1,927(4,3);0,008(0,8);0,000(23,7);-0,009(1,0)	
実施例 I-1-006: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,496(1,3);8,481(2,2);8,474(1,8);8,407(2,8);8,061(3,1);7,755(0,8);7,751(1,0);7,748(1,0);7,745(0,8);7,734(0,9);7,730(1,1);7,728(1,1);7,724(0,8);7,414(1,1);7,402(1,1);7,393(1,0);7,381(0,9);6,282(2,8);5,448(2,8);3,823(16,0);3,428(15,7);2,889(0,5);2,772(0,4);2,188(7,1);1,964(0,4);1,958(0,9);1,952(4,6);1,946(8,2);1,940(10,9);1,934(7,3);1,928(3,7);1,100(0,5);1,084(0,5);0,000(21,1);-0,008(0,7)	
実施例 I-1-007: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,498(1,6);8,495(1,7);8,483(3,7);8,477(2,5);8,098(2,0);8,094(2,0);7,751(0,9);7,747(1,1);7,745(1,1);7,741(0,9);7,731(1,0);7,727(1,2);7,724(1,2);7,721(1,0);7,411(1,2);7,410(1,1);7,399(1,3);7,391(1,2);7,379(1,1);6,842(2,3);6,836(2,3);6,284(3,0);3,817(16,0);3,429(15,9);2,145(5,5);1,963(0,4);1,952(4,4);1,945(7,9);1,939(10,3);1,933(7,2);1,927(3,7);0,008(2,2);0,000(23,1)	30
実施例 I-1-008: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,533(0,4);8,525(4,0);8,497(1,3);8,494(1,3);8,485(1,4);8,482(1,6);8,473(1,9);8,468(1,8);8,124(3,5);7,960(0,5);7,952(0,5);7,750(0,7);7,746(0,8);7,744(0,8);7,740(0,7);7,730(0,8);7,726(0,9);7,723(0,9);7,720(0,7);7,412(1,0);7,400(1,0);7,392(0,9);7,380(0,9);6,283(2,3);3,815(16,0);3,426(15,4);3,336(0,4);3,261(2,2);2,763(0,8);2,468(0,4);2,173(192,4);2,120(0,5);2,114(0,6);2,107(0,7);2,101(0,5);1,964(2,4);1,958(5,9);1,952(34,5);1,946(62,9);1,940(84,8);1,934(57,6);1,928(29,2);1,774(0,4);1,768(0,5);1,271(0,6);0,146(0,8);0,008(7,4);0,000(170,6);-0,009(6,3);-0,150(0,8)	
実施例 I-1-009: <sup>1</sup> H-NMR(601.6 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 19,985(0,6);9,485(0,7);8,922(1,3);8,845(1,0);8,676(1,1);8,609(0,8);8,463(0,9);8,405(0,7);8,000(1,8);7,952(0,8);7,894(0,8);7,621(0,8);6,998(1,2);6,714(1,0);3,925(6,5);3,815(5,5);3,798(5,1);3,678(6,6);3,646(2,6);3,595(2,7);3,531(9,1);3,454(5,1);3,382(2,3);3,307(5,2);3,303(8,2);3,168(6,7);2,926(4,9);2,859(9,1);2,692(16,0);1,976(9,8);1,972(10,9);1,968(9,3);1,087(0,5)	40
実施例 I-1-010: <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,509(1,0);8,506(1,0);8,497(1,0);8,494(1,0);8,477(1,3);8,471(1,3);7,899(1,6);7,806(0,4);7,803(1,3);7,800(1,8);7,797(1,2);7,767(0,6);7,763(0,7);7,760(0,7);7,756(0,7);7,746(0,7);7,742(0,8);7,740(0,8);7,736(0,7);7,428(0,8);7,426(0,8);7,416(0,8);7,414(0,8);7,408(0,7);7,406(0,7);7,396(0,7);7,394(0,7);6,278(1,6);3,671(16,0);3,425(15,1);2,178(39,1);1,964(0,5);1,958(1,1);1,952(8,8);1,946(16,4);1,940(22,8);1,934(15,6);1,927(7,9);1,100(2,4);1,084(2,3);0,008(2,0);0,000(58,8);-0,009(1,9)	

