

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号
特許第6704397号
(P6704397)

(45) 発行日 令和2年6月3日 (2020. 6. 3)

(24) 登録日 令和2年5月14日 (2020. 5. 14)

(51) Int. Cl.

F I

CO7D 471/04 (2006. 01)

AO1N 43/90 (2006. 01)

AO1P 7/04 (2006. 01)

AO1P 7/02 (2006. 01)

AO1P 5/00 (2006. 01)

CO7D 471/04

CO7D 471/04

AO1N 43/90

AO1P 7/04

AO1P 7/02

IO7Z

CSP

IO4

請求項の数 5 (全 104 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2017-535056 (P2017-535056)	(73) 特許権者	300091441
(86) (22) 出願日	平成27年12月28日 (2015. 12. 28)		シンジェンタ パーティシペーションズ
(65) 公表番号	特表2018-504397 (P2018-504397A)		アーゲー
(43) 公表日	平成30年2月15日 (2018. 2. 15)		スイス国4058 パーゼル、シュバルツ
(86) 国際出願番号	PCT/EP2015/081255		バルトアレー 215
(87) 国際公開番号	W02016/107831	(74) 代理人	100094569
(87) 国際公開日	平成28年7月7日 (2016. 7. 7)		弁理士 田中 伸一郎
審査請求日	平成30年12月25日 (2018. 12. 25)	(74) 代理人	100088694
(31) 優先権主張番号	PCT/CN2014/095773		弁理士 弟子丸 健
(32) 優先日	平成26年12月31日 (2014. 12. 31)	(74) 代理人	100084663
(33) 優先権主張国・地域又は機関	中国 (CN)		弁理士 箱田 篤
		(74) 代理人	100093300
			弁理士 浅井 賢治
		(74) 代理人	100119013
			弁理士 山崎 一夫
			最終頁に続く

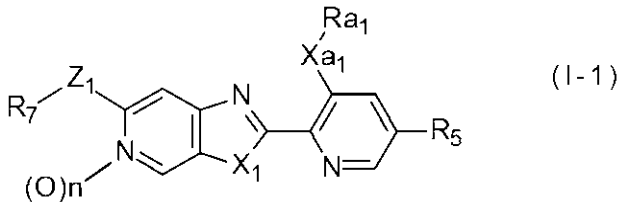
(54) 【発明の名称】 硫黄含有置換基を有する殺有害生物的に活性な多環式誘導体

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I - 1

【化 1】



10

(式中、
X_{a1}が、S、SOまたはSO₂であり；
X₁が、N (C₁ ~ C₃アルキル) であり；
R_{a1}が、C₁ ~ C₆アルキルまたはシクロプロピルメチルであり；
R₅が、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₁ ~ C₆ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆アルキルスルファニル、C₁ ~ C₆アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆アルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルファニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルホニル、またはC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキルであり；

20

Z_1 が、酸素、S、SOまたはSO₂であり；

R_7 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルまたは $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルシアノ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキル、またはハロゲン、シアノおよび $C_1 \sim C_4$ アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルであり；

n が、0または1である）

の化合物、または前記化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体もしくはN-オキシド。

10

【請求項2】

— X_{a_1} が、SまたはSO₂であり；

X_1 が、N($C_1 \sim C_3$ アルキル)であり；

R_{a_1} が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

— Z_1 が、酸素、S、SOまたはSO₂であり；

R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたはハロゲンであり；および

R_7 が、シアノで置換され得る $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、または

R_7 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的にまたは殺軟体動物的に有効な量の請求項1に記載の式I-1の化合物と、そのための好適な担体または希釈剤とを含む、殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物組成物。

20

【請求項4】

有害生物に対処(combat)し、かつそれを防除する方法であって、殺有害生物的に有効な量の請求項1に記載の式I-1の化合物または前記化合物を含む組成物を有害生物、有害生物の場所、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用する工程を含む方法であって、ヒトの治療方法を除く、方法。

【請求項5】

有害生物に対処し、かつそれを防除する方法であって、請求項4に記載の殺有害生物組成物を有害生物、有害生物の場所、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用する工程を含む方法であって、ヒトの治療方法を除く、方法。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

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

【背景技術】

【0002】

殺有害生物作用を有する複素環化合物は、公知であり、例えば、国際公開第2012/086848号および国際公開第2013/018928号に記載されている。ここで、硫黄含有フェニルおよびピリジル置換基を有する新規な殺有害生物的に活性な三環式環誘導体が発見された。

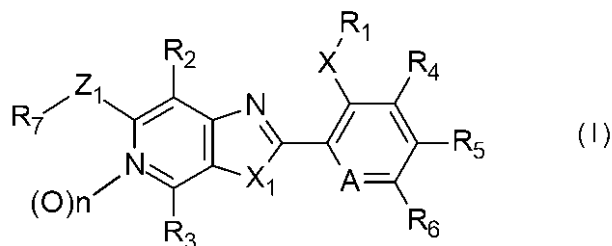
40

【発明の概要】

【0003】

したがって、本発明は、式I

【化 1】



(式中、

A が、C H、N、またはN Oであり；

X が、S、S OまたはS O₂であり；X₁ が、O、S、またはN (C₁ ~ C₃アルキル)であり；R₁ が、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₃ ~ C₆シクロアルキル、C₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₆アルキルであるか；またはR₁ が、ハロゲン、シアノおよびC₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₆アルキルであるか；またはR₁ が、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニルまたはC₂ ~ C₆アルキニルであり；R₂ が、水素またはC₁ ~ C₃アルキルであり；R₃ が、水素またはC₁ ~ C₃ - アルキルであり；R₄およびR₆が、水素またはC₁ ~ C₃アルキルであり；R₅が、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₁ ~ C₆ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆アルキルスルファニル、C₁ ~ C₆アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆アルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルファニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルホニル、またはC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキルであり；Z₁が、酸素、S、S OまたはS O₂であり、ただし、R₇が水素である場合、Z₁が、S OおよびS O₂と異なっており；R₇が、水素、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニルまたはC₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₁ ~ C₆アルキルシアノ、C₃ ~ C₆シクロアルキル、C₃ ~ C₆ハロシクロアルキル、C₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキル、またはハロゲン、シアノおよびC₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキルであり；

n が、0 または1である)

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

【0004】

少なくとも1つの塩基性中心 (basic centre) を有する式 I の化合物は、例えば酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、リン酸またはハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換されるC₁ ~ C₄アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和または不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸またはフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸またはクエン酸、または例えば安息香酸との酸付加塩、または有機スルホン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換されるC₁ ~ C₄アルカン - またはアリールスルホン酸、例えばメタン - またはp - トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式 I の化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリ

10

20

30

40

50

ウム塩またはマグネシウム塩、またはアンモニアまたは有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ -、ジ - またはトリ - 低級アルキルアミン、例えばエチル -、ジエチル -、トリエチル - またはジメチルプロピルアミン、またはモノ -、ジ - またはトリヒドロキシ - 低級アルキルアミン、例えばモノ -、ジ - またはトリエタノールアミンを形成することができる。

【 0 0 0 5 】

置換基の定義中に存在するアルキル基は、直鎖状または分枝鎖状であり得、例えば、メチル、エチル、*n* - プロピル、イソプロピル、*n* - ブチル、*sec* - ブチル、イソ - ブチル、*tert* - ブチル、ペンチル、ヘキシル、およびそれらの分枝鎖状異性体である。

【 0 0 0 6 】

アルキルスルファニル、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルコキシ、アルケニルおよびアルキニル基は、記載されるアルキル基から誘導される。

【 0 0 0 7 】

アルケニルおよびアルキニル基は、一価不飽和または多価不飽和であり得る。 $C_2 \sim C_6$ アルケニルおよび $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基は、2 ~ 5 個の炭素原子の鎖長を有するものであり、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル基は、ハロゲンが、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素、特にフッ素および塩素である場合、例えば1 - クロロビニル、2 - クロロビニル、2, 2 - ジフルオロビニル、2, 2 - ジフルオロプロパ - 1 - エン - 2 - イル、2, 2 - ジクロロビニル、3 - フルオロプロパ - 1 - エニル、クロロプロパ - 1 - エン - 1 - イル、3 - プロモプロパ - 1 - エン - 1 - イル、2, 3, 3 - トリフルオロプロパ - 2 - エン - 1 - イル、2, 3, 3 - トリクロロプロパ - 2 - エン - 1 - イルおよび4, 4, 4 - トリフルオロブタ - 2 - エン - 1 - イルである。ハロアルキニルとして好適なものは、例えば、モノハロゲン化またはポリハロゲン化アルキニル基であり、ハロゲンが、臭素、ヨウ素、特にフッ素および塩素である場合、例えば3 - フルオロプロピニル、3 - クロロプロピニル、3 - プロモプロピニル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピニルおよび4, 4, 4 - トリフルオロブタ - 2 - イン - 1 - イルである。

【 0 0 0 8 】

アルコキシ基は、好ましくは、1 ~ 6 個の炭素原子の鎖長を有する。アルコキシは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、*i* - プロポキシ、*n* - ブトキシ、イソ - ブトキシ、*sec* - ブトキシおよび*tert* - ブトキシおよびペンチルオキシおよびヘキシルオキシ異性体；好ましくは、メトキシおよびエトキシである。

【 0 0 0 9 】

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

【 0 0 1 0 】

1 ~ 6 個までの炭素原子の鎖長を有するハロアルキル基は、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2 - クロロエチル、2 - フルオロプロパ - 2 - イル、ペンタフルオロエチル、1, 1 - ジフルオロ - 2, 2, 2 - トリクロロエチル、2, 2, 3, 3 - テトラフルオロエチルおよび2, 2, 2 - トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ - *n* - プロピル、ペルフルオロ - *n* - ヘキシルであり； R_7 、および R_5 の意味におけるハロアルキル基は、好ましくは、プロモ（ジフルオロ）メチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ペンタフルオロエチルまたはヘプタフルオロ - *n* - プロピルである。

【 0 0 1 1 】

ハロアルコキシ基は、好ましくは、1 ~ 6 個の炭素原子の鎖長を有する。ハロアルコキシは、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエトキシ、2 - フルオロエトキシ、2 - クロロエトキシ、2, 2 - ジフルオロエトキシおよび2, 2, 2 - トリク

10

20

30

40

50

ロロエトキシ；好ましくは、ジフルオロメトキシ、2 - クロロエトキシ、ブromo（ジフルオロ）メトキシ、およびトリフルオロメトキシである。

【0012】

アルキルスルファニル基は、好ましくは、1 ~ 8 個の炭素原子の鎖長を有する。アルキルチオは、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソ - プロピルチオ、n - ブチルチオ、イソ - ブチルチオ、sec - ブチルチオまたはtert - ブチルチオ、好ましくは、メチルチオおよびエチルチオである。アルキルスルファニルは、ハロゲン原子で一置換または多置換され得る。

【0013】

アルキルスルフィニルは、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソ - プロピルスルフィニル、n - ブチルスルフィニル、イソ - ブチルスルフィニル、sec - ブチルスルフィニル、tert - ブチルスルフィニル；好ましくは、メチルスルフィニルおよびエチルスルフィニルである。アルキルスルフィニルは、ハロゲン原子で一置換または多置換され得る。

【0014】

アルキルスルホニルは、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソ - プロピルスルホニル、n - ブチルスルホニル、イソ - ブチルスルホニル、sec - ブチルスルホニルまたはtert - ブチルスルホニル；好ましくは、メチルスルホニルまたはエチルスルホニルである。アルキルスルホニルは、ハロゲン原子で一置換または多置換され得る。

【0015】

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

【0016】

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

【0017】

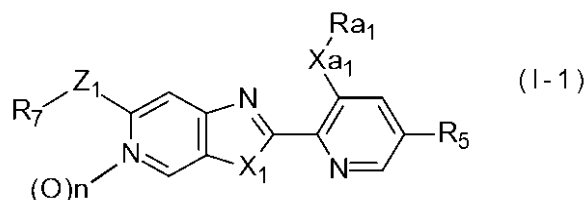
本発明に係る式 I の化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

【発明を実施するための形態】

【0018】

式 I の化合物の好ましい基は、式 I - 1

【化 2】



（式中、R₅、R₇、Z₁、nおよびX₁が、上の式 I で定義されるとおりであり；ここで、X_{a1}が、S、SOまたはSO₂であり；R_{a1}が、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピルまたはシクロプロピルメチルである）

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

【0019】

式 I - 1 の化合物のこの好ましい基において、R₅が、好ましくは、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₃ハロアルキル、C₁ ~ C₃ハロアルコキシ、C₁ ~ C₃アルキルスルファニル、C₁ ~ C₃アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₃アルキルスルホニル、C₁ ~ C₃ハロアルキルスルファニル、C₁ ~ C₃ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₃ハロアルキルスルホニルであり

、 Xa_1 が、好ましくは、 SO_2 であり、 Ra_1 が、好ましくは、エチルであり、 X_1 が、好ましくは、 N -メチルであり、 Z_1 が、酸素または硫黄であり、 n が、0または1であり、 R_7 が、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、またはハロゲンで一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

【0020】

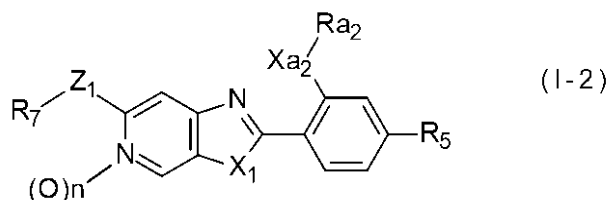
式I-1のより非常に好ましい化合物は、 R_5 が、水素または $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり、 Xa_1 が、 SO_2 であり、 Ra_1 が、エチルであり、 X_1 が、好ましくは、 N -メチルであり、 Z_1 が、酸素、 S 、 SO 、 SO_2 であり、 n が、0であり、 R_7 が、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであるものである。

10

【0021】

式Iの化合物のさらなる好ましい基は、式I-2：

【化3】



20

(式中、 R_5 、 R_7 、 Z_1 、 n および X_1 が、上の式Iで定義されるとおりであり；ここで、 Xa_1 が、 S 、 SO または SO_2 であり； Ra_1 が、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピルまたはシクロプロピルメチルである)

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

【0022】

式I-1の化合物のこの好ましい基において、 R_5 が、好ましくは、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルスルホニルであり、 Xa_1 が、好ましくは、 SO_2 であり、 Ra_1 が、好ましくは、エチルであり、 X_1 が、好ましくは、 N -メチルであり、 Z_1 が、酸素または硫黄であり、 n が、0または1であり、 R_7 が、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ ハロアルキニル、 $C_3 \sim C_6$ ハロシクロアルキル、またはハロゲンで一置換または多置換される $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル- $C_1 \sim C_4$ アルキルである。

30

【0023】

式I-2のより非常に好ましい化合物は、 R_5 が、水素または $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり、 Xa_1 が、 SO_2 であり、 Ra_1 が、エチルであり、 X_1 が、好ましくは、 N -メチルであり、 Z_1 が、酸素、 S 、 SO または SO_2 であり、 n が、0であり、 R_7 が、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであるものである。

40

【0024】

式Iの化合物の好ましい基において、

A が、 N であり；

X が、 S または SO_2 であり；

X_1 が、 N ($C_1 \sim C_3$ アルキル)であり；

R_1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、好ましくは、エチルであり；

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が、水素であり；

Z_1 が、酸素、 S 、 SO または SO_2 、特に S または SO であり；

R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたはハロゲンであり；および

R_7 が、シアノで置換され得る $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、または

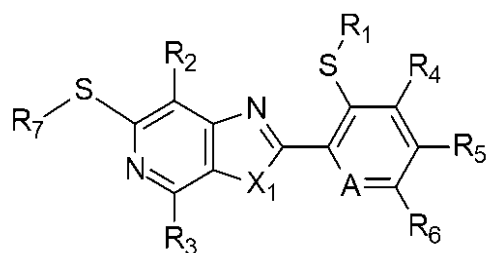
50

R_7 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；好ましくは、 R_7 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルであり；好ましくは、 n が、0である。