実施例 I-1-011: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,545(3,8);8,498(1,1);8,494(1,1);8,486(1,1);8,482(1,2);8,473(1,4);8,468(1,5);7,753(0,6);7,749(0,7);7,747(0,7);7,743(0,6);7,733(0,7);7,729(0,8);7,726(0,8);7,722(0,7);7,415(0,8);7,413(0,8);7,403(0,8);7,401(0,8);7,394(0,8);7,393(0,7);7,382(0,7);7,381(0,7);6,282(2,0);5,447(2,9);3,814(15,4);3,756(0,5);3,426(14,9);3,388(0,5);2,611(16,0);2,523(0,4);2,170(160,1);2,107(0,4);1,964(1,5);1,958(2,9);1,952(21,7);1,946(40,4);1,940(55,7);1,934(37,8);1,928(19,1);0,008(1,9);0,000(64,7);-0,009(2,1)	
実施例 I-1-012: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, CD <sub>3</sub> CN): δ= 8,487(1,1);8,483(1,2);8,475(2,6);8,468(1,7);7,939(2,5);7,933(2,6);7,742(0,6);7,739(0,7);7,736(0,7);7,732(0,7);7,722(0,7);7,718(0,8);7,716(0,8);7,712(0,7);7,470(0,6);7,405(0,8);7,404(0,9);7,394(0,8);7,392(0,9);7,385(0,8);7,384(0,8);7,372(0,8);6,403(2,5);6,397(2,5);6,306(0,4);6,302(0,4);6,234(2,8);5,218(1,0);5,094(0,5);3,852(15,1);3,420(14,8);3,121(0,4);2,758(0,4);2,541(16,0);2,416(0,8);2,404(0,5);2,381(2,6);2,379(2,9);2,372(0,9);2,355(0,5);2,350(0,5);2,196(13,3);1,959(0,5);1,953(3,5);1,947(6,5);1,940(9,0);1,934(6,2);1,928(3,1);1,269(0,4);0,000(8,8)	10
実施例 I-1-013: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,497(2,7);8,490(2,7);8,477(1,6);8,474(1,9);8,465(1,7);8,462(1,9);7,837(0,9);7,833(1,1);7,831(1,2);7,827(1,0);7,816(1,0);7,813(1,2);7,810(1,3);7,806(1,0);7,457(1,4);7,445(1,4);7,436(1,3);7,424(1,2);5,915(5,4);5,756(2,3);3,522(16,0);3,338(15,8);3,321(27,8);2,923(3,1);2,911(4,3);2,897(3,5);2,506(15,6);2,501(22,0);2,497(17,4);1,617(0,7);1,589(3,2);1,578(2,6);1,512(1,5);1,501(1,4);0,781(0,3);0,008(0,4);0,000(9,6);-0,008(0,5)	
実施例 I-1-014: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,926(3,2);8,539(2,6);8,526(1,4);8,343(4,0);7,916(0,9);7,912(1,1);7,906(0,9);7,895(1,0);7,891(1,2);7,889(1,2);7,505(1,2);7,493(1,2);7,485(1,1);7,473(1,0);6,274(2,7);3,915(0,9);3,897(3,0);3,879(3,0);3,862(1,0);3,837(0,6);3,763(16,0);3,317(72,3);3,283(0,4);2,671(0,6);2,506(71,2);2,501(95,3);2,497(73,5);2,328(0,6);1,147(3,4);1,129(7,3);1,112(3,3);0,008(2,5);0,000(53,7)	
実施例 I-1-015: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.09(4.9);8.546(2.24);8.538(2.81);8.533(1.75);8.525(1.69);8.521(1.63);8.465(4.85);7.916(0.78);7.912(0.96);7.91(0.91);7.906(0.79);7.896(0.9);7.892(1.02);7.889(1.02);7.885(0.85);7.504(1.16);7.492(1.17);7.484(1.1);7.472(1.06);6.281(2.27);4.346(1.23);4.335(1.28);3.914(0.81);3.896(2.67);3.878(2.71);3.861(0.85);3.794(0.37);3.784(0.4);3.779(0.59);3.765(16);3.754(0.56);3.324(4.47);2.512(5.8);2.508(12.14);2.503(16.16);2.499(11.5);2.494(5.45);1.144(3.13);1.127(7.09);1.109(3.04);1.046(9.45);1.031(9.35);0(9.17);-0.008(0.33)	20