【0025】

式Iの化合物を調製するための本発明に係る方法は、当業者に公知の方法によって行われる。例えば、式Ia；

【化4】



(Ia)

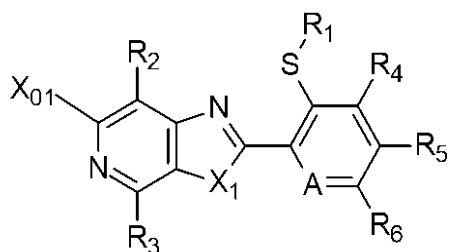
10

(式中、 R_7 、 R_6 、 R_5 、 R_4 、 R_3 、 R_2 、 R_1 、 X_1 、およびAが、式Iにおいて定義されるとおりである)

の化合物は、25 ~ 120 の温度において不活性溶媒（アセトニトリルなど）中で（bpy）CuSR₇（式中、 R_7 が、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである）（実験部分に記載されているように調製される）との反応により、式II

20

【化5】



(II)

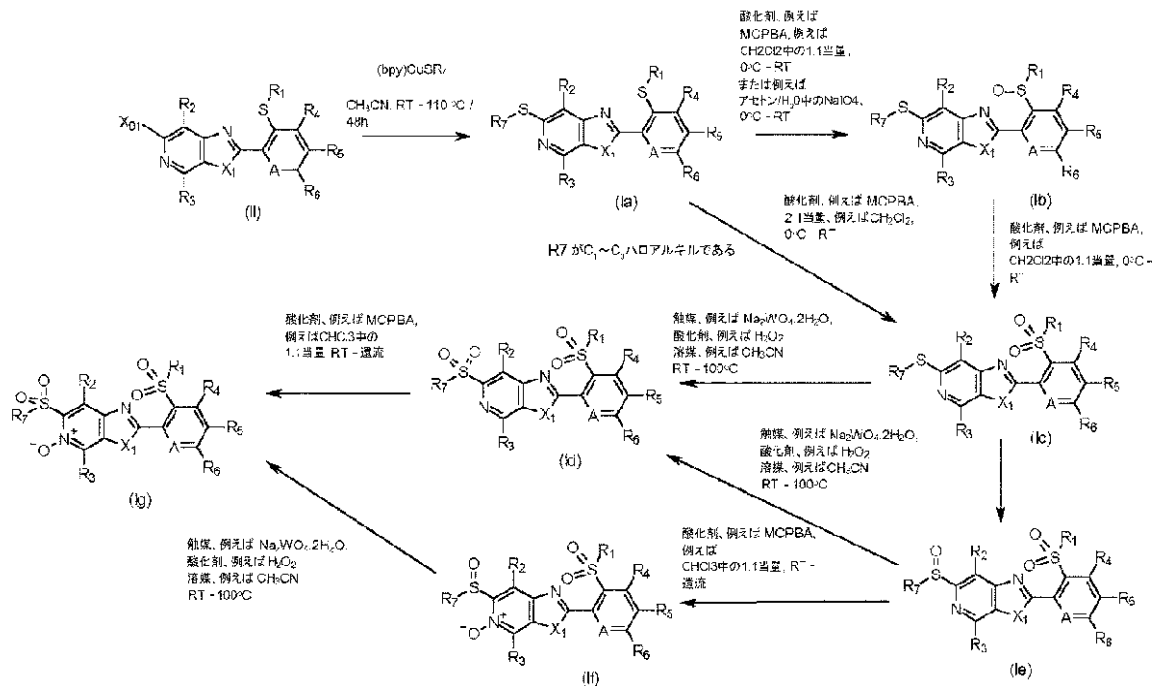
30

(式中、A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、および X_1 が、式Iに記載されるとおりであり、 X_{01} がハロゲンである)

の化合物から調製され得る。このような化学反応は、公知であり、文献に記載されている（Angew. Chem. Int. Ed. 2013, 52, 1548 - 1552）。式Iaの化合物は、当業者に公知であり、かつ国際公開第2013/018928号および国際公開第2012/086848号に記載され、スキーム1に示されるものと類似した方法により、式Ib、Ic、Id、Ie、If、Ig、およびIhの化合物へとさらに酸化され得る。

【化6】

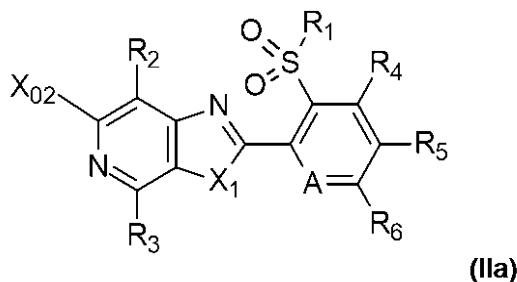
スキーム1.



【0026】

したがって、式I aの化合物は、ジクロロメタンおよびクロロホルム、メタノールおよびエタノールなどのアルコール、酢酸、水、およびそれらの混合物などの不活性溶媒中において、例えば過ヨウ素酸ナトリウムまたはm-クロロ過安息香酸で処理することにより、式I bの化合物へと酸化され得る。反応に使用される酸化剤の量は、1モルの本発明の化合物I aに対して、一般に、1～3モル、好ましくは、1～1.1モルである。反応物の反応温度は、一般に、0 から室温の範囲内である。式(I c)によって表される化合物は、不活性溶媒中において、m-クロロ過安息香酸などの酸化剤の存在下で化合物(I a)を反応させることによって生成され得る。反応に使用される溶媒の例としては、ジクロロメタンおよびクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；酢酸；水；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用される酸化剤の例としては、m-クロロ過安息香酸過酸化水素溶液が挙げられる。反応に使用される酸化剤の量は、1モルの本発明の化合物(I a)に対して、一般に、1～4モル、好ましくは、2.1モルである。反応物の反応温度は、一般に、0 から室温の範囲内である。反応は、触媒の存在下で行われ得る。反応に使用される触媒の例としては、タングステン酸ナトリウムが挙げられる。SR₇基(ここで、R₇が、C1～C3-ハロアルキルである)は、より酸化しにくいいため、I d、I f、I g、I h、およびI eの化合物は、一般に、触媒、例えばタングステン酸ナトリウムの存在下でm-クロロ過安息香酸または過酸化水素溶液などの酸化剤を用いて、より高い温度を必要とする。当業者は、酸化の程度および位置が、酸化剤の当量および反応温度のような要因に応じて決まることを理解するであろう。当業者は、生成物の混合物が形成される場合でさえ、これらが結晶化またはクロマトグラフィー技術によって分離され得、酸化の位置および程度が質量分析、NMR技術および¹³C-¹H結合定数などの分光学的方法によって決定され得ることも理解するであろう。同様に、式I c、I d、I e、I g、およびI fの化合物は、スキーム1に記載されている方法により、式I cの化合物を得るための(bpy)CuSR₇との反応およびその後の酸化により、式I I a；

【化 7】



10

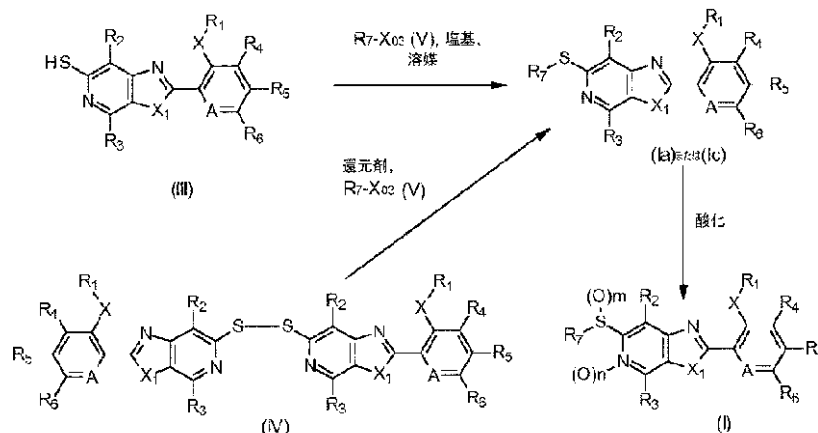
(式中、A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、および X_1 が、式 I に記載されるとおりであり、 X_{02} がハロゲンである)
の化合物から出発して得られる。

【0027】

式 I の化合物のさらなる合成が、スキーム 3 に示される：

【化 8】

スキーム 3



20

30

したがって、式 I I I (式中、A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、および X_1 が、式 I に記載されるとおりである) の化合物と、式 V (式中、 R_7 が式 I に記載されるとおりであり(ただし水素ではない)、 X_{03} が、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基およびメタンスルホニルオキシ基などの脱離基である) の化合物である。反応は、一般に、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサン；トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；アセトニトリルなどのニトリル；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；およびそれらの混合物などの溶媒中において塩基の存在下で行われる。反応に使用される塩基の例としては、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウムなどのアルカリ金属またはアルカリ土類金属水素化物；炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムなどの無機塩基；およびトリエチルアミンなどの有機塩基が挙げられる。中間化合物はまた、式 I V のジスルフィドであり得る。この場合、化合物 V との反応は、一般に、還元剤の存在下で行われる。反応に使用される還元剤の例としては、ヒドロキシメタンスルフィン酸ナトリウム(商標：Rongalite)、または水素化ホウ素ナトリウムが挙げられる。類似の反応が文献に十分に記載されている(例えば国際公開第2013018928号を参照)。式 I a および I c の化合物は、スキーム 1 に記載されているように、式 I (式中、A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、n、および X_1 が、式 I に記載されるとおりであり、mが、0、1、または2である) の化合物へとさらに酸化され得る。式 I (式中、 R_7 が、 $C_1 \sim C_6$ ペルフルオロアルキル基である) の化合物は、

40

50

中間化合物 (I V)、ペルフルオロアルキルヨージドおよび還元剤を反応させることによって生成され得る。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル；トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；アセトニトリルなどのニトリル；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用される還元剤の例としては、テトラキス(ジメチルアミノ)エチレンが挙げられる。反応に使用されるヨウ化ペルフルオロアルキルの例としては、ヨウ化トリフルオロメタン、ヨウ化ペンタフルオロエタン、ヘプタフルオロ-2-ヨードプロパンなどが挙げられる。反応物の反応温度は、一般に、-80 ~ 50 の範囲内である。次に、このように形成された化合物は、スキーム1に記載されているように、酸化により式I(式中、Z₁が、SOまたはSO₂であり、nが、0、1、または2である)の化合物へとさらに変換され得る。

10

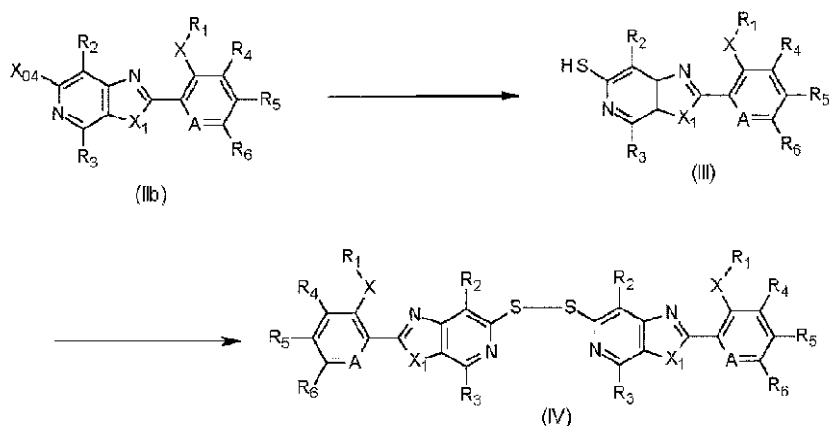
【0028】

式IIIの化合物は、式IIb(式中、A、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、X、およびX₁が、式Iに記載されるとおりであり、X₀₄がハロゲンである)の化合物を硫化剤と反応させることによって生成され得る。化合物(III)のジスルフィドである中間化合物(I V)は、式(III)の化合物を酸化して生成され得る。これは、スキーム4に示される。

【化9】

スキーム4

20



30

【0029】

式IIIの化合物は、化合物(IIb)をチオエステル化剤および触媒と反応させることによって生成され得る。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用されるチオエステル化剤の例としては、硫化ナトリウム、硫化ナトリウム九水和物、およびチオ尿素が挙げられる。反応に使用される触媒の例としては、塩化銅(I)、臭化銅(I)、およびヨウ化銅(I)が挙げられる。反応は、リガンドの存在下で行われ得る。反応に使用されるリガンドの例としては、アセチルアセトン、サレン、フェナントロリンなどが挙げられる。反応は、塩基の存在下で行われ得る。反応に使用される塩基の例としては、炭酸カリウム、炭酸セシウム、およびリン酸三カリウムなどの無機塩基；および有機塩基、例えばトリエチルアミンが挙げられる。中間化合物(I V)は、本発明の化合物(III)を酸化剤と反応させることによって生成され得る。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、水；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル；トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；アセトニトリルなどのニトリル；DMF、NMP、およびDMSO

40

50

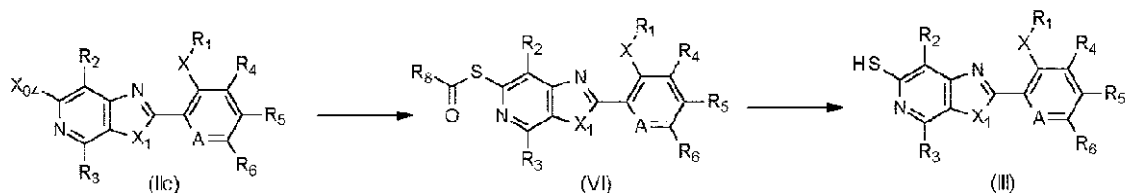
などの非プロトン性極性溶媒；酢酸などのカルボン酸；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用される酸化剤の例としては、酸素、ヨウ素、過酸化水素溶液、フェリシアン化カリウムなどが挙げられる。

【0030】

式IIIの化合物はまた、スキーム5に示されているように、式IIbの本発明の化合物をチオエステル化して、式(VI)の中間化合物を得て、次に、得られた中間化合物(VI)を加水分解することによって生成され得る。

【化10】

スキーム5



【0031】

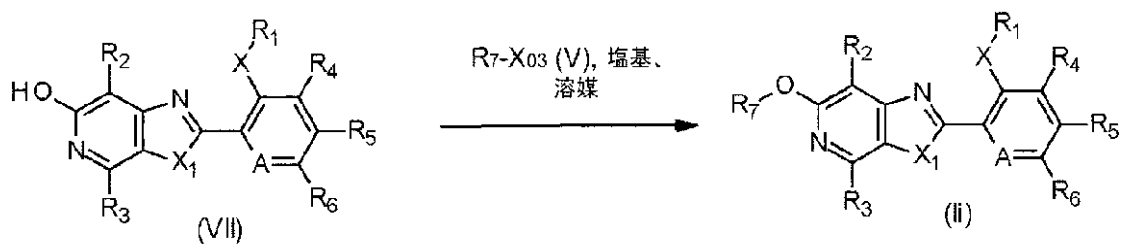
スキーム5において、 R_8 が、式(I)中の R_7 について水素原子以外の基、およびさらにはフェニルのいずれかである。他の記号は、式(I)において定義されるとおりである。中間化合物(VI)は、塩基および触媒の存在下で化合物(IIb)をチオエステル化剤と反応させることによって生成され得る。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用されるチオエステル化剤の例としては、チオ安息香酸などが挙げられる。反応に使用される触媒の例としては、塩化銅(I)、臭化銅(I)、およびヨウ化銅(I)が挙げられる。反応は、リガンドの存在下で行われ得る。反応に使用されるリガンドの例としては、アセチルアセトン、サレン、フェナントロリンなどが挙げられる。反応に使用される塩基の例としては、炭酸カリウム、炭酸セシウム、およびリン酸三カリウムなどの無機塩基；およびトリエチルアミンなどの有機塩基が挙げられる。反応物の反応温度は、一般に、50 ~ 200 の範囲内である。反応において、 X_{04} が、好ましくは、臭素原子およびヨウ素原子である。本発明の化合物(III)は、中間化合物(VI)を加水分解することによって生成され得る。加水分解が酸の存在下で行われる場合、酸の水溶液は、一般に、溶媒として使用される。反応に使用される酸の例としては、塩酸、硝酸、リン酸、および硫酸などの鉱酸；ならびに酢酸およびトリフルオロ酢酸などのカルボン酸が挙げられる。化合物(VI)の加水分解が塩基の存在下で行われる場合、反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；水；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用される塩基の例としては、水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムなどのアルカリ金属水酸化物が挙げられる。

【0032】

式I(式中、 Z_1 が酸素である)の化合物、すなわち、式Iiの化合物は、スキーム6に示されるように調製され得る。

【化 1 1】

スキーム 6.