実施例 I-1-016: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,495(2,2);8,489(2,3);8,476(1,5);8,472(1,7);8,464(1,6);8,461(1,7);7,834(0,8);7,831(1,0);7,828(1,0);7,824(0,9);7,814(0,9);7,810(1,1);7,808(1,1);7,804(0,9);7,456(1,2);7,444(1,2);7,435(1,1);7,423(1,1);5,912(5,3);5,753(0,5);3,518(16,0);3,337(15,6);3,317(32,1);3,192(1,3);3,161(1,5);2,712(0,9);2,707(1,0);2,682(1,8);2,676(1,9);2,652(0,9);2,646(0,8);2,524(0,8);2,510(17,1);2,506(36,3);2,501(51,1);2,497(39,3);2,493(19,8);1,646(1,1);1,619(1,2);1,614(1,2);1,490(0,3);1,480(0,4);1,472(0,4);1,463(0,5);1,454(0,4);1,291(0,5);1,282(0,5);1,260(1,0);1,251(1,1);1,230(0,9);1,222(0,9);1,201(0,3);0,933(5,9);0,916(5,6);0,008(1,0);0,000(30,1);-0,008(1,3)	30
実施例 I-1-018: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,512(2,4);8,506(2,4);8,485(1,7);8,482(1,8);8,473(1,8);8,470(1,8);8,314(0,4);8,025(2,5);7,850(0,9);7,846(1,1);7,843(1,0);7,839(0,9);7,829(1,1);7,825(1,1);7,823(1,2);7,819(1,0);7,466(1,3);7,455(1,3);7,446(1,2);7,434(1,1);7,326(1,0);7,318(1,0);7,307(3,1);7,300(2,5);7,290(3,8);7,279(4,2);7,274(4,8);7,253(2,8);7,249(3,0);7,232(1,4);7,223(0,7);7,216(1,2);7,212(1,8);7,208(1,1);7,195(2,8);7,189(0,7);7,178(1,1);5,947(5,7);4,330(0,4);4,325(0,4);4,319(0,4);4,298(0,4);4,293(0,4);4,288(0,4);3,800(0,4);3,794(0,4);3,789(0,4);3,767(0,4);3,762(0,5);3,756(0,4);3,575(16,0);3,350(16,6);3,317(113,0);3,173(0,5);3,165(0,4);3,141(0,8);3,134(0,8);3,108(0,4);3,101(0,4);2,881(0,7);2,850(1,0);2,844(1,1);2,828(0,9);2,814(0,7);2,805(0,5);2,796(0,7);2,788(0,4);2,766(0,4);2,710(0,4);2,702(0,6);2,675(1,7);2,670(2,3);2,666(1,4);2,661(1,1);2,645(1,0);2,638(1,0);2,622(0,3);2,524(3,1);2,519(5,0);2,510(67,0);2,506(141,1);2,501(197,5);2,497(147,5);2,492(70,8);2,332(0,8);2,328(1,1);2,323(0,8);1,841(0,5);1,834(0,5);1,817(2,0);1,810(2,5);1,798(3,3);1,790(2,7);1,771(1,1);1,762(1,0);1,550(0,7);1,539(0,6);1,519(0,6);1,507(0,5);1,477(0,3);1,445(0,6);1,434(0,6);1,414(0,5);1,403(0,5);0,146(0,5);0,008(3,7);0,000(109,9);-0,009(3,8);-0,150(0,5)	40
実施例 I-1-019: <sup>1</sup> H-NMR(400,0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,486(2,0);8,480(2,0);8,460(1,5);8,456(1,6);8,448(1,6);8,444(1,6);8,313(0,5);7,821(0,8);7,817(0,9);7,814(0,9);7,811(0,8);7,800(0,9);7,797(1,0);7,794(1,0);7,790(0,9);7,448(1,1);7,436(1,1);7,428(1,0);7,416(1,0);5,895(5,8);3,547(16,0);3,332(15,8);3,316(32,2);3,303(2,6);3,292(2,0);3,286(5,8);3,269(2,1);2,675(0,6);2,670(0,6);2,666(0,4);2,524(1,5);2,519(2,2);2,510(31,6);2,506(67,0);2,501(94,5);2,496(70,6);2,492(33,9);2,332(0,4);2,328(0,6);2,323(0,4);1,832(2,1);1,823(2,1);1,815(5,7);1,807(2,1);1,798(2,0);1,561(0,4);0,00	

8(1,5);0,000(47,5);-0,009(1,6)	
<b>実施例 I-1-020:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8,497(0,6);8,490(2,8);8,484(2,4);8,474(2,0);8,471(1,9);8,463(2,0);8,459(1,8);8,313(0,4);7,832(1,0);7,828(1,2);7,826(1,0);7,822(0,9);7,812(1,2);7,808(1,2);7,805(1,1);7,802(0,9);7,456(1,3);7,444(1,4);7,435(1,3);7,424(1,2);5,913(5,5);5,906(1,2);3,549(2,9);3,518(16,0);3,339(19,0);3,317(77,1);3,155(1,2);3,128(1,3);2,675(0,6);2,670(0,8);2,666(0,6);2,610(0,3);2,524(2,1);2,510(40,6);2,506(83,5);2,501(115,5);2,497(86,2);2,492(41,4);2,332(0,5);2,328(0,7);2,324(0,5);2,247(1,3);2,219(2,3);2,189(1,5);1,756(1,0);1,749(1,1);1,726(1,5);1,718(1,2);1,700(0,6);1,363(0,3);1,349(0,5);0,980(2,0);0,963(2,0);0,870(0,4);0,853(0,5);0,836(10,4);0,820(10,3);0,764(1,6);0,747(1,5);0,654(0,8);0,624(0,7);0,008(2,1);0,000(60,4);-0,009(2,2)	
<b>実施例 I-1-021:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.572(2.06);8.566(2.11);8.505(1.45);8.502(1.53);8.493(1.55);8.49(1.49);7.94(3.22);7.913(0.84);7.91(1.02);7.903(0.82);7.893(0.94);7.889(1.08);7.887(1.06);7.883(0.88);7.679(3.82);7.625(0.66);7.485(1.15);7.473(1.16);7.464(1.1);7.453(1.04);7.188(0.57);7.185(0.58);6.847(0.61);6.844(0.6);6.247(3.04);5.756(10.05);3.798(16);3.662(3.33);3.403(14.59);3.321(41.24);2.67(0.74);2.506(97.87);2.501(127.31);2.497(94.18);2.333(0.55);2.328(0.73);2.324(0.55);2.094(2.3);2.074(10.47);0.146(0.61);0.008(5.91);0(135.75);-0.008(6.47);-0.15(0.6)	10
<b>実施例 I-1-022:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.138(5.04);8.576(2.35);8.57(2.38);8.514(1.66);8.511(1.72);8.502(1.82);8.499(1.81);8.48(4.97);8.141(0.63);7.873(0.94);7.869(1.19);7.867(1.16);7.863(0.93);7.853(1.07);7.849(1.28);7.847(1.29);7.843(0.99);7.496(1.29);7.484(1.28);7.476(1.26);7.464(1.19);6.938(2.34);5.755(15.9);3.744(16);3.732(1.3);3.424(0.64);3.416(0.85);3.407(1.23);3.398(0.88);3.389(0.67);3.379(0.42);3.321(1.59);2.506(20.92);2.502(27.82);2.498(21.37);2.074(2.06);0.89(0.53);0.872(2.32);0.858(2.38);0.854(2.06);0.841(0.68);0.608(0.7);0.595(2.09);0.589(2.34);0.586(2.16);0.581(2.03);0.568(0.59);0.008(0.84);0(19.56);-0.008(0.97)	20
<b>実施例 I-1-023:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.562(2.48);8.556(2.53);8.5(1.69);8.497(1.88);8.488(1.75);8.485(1.82);7.897(1.18);7.893(1.01);7.882(1.01);7.876(1.29);7.873(1.05);7.834(3.4);7.479(1.35);7.467(1.36);7.458(1.31);7.446(1.19);6.212(3.64);4.098(0.51);4.085(0.53);3.817(16);3.579(0.33);3.411(0.62);3.396(14.94);3.375(0.43);3.321(24.41);3.175(2.52);3.162(2.48);2.671(0.34);2.506(39.91);2.501(52.02);2.497(40.53);2.328(0.33);2.18(14.65);2.09(0.49);1.99(12);1.914(0.58);0(21.58)	
<b>実施例 I-1-024:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.57(1.63);8.564(1.67);8.53(0.44);8.524(0.47);8.504(1.18);8.5(1.36);8.492(1.3);8.489(1.32);8.047(1.87);8.041(1.94);7.911(0.64);7.908(0.79);7.905(0.79);7.901(0.72);7.891(0.73);7.887(0.82);7.885(0.87);7.881(0.73);7.483(0.89);7.47(0.98);7.463(0.91);7.45(0.88);6.348(1.95);6.342(2);6.235(2.41);6.208(0.54);5.756(16);3.811(12.36);3.755(0.58);3.749(3.73);3.415(0.65);3.402(11.54);3.375(3.56);3.32(25.51);2.67(0.4);2.51(25.65);2.506(51.18);2.501(67.9);2.497(51.03);2.328(0.39);2.269(10.65);0.008(1.84);0(44.91);-0.008(2.59)	30
<b>実施例 I-1-025:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.576(1.94);8.57(1.98);8.523(1.38);8.52(1.48);8.512(1.45);8.508(1.44);8.062(2.36);7.928(0.83);7.924(0.99);7.922(1);7.918(0.89);7.908(0.95);7.904(1.07);7.901(1.12);7.898(0.93);7.609(2.44);7.5(1.17);7.488(1.18);7.48(1.11);7.468(1.05);7.136(2.23);6.276(2.27);5.756(3.47);3.666(16);3.409(14.91);3.33(47.46);2.511(11.43);2.506(22.93);2.502(30.49);2.497(22.91);2.493(11.75);0.008(0.56);0(14.89);-0.008(0.68)	
<b>実施例 I-1-026:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 9.182(0.34);9.159(6.04);9.134(0.38);8.585(2.05);8.579(2.06);8.515(1.46);8.512(1.66);8.504(1.59);8.5(1.63);7.933(0.8);7.929(0.95);7.926(0.96);7.922(0.87);7.912(0.93);7.908(1.03);7.906(1.06);7.902(0.91);7.49(1.16);7.478(1.16);7.47(1.09);7.458(1.02);6.37(1.46);3.818(2.05);3.755(16);3.639(1.15);3.426(0.67);3.415(14.38);3.319(35.08);3.174(0.6);3.162(0.58);2.675(0.62);2.67(0.84);2.666(0.64);2.524(2.77);2.51(52.45);2.506(107.24);2.501(143.05);2.497(105.63);2.492(52.77);2.333(0.62);2.328(0.86);2.324(0.63);0.008(1.65);0(46.68);-0.008(1.76)	40
<b>実施例 I-1-027:</b> <sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO):	