10

【 0 0 3 3】

したがって、式 V I I (式中、A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、および X_1 が、式 I に記載されるとおりである) の化合物と、式 V (式中、 R_7 が式 I に記載されるとおりであり (ただし、水素ではない)、 X_{03} が、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、トリフルオロメタンスルホニルオキシ基およびメタンスルホニルオキシ基などの脱離基である) の化合物とである。反応は、一般に、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および 1, 4 - ジオキサン; トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素; アセトニトリルなどのニトリル; DMF、NMP、および DMSO などの非プロトン性極性溶媒; およびそれらの混合物などの溶媒中において塩基の存在下で行われる。反応に使用される塩基の例としては、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水素化カルシウムなどのアルカリ金属またはアルカリ土類金属水素化物; 炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウムなどの無機塩基; およびトリエチルアミンなどの有機塩基が挙げられる。式 I i (式中、X が硫黄である) の化合物は、スキーム 1 に記載されているように、式 I (式中、A、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、n、および X_1 が、式 I に記載されるとおりであり、X が、SO または SO_2 であり、n が、0 または 1 である) の化合物へとさらに酸化され得る。

20

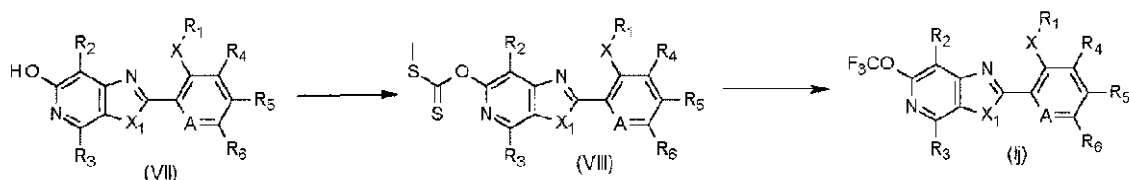
【 0 0 3 4】

式 (I j) (式中、 R_7 が、トリフルオロメチル基である) の化合物は、スキーム 7 に示される方法によって調製され得る。

30

【化 1 2】

スキーム 7



40

【 0 0 3 5】

中間化合物 (V I I I) は、本発明の化合物 (V I I)、塩基、二硫化炭素およびメチル化剤を反応させることによって生成され得る。反応は、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、DMF、NMP、および DMSO などの非プロトン性極性溶媒が挙げられる。反応に使用される塩基の例としては、水素化ナトリウムなどのアルカリ金属水素化物が挙げられる。反応に使用されるメチル化剤の例としては、ヨウ化メチルが挙げられる。反応物の反応温度は、一般に、0 ~ 100 の範囲内である。本発明の化合物 (I j) (式中、 R_7 が、トリフルオロメチル基である) は、塩基の存在下で中間化合物 (V I I I) をフッ素化剤と反応させることによって生成され得る。反応は、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、ジクロロメタン、クロロホ

50

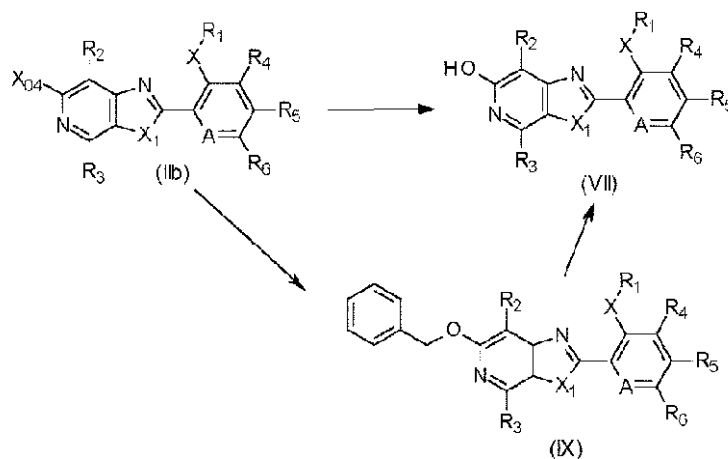
ルム、四塩化炭素、および 1, 2 - ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素が挙げられる。反応は、塩基およびフッ素化剤の存在下で行われる。反応に使用される塩基の例としては、1, 3 - ジブプロモ - 5, 5 - ジメチルヒダントインが挙げられる。反応に使用されるフッ素化剤の例としては、フッ化テトラ - n - ブチルアンモニウム、およびフッ化水素ピリジン錯体が挙げられる。反応物の反応温度は、一般に、 $-80 \sim 50$ の範囲内である。

【0036】

式VIIの化合物は、スキーム8に示されるように中間化合物(IIb)を介して生成され得る。

【化13】

スキーム8.



【0037】

したがって、塩基の存在下で化合物(IIb)をベンジルアルコールと反応させて、式IXの中間化合物を得ることによる、式IIb(式中、X₀₄がハロゲン原子を表し、他の記号が、式(I)において定義されるとおりである)の化合物である。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われ、または溶媒としてベンジルアルコールを使用した。反応に使用される溶媒の例としては、トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；およびそれらの混合物が挙げられる。反応は、触媒の存在下で行われ得る。反応に使用される触媒の例としては、塩化銅(I)、臭化銅(I)、およびヨウ化銅(I)が挙げられる。反応は、リガンドの存在下で行われ得る。反応に使用されるリガンドの例としては、アセチルアセトン、サレン、フェナントロリンなどが挙げられる。反応は、一般に、塩基の存在下で行われる。反応に使用される塩基の例としては、炭酸カリウム、炭酸セシウム、およびリン酸三カリウムなどの無機塩基が挙げられる。式(VII)の化合物は、水素化触媒の存在下で中間化合物(IX)を水素と反応させることによって生成され得る。反応は、一般に、1 ~ 100 気圧の水素雰囲気下において溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert - ブチルメチルエーテル、および1, 4 - ジオキサンなどのエーテル；酢酸エチルおよび酢酸ブチルなどのエステル；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；水；およびそれらの混合物が挙げられる。反応に使用される水素化触媒の例としては、パラジウム炭素、水酸化パラジウム、ラネーニッケル、および酸化白金などの遷移金属化合物が挙げられる。あるいは、式VIIの化合物は、50 ~ 100 の温度における水中での塩基、例えばリン酸三カリウム、およびヨウ化銅(I)などの触媒、およびN, N' - ジメチル - 1, 2 - エチレンジアミンなどのリガンドによる処理により、IIbから直接生成され得る。同様の反応が国際公開第2013018928号およびCatalysis Communications, 12(1),

【 0 0 3 8 】

10

【化 1 4】

スキーム 9



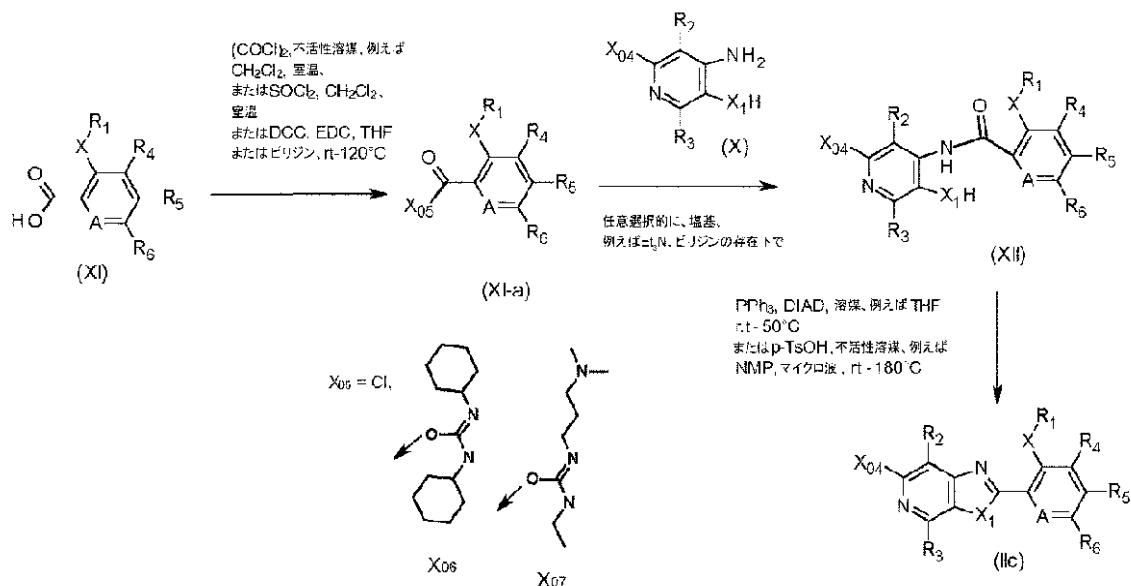
【 0 0 3 9 】

式 I I c の化合物を得るための、式 X の化合物と式 X I の化合物との反応を説明するプロセスは、スキーム 10 により詳細にまとめられている。

30

【化 15】

スキーム 10



10

【0040】

式XI (式中、A、 R_1 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、X、およびAが、式Iに定義される値を有する)の化合物は、例えばTetrahedron, 61(46), 10827-10852, 2005に記載されている当業者に公知の方法により、式XI-aの化合物への活性化される(スキーム10)。例えば化合物(式中、 X_{05} が塩素である)は、20~100、好ましくは、25の温度において、塩化メチレンまたはTHFなどの不活性溶媒中での触媒量のDMFの存在下における、例えば、塩化オキサリルまたは塩化チオニルによる処理によって形成される。任意選択的に、塩基、例えばトリエチルアミンまたはピリジンの存在下での式X (式中、 R_2 、 R_3 および X_1 が、式Iに記載されるとおりであり、 X_{04} がハロゲンである)の化合物によるXI-aの処理により、式XIIの化合物が得られる。あるいは、式XIIcの化合物は、50~180の温度において、任意選択的に、塩基、例えばトリエチルアミンの存在下で、不活性溶媒、例えばピリジン、またはテトラヒドロフラン(THF)中での活性化種XI-a (式中、 X_{05} がそれぞれ X_{06} および X_{07} である)を得るためのジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)または1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDC)による式XIの化合物の処理によって調製され得る。次に、このように得られた式XIIの化合物は、25~180、好ましくは、130~170の温度において、N-メチルピロリドンなどの不活性溶媒中で酸触媒、例えばメタンスルホン酸、またはパラ-トルエンスルホン酸の存在下において、例えば、マイクロ波照射下で化合物を加熱することにより、脱水によって式XIIcの化合物へと転化され得る。このようなプロセスは、国際公開第2010/125985号に既に記載されている。あるいは、式XIIの化合物は、25~50の温度において、THFなどの不活性溶媒中でトリフェニルホスフィン、アゾジカルボン酸ジ-イソプロピルを用いて、式XIIc (式中、 X_1 がOである)の化合物へと転化され得る。このような光延条件は、このような変換について既に記載されている(国際公開第2009/131237号を参照)。

20

30

40

【0041】

式(XI) (式中、A、 R_1 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、およびXが、式Iに記載される値を有し、Aが窒素である)の化合物は、公知であるか、または国際公開第2014132971号、国際公開第2014123205号、国際公開第2014119670号、国際公開第2014119679号、国際公開第2014119674号、国際公開第2014119494号、国際公開第2014119699号、国際公開第2014119672号

50

、国際公開第2014104407号、国際公開第2014021468号、国際公開第2013018928号および米国特許出願公開第20100234603号明細書に記載されている方法によって調製され得る。式(XI)(式中、A、 R_1 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、およびXが、式Iに記載される値を有し、およびAがメチンである)の化合物は、公知であるか、または特開2014024840号公報、特開2014024839号公報、国際公開第2014002754号、国際公開第2013191041号、国際公開第2013191189号、国際公開第2013187424号、国際公開第2013187426号、国際公開第2013187422号、国際公開第2013187423号、国際公開第2013187425号、および国際公開第2012086848号に記載されている方法によって調製され得る。

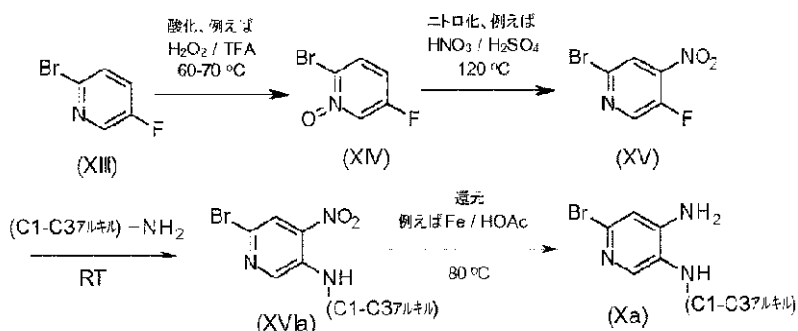
10

【0042】

式(X)の化合物は、例えば、スキーム11に示される方法によって調製され得る。

【化16】

スキーム11.



20

【0043】

スキーム11において、式(XIII)の化合物は、例えばトリフルオロ酢酸などの中の過酸化水素を用いて、当業者に公知の方法によって式XIVの化合物へと酸化される。式XIVの化合物は、例えば“Nitro Compounds, Aromatic” Ullmann's Encyclopedia of Industrial Chemistry, 2005, Wiley-VCH, Weinheimに記載されている方法によってニトロ化され得る。式XVの化合物は、(C₁~C₃アルキル)NH₂による処理によって式XVIaの化合物へと転化され得る。反応は、一般に、THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサン；トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；アセトニトリルなどのニトリル；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；およびそれらの混合物などの溶媒の存在下で行われる。反応物の反応温度は、一般に、-80 ~ 50 の範囲内である。式XVIaの生成物は、例えば酸性媒体中の金属、例えば酢酸または塩酸中のFeを用いて、当業者に公知の方法によって式Xaの化合物へと還元され得る。NO₂基のこのような還元は、例えばOrg. Synth.; Coll. Vol. 5: 346, 1973に記載されている。