$\delta$  = 8.568(3.96);8.562(4.1);8.503(2.85);8.491(2.91);7.909(1.44);7.904(1.84);7.899(1.56);7.888(1.65);7.883(2.05);7.879(1.67);7.733(2.65);7.522(4.63);7.484(2.11);7.472(2.16);7.464(2.09);7.452(1.91);6.264(3.13);6.219(2.65);3.855(16);3.814(12.54);3.401(21.22);3.324(62.51);3.175(0.92);3.162(0.91);2.763(1.32);2.746(2.44);2.727(1.71);2.708(1.64);2.69(2.81);2.671(2.42);2.646(1.37);2.628(2.5);2.61(2.47);2.592(2.23);2.574(1.9);2.506(53.39);2.502(69.77);2.498(51.89);2.468(1.27);2.45(0.43);2.405(0.62);2.387(1.62);2.369(2);2.351(1.24);2.333(0.65);0(57.19)

実施例 I-1-028:  $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

$\delta$  = 8.627(5.21);8.56(3.59);8.554(2.67);8.528(0.44);8.523(0.41);8.5(2.4);8.497(2.48);8.488(2.28);7.898(1.68);7.881(1.61);7.878(1.69);7.477(1.6);7.464(1.9);7.456(1.51);7.445(1.28);6.242(3.41);6.208(0.32);6.084(5.36);5.756(0.58);3.807(16);3.748(1.56);3.694(0.38);3.446(0.51);3.394(15.21);3.375(2.46);3.328(29.27);3.321(64.19);2.67(0.66);2.505(105.11);2.501(111.87);2.328(0.64);1.237(0.38);0.146(0.32);0.006(27.04);0(66.97);-0.15(0.36)

10

実施例 I-1-029:  $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

$\delta$  = 8.556(0.32);8.544(2.61);8.537(2.76);8.53(2.16);8.522(4.8);8.516(3.81);7.913(0.88);7.909(1.09);7.907(1.09);7.904(0.95);7.893(1.03);7.887(1.19);7.883(0.95);7.5(1.33);7.488(1.33);7.48(1.24);7.468(1.12);7.29(3.16);7.284(3.14);6.296(2.49);3.917(1);3.899(3.01);3.881(3.02);3.863(1);3.809(0.36);3.778(16);3.754(1.13);3.732(0.37);3.704(0.66);3.32(42.95);3.174(0.68);3.162(0.68);2.67(0.62);2.666(0.47);2.506(81.79);2.502(106.33);2.497(79.85);2.328(0.62);1.146(3.44);1.128(7.54);1.11(3.52);0.008(0.9);0(19.74)

実施例 I-1-030:  $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz,  $d_6$ -DMSO):

$\delta$  = 8.574(2.04);8.568(2.06);8.504(1.4);8.501(1.5);8.492(1.47);8.489(1.46);8.043(2.66);8.036(2.66);7.916(0.77);7.912(0.95);7.91(0.92);7.906(0.8);7.896(0.88);7.892(1);7.89(0.99);7.886(0.8);7.485(1.09);7.473(1.08);7.464(1.02);7.453(0.95);6.414(2.69);6.408(2.67);6.234(2.96);3.815(14.68);3.404(13.75);3.32(97.79);3.008(0.37);2.991(0.94);2.974(1.27);2.956(0.99);2.939(0.4);2.675(0.66);2.67(0.89);2.666(0.68);2.506(121.42);2.501(158.45);2.497(116.77);2.332(0.7);2.328(0.93);2.324(0.69);1.252(16);1.234(15.75);0.008(0.78);0(21.82);-0.008(0.96)

20

実施例 I-1-031:  $^1\text{H-NMR}$ (601.6 MHz,  $d_6$ -DMSO):

$\delta$  = 9.506(0.41);9.465(5.89);8.589(2.13);8.586(2.18);8.514(1.63);8.512(1.69);8.506(1.68);8.504(1.62);7.931(0.92);7.929(1.12);7.927(1.09);7.925(0.97);7.918(1.02);7.915(1.15);7.914(1.15);7.911(0.96);7.486(1.22);7.485(1.2);7.478(1.21);7.472(1.22);7.471(1.18);7.464(1.12);6.43(0.8);3.85(1.32);3.818(0.49);3.781(16);3.433(0.6);3.424(14.14);3.314(1.82);2.508(4.44);2.505(8.94);2.502(12.04);2.499(9.08);2.496(4.57)

#### 【 0 2 4 4 】

30

( a ) 表及び調製実施例において報告されている  $\log P$  値は、「 E E C d i r e c t i v e 7 9 / 8 3 1 A n n e x V . A 8 」に従い、逆相カラム ( C 1 8 ) を使用する H P L C ( 高性能液体クロマトグラフィー ) によって求めた。温度 4 3 。較正は、  $\log P$  値が知られている非分枝鎖アルカン - 2 - オン ( 3 個 ~ 1 6 個の炭素原子を有している ) を用いて実施する。

#### 【 0 2 4 5 】

酸性範囲内における LC - MS による  $M^+$  の測定は、移動相 [ 0 . 1 % 水性ギ酸及びアセトニトリル ( 0 . 1 % ギ酸含有 ) ; 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルまでの直線勾配 ] を使用して、 pH 2 . 7 で実施した。機器 : A g i l e n t 1 1 0 0 LC システム、A g i l e n t MSD システム、H T S P A L。

40

#### 【 0 2 4 6 】

中性範囲内における LC - MS による  $M^+$  の測定は、移動相 [ 0 . 0 0 1 モル重炭酸アンモニウム水溶液及びアセトニトリル ; 1 0 % アセトニトリルから 9 5 % アセトニトリルまでの直線勾配 ] を使用して、pH 7 . 8 で実施した。

#### 【 0 2 4 7 】

表及び上記調製実施例において、酸性範囲に関する  $\log P$  値 (  $\log P [ a ]$  ) として ) 及び / 又は中性範囲に関する  $\log P$  値 (  $\log P [ n ]$  ) として ) を記載した。

#### 【 0 2 4 8 】

( b )  $^1\text{H-NMR}$  データの測定は、対照標準 ( 0 . 0 ) としてのテトラメチルシラン及び溶媒 (  $\text{CD}_3\text{CN}$ 、 $\text{CDCl}_3$  又は  $\text{D}_6$  - DMSO ) を使用して、サンプルフロー