30

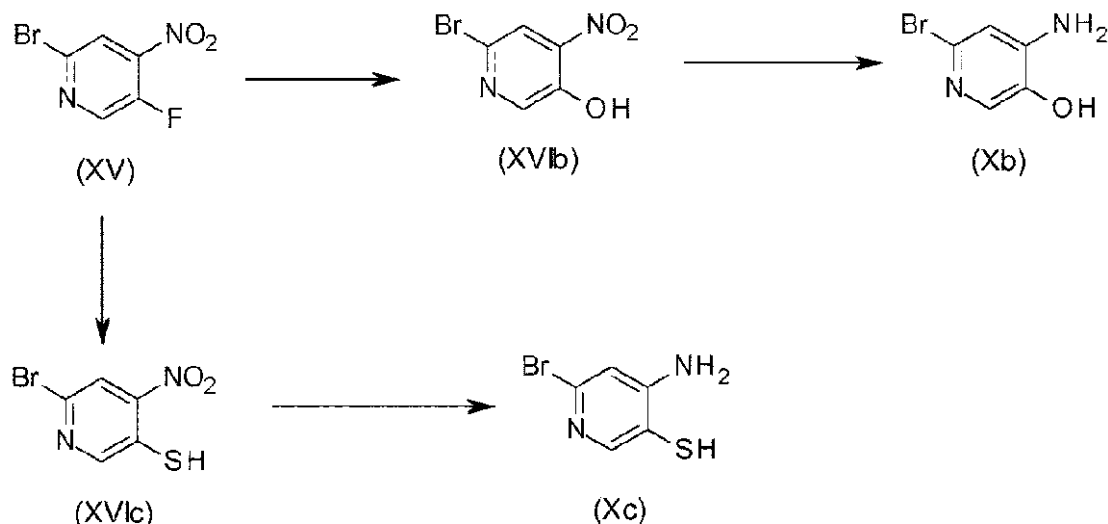
40

【0044】

式X(式中、X₁がOである)の化合物(すなわち、式Xbの化合物)は、50 ~ 100 の温度において、水、NMP、DMF、2-イミダゾリジノン、またはそれらの混合物中の塩基、例えばアルカリ土類金属塩基による処理によって式XVの化合物から生成され得る。スキーム11に記載されている生成されたXVIbの還元により、式Xbの化合物が得られる。同様の反応が国際公開第2010/044411号に記載されている。この化学反応は、スキーム12にまとめられている。

【化 17】

スキーム 12



10

【0045】

式 X (式中、 X_1 が SH である) の化合物 (すなわち、式 Xc の化合物) は、式 XV の化合物を硫化剤と反応させることによって生成され得る。反応に使用される硫化剤の例としては、硫化ナトリウム、硫化ナトリウム九水和物、およびチオ尿素が挙げられる。反応は、塩基の存在下で行われ得る。反応に使用される塩基の例としては、炭酸カリウム、炭酸セシウム、およびリン酸三カリウムなどの無機塩基；および有機塩基、例えばトリエチルアミンが挙げられる。反応は、一般に、溶媒の存在下で行われる。反応に使用される溶媒の例としては、水；メタノールおよびエタノールなどのアルコール；THF、エチレングリコールジメチルエーテル、tert-ブチルメチルエーテル、および1,4-ジオキサンなどのエーテル；トルエンおよびキシレンなどの芳香族炭化水素；アセトニトリルなどのニトリル；DMF、NMP、およびDMSOなどの非プロトン性極性溶媒；酢酸などのカルボン酸；およびそれらの混合物が挙げられる。同様の反応が文献に記載されている (国際公開第2010/055004号を参照)。スキーム11に記載されているような化合物XVIc中のニトロ基の還元により、式Xcの化合物が得られる。この化学反応は、スキーム12にまとめられている。同様に、式VII I (式中、 X_1 がOHである) の化合物は、当業者に公知の条件下で水酸化ナトリウム、または水酸化リチウムなどの水性塩基による処理によって式XVの化合物から調製され得る。次に、得られた化合物XVbのニトロ基は、スキーム11に記載されているように、例えば酢酸または塩酸中のFeを用いて還元されて、式Xbの化合物が得られる。

20

30

【0046】

式Iの定義にしたがって官能化された式(I)の全ての他の化合物を調製するために、多数の好適な公知の標準的な方法、例えばアルキル化、ハロゲン化、アシル化、アミド化、オキシム化、酸化および還元が存在し、好適な調製方法の選択は、中間体における置換基の特性 (反応性) に応じて決まる。

40

【0047】

反応剤は、塩基の存在下で反応され得る。好適な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属ジアルキルアミドまたはアルカリ金属またはアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離またはN-アルキル化飽和または不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウ

50

ムおよび炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウム *tert*-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウムおよび1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

【0048】

10

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

【0049】

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

【0050】

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

20

【0051】

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

【0052】

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

30

【0053】

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

【0054】

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

40

【0055】

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

【0056】

式Iの化合物および必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対および相対配置に応じて、および/または分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば、対掌体および/またはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態で、あるいは鏡像異性体混合物、例えば、ラセミ体、ジアステレオマー混合物またはラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の

50

1つの形態でまたはこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能な全ての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記および下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

【0057】

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

【0058】

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

【0059】

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

【0060】

N-オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で式Iの化合物を、好適な酸化剤、例えば H_2O_2 /尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem. 1989, 32, 2561または国際公開第2000/15615号といった文献から公知である。

【0061】

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

【0062】

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

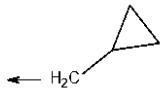
【0063】

以下の表1～20に表される化合物は、上述される方法にしたがって調製され得る。以下に続く例は、本発明を例示し、式Iの好ましい化合物を示すことが意図される。「Ph」は、フェニル基を表す。

【0064】

表X：この表は、表Xの後に開示される式(Iaa)、(Iab)、(Iac)、(Iad)、(Iae)および(Iaf)についての32の置換基の表示X.001～X.032を開示する。表Xにおいて、Etが、 CH_2CH_3 を表し、 CH_2Cy が、

【化 1 8】



(式中、矢印が、硫黄への結合点を示す)
を表す。

【 0 0 6 5 】

【表 1 - 1】

表 X

化合物番号	R ₁	R ₅	R ₇
X.001	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CF ₃
X.002	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CF ₂ CF ₃
X.003	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CF ₃
X.004	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃
X.005	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CF ₃
X.006	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CF ₂ CF ₃
X.007	CH ₂ CH ₃	H	CF ₃
X.008	CH ₂ CH ₃	H	CF ₂ CF ₃
X.009	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₃
X.010	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CH ₃
X.011	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₃
X.012	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
X.013	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CH ₃
X.014	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CH ₂ CH ₃
X.015	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃
X.016	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₃
X.017	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH=CH ₂
X.018	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH=CH ₂

10

20

30

40

【表 1 - 2】

化合物番号	R ₁	R ₅	R ₇
X.019	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CH=CH ₂
X.020	CH ₂ CH ₃	H	CH=CH ₂
X.021	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CHF ₂
X.022	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CHF ₂
X.023	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CH ₂ CHF ₂
X.024	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CHF ₂
X.025	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CF ₃
X.026	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CF ₃
X.027	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CH ₂ CF ₃
X.028	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CF ₃
X.029	CH ₂ CH ₃	CF ₃	CH ₂ CN
X.030	CH ₂ CH ₃	CF ₂ CF ₃	CH ₂ CN
X.031	CH ₂ CH ₃	OCHF ₂	CH ₂ CN
X.032	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CN

10

20

30

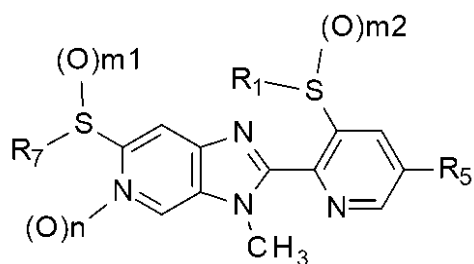
40

【 0 0 6 6 】

表 1 :

この表は、式 (I a a) :

【化 19】

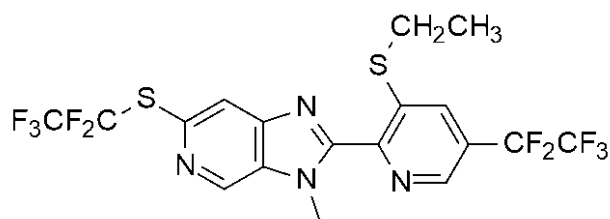


(1aa)

10

(式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 0 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 001 ~ X . 032 に定義されるとおりである)
 の 32 種の化合物 1 . 001 ~ 1 . 032 を開示する。例えば、化合物 1 . 004 は、以下の構造：

【化 20】



(1.004)

20

を有する。

【0067】

表 2：

この表は、式 (Iaa) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 001 ~ X . 032 に定義されるとおりである) の 32 種の化合物 2 . 001 ~ 2 . 032 を開示する。

【0068】

30

表 3：

この表は、式 (Iaa) (式中、 n が 1 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 001 ~ X . 032 に定義されるとおりである) の 32 種の化合物 3 . 001 ~ 3 . 032 を開示する。