50

ヘッド（容積 60  $\mu$ L）が装備されている「Bruker Avance 400」を用いて実施した。

【0249】

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

【0250】

#### NMRピークリスト法

選択された実施例の $^1\text{H}$  NMRデータは、 $^1\text{H}$  NMRピークリストの形態で示されている。各シグナルピークに対して、最初に値（ppm）が記載され、次に、丸括弧内に、シグナル強度が記載されている。種々のシグナルピークに関する値 - シグナル強度数の対が、セミコロンで互いに区切られて記載されている。

10

【0251】

従って、1つの例に対するピークリストは、以下の形態をとる：

$i$ （強度 $_i$ ）；  $j$ （強度 $_j$ ）； . . . ；  $i$ （強度 $_i$ ）； . . . ；  $n$ （強度 $_n$ ）。

【0252】

先鋭なシグナルの強度は、NMRスペクトルの印刷された例におけるシグナルの高さ（cm）と相関し、シグナル強度の真の比率を示している。幅が広いシグナルの場合、数種類のピーク又は該シグナルの中央及びそれらの相対的強度が、当該スペクトルの中の最も強いシグナルとの比較で示され得る。

【0253】

20

$^1\text{H}$  NMRスペクトルの化学シフトの較正は、テトラメチルシランを使用して実施するか、及び/又は、特にスペクトルがDMSO中で測定される場合には、その溶媒の化学シフトを使用して実施する。従って、NMRピークリストの中には、テトラメチルシランのピークは存在し得るが、必ずしも存在する必要はない。

【0254】

$^1\text{H}$  NMRピークのリストは、従来の $^1\text{H}$  - NMRのプリントアウトと類似しており、従って、通常、NMRの慣習的な解釈で記載される全てのピークを含んでいる。

【0255】

さらに、それらは、従来の $^1\text{H}$  NMRのプリントアウトのように、溶媒のシグナル、目標化合物の立体異性体（これも、同様に、本発明によって提供される）のシグナル及び/又は不純物のピークのシグナルも示し得る。

30

【0256】

溶媒及び/又は水のデルタ範囲内における化合物シグナルの記録において、 $^1\text{H}$  NMRピークの本発明者らによるリストは、標準的な溶媒のピーク、例えば、DMSO- $\text{D}_6$ 中のDMSOのピーク及び水のピーク（これらは、通常、平均して高い強度を有している）を示している。

【0257】

目標化合物の立体異性体のピーク及び/又は不純物のピークは、通常、平均して、目標化合物（例えば、90%を超える純度を有する目標化合物）のピークよりも低い強度を有している。

40

【0258】

そのような立体異性体及び/又は不純物は、特定の調製方法に対して特有であり得る。従って、それらのピークは、この場合、「副産物の指紋（by-product fingerprint）」に関して、本発明者らの調製方法の再現性を確認するのに役立ち得る。

【0259】

目標化合物のピークを既知方法（MestrelC、ACDシミュレーション、さらに、経験的に評価された期待値の使用）で計算する専門家は、必用に応じて、場合により付加的な強度フィルターを使用して、目標化合物のピークを分離することができる。この分離は、 $^1\text{H}$  NMRの慣習的な解釈における当該ピークのピッキングに類似しているである

50

う。

【0260】

<sup>1</sup>H NMRピークリストに関するさらなる詳細については、「Research Disclosure Database Number 564025」の中に見いだすことができる。

【0261】

使用実施例

以下の実施例は、本発明による化合物の殺虫効果及び殺ダニ効果を実証している。これらの実施例において、記載されている本発明化合物は、対応する参照数字（No.）を伴って表1の中に記載されている化合物に関連している。

【0262】

オウシマダニ（Boophilus microplus）- 注入試験

溶媒： ジメチルスルホキシド

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、10mgの活性化化合物を0.5mLの溶媒と混合させ、得られた濃厚物を溶媒で希釈して所望の濃度とする。

【0263】

充血した5匹の成体雌オウシマダニ（Boophilus microplus）の腹部に1μLの該活性化化合物溶液を注入する。その動物をシャーレの中に移し、人工気象室（climate-controlled room）の中で維持する。

【0264】

その効力は、7日後に、受精卵の産卵によって評価する。受精卵であることが明白ではない卵は、約42日後に幼虫が孵化するまで人工気象室（climate-controlled cabinet）の中に保存する。100%の効力は、受精卵を産卵したオウシマダニが無かったことを意味し；0%は、全ての卵が受精卵であることを意味する。

【0265】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、動物1匹当たり20μgの施用量で、80%の効力を示す： I-1-031。

【0266】

モモアカアブラムシ（Myzus persicae）- 経口試験

溶媒： 100重量部のアセトン

活性化化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、水を用いて調合する。

【0267】

50μLの該活性化化合物調製物をマイクロタイタープレートの中に移し、150μLのIPL41昆虫培地（33%+15%糖）を用いて最終体積200μLとする。次いで、そのプレートをパラフィルムで密閉し、第2のマイクロタイタープレートの中のモモアカアブラムシ（Myzus persicae）の混合個体群がそのパラフィルムに孔を開け、そこから上記溶液を吸入することができる。

【0268】

5日間経過した後、効力（%）を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

【0269】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、20ppmの施用量で、100%の効力を示す： I-1-001、I-1-002、I-1-003、I-1-004、I-1-005、I-1-006、I-1-007、I-1-008、I-1-009、I-1-010、I-1-011、I-1-012、I-1-013、I-1-014、I-1-015、I-1-016、I-1-017、I-1-018、I-1-019、I-1-020、I-1-021、I-1-022。

【0270】

モモアカアブラムシ（Myzus persicae）- 噴霧試験

溶媒： 78重量部のアセトン  
 1.5重量部のジメチルホルムアミド  
 乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性成分の適切な配合物を製造するために、1重量部の活性成分を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

#### 【0271】

全ての成育段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物配合物を噴霧する。

10

#### 【0272】

5-6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0%は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

#### 【0273】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、100%の効力を示す： I-1-004、I-1-006、I-1-007、I-1-008、I-1-009、I-1-010、I-1-011、I-1-013、I-1-017、I-1-018、I-1-019、I-1-020、I-1-021。

#### 【0274】

20

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： I-1-001、I-1-002、I-1-003、I-1-005、I-1-012、I-1-014、I-1-015、I-1-016、I-1-022。

#### 【0275】

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 噴霧試験；OP - 抵抗性

溶媒： 78.0重量部のアセトン  
 1.5重量部のジメチルホルムアミド  
 乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

30

#### 【0276】

全ての成育段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が発生しているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物配合物を噴霧する。

#### 【0277】

6日間経過した後、効力(%)を求める。100%は、全てのナミハダニが死んだことを意味し；0%は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

40

#### 【0278】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、500g/haの施用量で、90%の効力を示す： I-1-009、I-1-015。

#### 【0279】

比較実施例 (*Deposition examples*)

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 噴霧試験 (MYZUPE)

溶媒： 78重量部のアセトン  
 1.5重量部のジメチルホルムアミド  
 乳化剤： アルキルアリールポリグリコールエーテル

50

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0280】

全ての育成段階のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) が発生しているハクサイ (*Brassica pekinensis*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。

【0281】

所望の期間 (dat) が経過した後、効力 (%) を求める。100% は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0% は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

10

【0282】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す：表3を参照されたい。

【0283】

モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) - 経口試験 (MYZUPE O)

溶媒：100重量部のアセトン

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、水を用いて調合する。

20

【0284】

50μLの該活性化合物調製物をマイクロタイタープレートの中に移し、150μLのIPL41昆虫培地 (33% + 15% 糖) を用いて最終体積200μLとする。次いで、そのプレートをパラフィルムで密閉し、第2のマイクロタイタープレートの中のモモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) の混合個体群がそのパラフィルムに孔を開け、そこから上記溶液を吸入することができる。

【0285】

所望の期間 (dat) が経過した後、効力 (%) を求める。100% は、全てのモモアカアブラムシが死んだことを意味し；0% は、死んだモモアカアブラムシが無かったことを意味する。

30

【0286】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す：表3を参照されたい。

【0287】

ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) - 噴霧試験；OP - 抵抗性 (TETRUR)

溶媒：78.0重量部のアセトン

1.5重量部のジメチルホルムアミド

乳化剤：アルキルアリアルポリグリコールエーテル

40

活性化合物の適切な調製物を製造するために、1重量部の活性化合物を上記重量部の溶媒を用いて溶解させ、所望の濃度が達成されるまで、1000ppmの濃度の乳化剤を含有している水を用いて調合する。さらなる試験濃度を得るために、該配合物を乳化剤を含有している水で希釈する。

【0288】

全ての育成段階のナミハダニ (*greenhouse red spider mite*) (*Tetranychus urticae*) が発生しているインゲンマメ (*Phaseolus vulgaris*) の葉のディスクに、所望濃度の活性化合物調製物を噴霧する。

【0289】

50



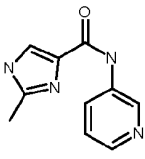
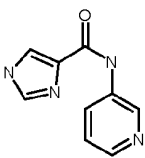
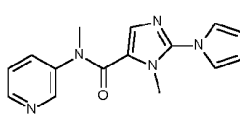
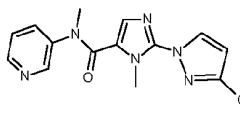
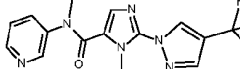
所望の期間 ( d a t ) が経過した後、効力 ( % ) を求める。 1 0 0 % は、全てのナミハダニが死んだことを意味し ; 0 % は、死んだナミハダニが無かったことを意味する。

【 0 2 9 0 】

この試験において、例えば、調製実施例の下記化合物は、従来技術よりも優れた効力を示す : 表 3 を参照されたい。

表 3

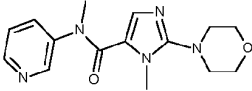
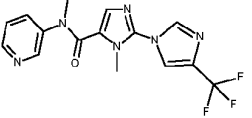
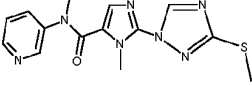
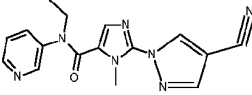
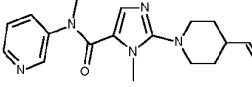
【表 3】

物質	構造	動物種	濃度	効力 (%) [dat]
Ex. No. 14 従来技術 W02011/009804		MYZUPE	100 g ai/ha	0 5/6 dat
		MYZUPE O	4 ppm	0 5 dat
			0.8 ppm	0 5 dat
		TETRUR	500 g/ha	0 6 dat
Ex. No. 13 従来技術 W02011/009804		MYZUPE	100 g ai/ha	0 6 dat
		MYZUPE O	4 ppm	0 5 dat
			0.8 ppm	0 5 dat
		TETRUR	500 g/ha	0 6 dat
Ex. No. I-1-001 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
		MYZUPE O	4 ppm	100 5 dat
			0.8 ppm	100 5 dat
Ex. No. I-1-004 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90 6 dat
		MYZUPE O	4 ppm	100 5 dat
			0.8 ppm	100 5 dat
Ex. No. I-1-006 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	100 6 dat
		MYZUPE O	0.8 ppm	100 5 dat

10

20

30

Ex. No. I-1-009 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 dat
		MYZUPE O	0.8 ppm	70	5 dat
		TETRUR	500 g/ha	90	6 dat
Ex. No. I-1-010 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	6 dat
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
			0.8 ppm	100	5 dat
Ex. No. I-1-011 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	70	5 dat
		MYZUPE O	4 ppm	90	5 dat
			0.8 ppm	90	5 dat
Ex. No. I-1-015 本発明		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
			0.8 ppm	100	5 dat
		TETRUR	500 g/ha	90	6 dat
Ex. No. I-1-017 本発明		MYZUPE	100 g ai/ha	90	5 dat
		MYZUPE O	4 ppm	100	5 dat
			0.8 ppm	100	5 dat

10

20

## フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		
A 0 1 N	43/56	(2006.01)	A 0 1 N	43/56 D
A 0 1 N	43/84	(2006.01)	A 0 1 N	43/84 1 0 1
A 0 1 N	43/653	(2006.01)	A 0 1 N	43/653 N
A 0 1 M	1/20	(2006.01)	A 0 1 M	1/20 A

- (74)代理人 100137213  
弁理士 安藤 健司
- (74)代理人 100143823  
弁理士 市川 英彦
- (74)代理人 100151448  
弁理士 青木 孝博
- (74)代理人 100183519  
弁理士 櫻田 芳恵
- (74)代理人 100196483  
弁理士 川崎 洋祐
- (74)代理人 100203035  
弁理士 五味淵 琢也
- (74)代理人 100185959  
弁理士 今藤 敏和
- (74)代理人 100160749  
弁理士 飯野 陽一
- (74)代理人 100160255  
弁理士 市川 祐輔
- (74)代理人 100202267  
弁理士 森山 正浩
- (74)代理人 100146318  
弁理士 岩瀬 吉和
- (74)代理人 100127812  
弁理士 城山 康文
- (72)発明者 ハイル, マルクス  
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、アム・ヴァイセン・シュタイン・4 3アー
- (72)発明者 フィッシャー, ライナー  
ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、ネリー - ザックス - シュトラッセ・2 3
- (72)発明者 ヤンセン, ヨハンネス - ルドルフ  
ドイツ国、4 0 7 8 9・モンハイム、クニブラータースシュトラッセ・4 7
- (72)発明者 ヴィルケ, デイビッド  
ドイツ国、4 0 2 1 9・デュッセルドルフ、フリーデンシュトラッセ・3 9
- (72)発明者 ウィロット, マシュー  
ドイツ国、4 0 2 1 5・デュッセルドルフ、ヤーンシュトラッセ・1 5
- (72)発明者 キューブラー, スザンヌ  
ドイツ国、4 0 5 8 9・デュッセルドルフ、パストーア - デル - リング・5 2
- (72)発明者 イルグ, ケルスティン  
ドイツ国、5 0 6 7 0・ケルン、ノイッサー・ヴァル・3 2
- (72)発明者 アイルムース, サッシャ  
ドイツ国、4 2 7 9 9・ライヒリンゲン、ノイエンカンブ・9アー
- (72)発明者 ローゼル, ペーター  
ドイツ国、5 1 3 7 1・レーパークーゼン、アム・ショッカー・5

- (72)発明者 アンデルシュ, ヴォルフラム  
ドイツ国、5 1 4 6 9・ベルギッシュ・グラートバハ、シュロダーディヒャー・ヴェーク・7 7
- (72)発明者 ジェルゲン, ウルリッヒ  
ドイツ国、4 0 8 8 2・ラーティンゲン、フェスター・シュトラッセ・3 7

審査官 池上 佳菜子

- (56)参考文献 特表2 0 1 3 - 5 0 0 2 4 6 ( J P , A )  
米国特許出願公開第2 0 1 0 / 0 3 0 5 1 2 4 ( U S , A 1 )  
特表2 0 1 9 - 5 0 7 1 4 1 ( J P , A )  
特表2 0 1 9 - 5 0 6 4 1 5 ( J P , A )  
特表2 0 1 2 - 5 2 9 5 1 1 ( J P , A )  
特表2 0 0 4 - 5 3 4 0 9 8 ( J P , A )

- (58)調査した分野(Int.Cl. , D B名)  
C 0 7 D 4 0 1 / 0 0 - 4 2 1 / 1 4  
C A p l u s / R E G I S T R Y ( S T N )