【0069】

表 4：

この表は、式 (Iaa) (式中、 n が 1 であり、 m_1 が 1 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 001 ~ X . 032 に定義されるとおりである) の 32 種の化合物 4 . 001 ~ 4 . 032 を開示する。

【0070】

40

表 5：

この表は、式 (Iaa) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 2 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 001 ~ X . 032 に定義されるとおりである) の 32 種の化合物 5 . 001 ~ 5 . 032 を開示する。

【0071】

表 6：

この表は、式 (Iaa) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 1 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 001 ~ X . 032 に定義されるとおりである) の 32 種の化合物 6 . 001 ~ 6 . 032 を開示する。

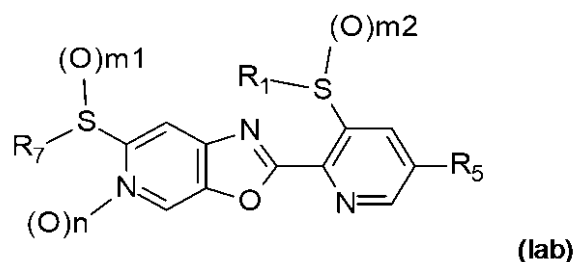
【0072】

50

表 7 :

この表は、式 (I a b) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 0 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 7 . 0 0 1 ~ 7 . 0 3 2 を開示する。

【化 2 1】



10

【 0 0 7 3 】

表 8 :

この表は、式 (I a b) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 8 . 0 0 1 ~ 8 . 0 3 2 を開示する。

【 0 0 7 4 】

表 9 :

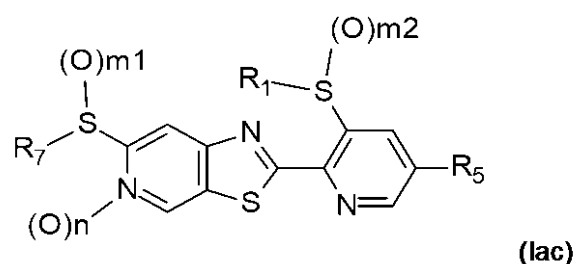
この表は、式 (I a b) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 2 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 9 . 0 0 1 ~ 9 . 0 3 2 を開示する。

【 0 0 7 5 】

表 1 0 :

この表は、式 (I a c) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 0 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 0 . 0 0 1 ~ 1 0 . 0 3 2 を開示する。

【化 2 2】



30

【 0 0 7 6 】

表 1 1 :

この表は、式 (I a c) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 1 . 0 0 1 ~ 1 1 . 0 3 2 を開示する。

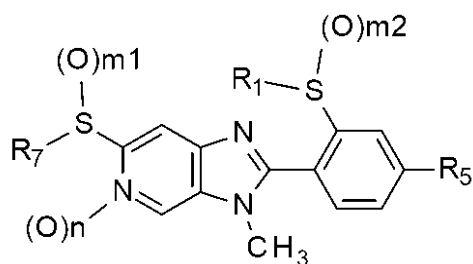
【 0 0 7 7 】

表 1 2 :

この表は、式 (I a d) :

40

【化 2 3】



(lad)

10

(式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 0 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 2 . 0 0 1 ~ 1 2 . 0 3 2 を開示する。

【0078】

表 1 3 :

この表は、式 (I a d) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 3 . 0 0 1 ~ 1 3 . 0 3 2 を開示する。

【0079】

表 1 4 :

この表は、式 (I a d) (式中、 n が 1 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 4 . 0 0 1 ~ 1 4 . 0 3 2 を開示する。

【0080】

表 1 5 :

この表は、式 (I a d) (式中、 n が 1 であり、 m_1 が 1 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 5 . 0 0 1 ~ 1 5 . 0 3 2 を開示する。

【0081】

表 1 6 :

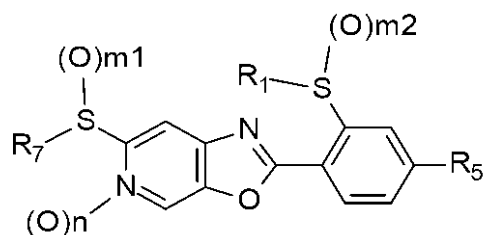
この表は、式 (I a d) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 2 であり、 m_2 が 2 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 6 . 0 0 1 ~ 1 6 . 0 3 2 を開示する。

【0082】

表 1 7 :

この表は、式 (I a e) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 0 であり、 R_1 、 R_5 、および R_7 が、表 X 中の行 X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2 に定義されるとおりである) の 3 2 種の化合物 1 7 . 0 0 1 ~ 1 7 . 0 3 2 を開示する。

【化 2 4】



(lae)

40

【0083】

表 1 8 :

この表は、式 (I a e) (式中、 n が 0 であり、 m_1 が 0 であり、 m_2 が 2 であり、 R

50

₁、R₅、およびR₇が、表X中の行X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2に定義されるとおりである)の32種の化合物18 . 0 0 1 ~ 18 . 0 3 2を開示する。

【0084】

表19:

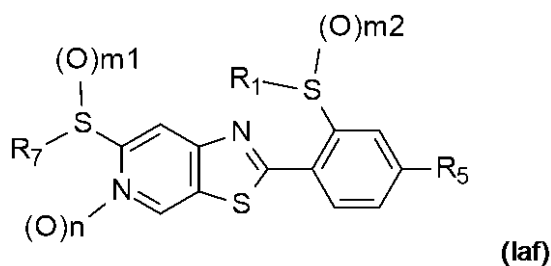
この表は、式(Iae)(式中、nが0であり、m₁が2であり、m₂が2であり、R₁、R₅、およびR₇が、表X中の行X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2に定義されるとおりである)の32種の化合物19 . 0 0 1 ~ 19 . 0 3 2を開示する。

【0085】

表20:

この表は、式(Iaf)(式中、nが0であり、m₁が0であり、m₂が0であり、R₁、R₅、およびR₇が、表X中の行X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2に定義されるとおりである)の32種の化合物20 . 0 0 1 ~ 20 . 0 3 2を開示する。

【化25】



【0086】

表21:

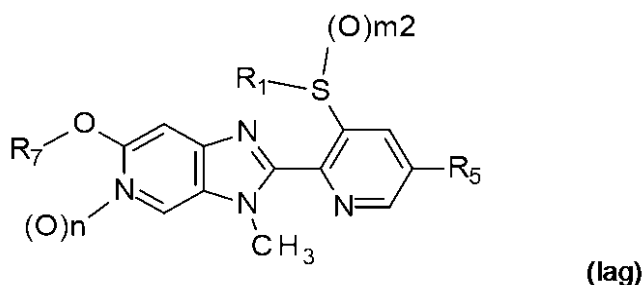
この表は、式(Iaf)(式中、nが0であり、m₁が0であり、m₂が2であり、R₁、R₅、およびR₇が、表X中の行X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2に定義されるとおりである)の32種の化合物21 . 0 0 1 ~ 21 . 0 3 2を開示する。

【0087】

表22:

この表は、式(Iag):

【化26】



(式中、nが0であり、m₂が0であり、R₁、R₅、およびR₇が、表X中の行X . 0 0 1 ~ X . 0 3 2に定義されるとおりである)の32種の化合物22 . 0 0 1 ~ 22 . 0 3 2を開示する。例えば、化合物22 . 0 2 5は、以下の構造:

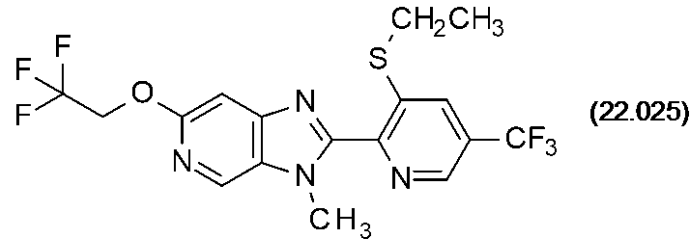
10

20

30

40

【化 27】



を有する。

10

【0088】

表 23 :

この表は、式 (Iaa) (式中、n が 0 であり、m2 が 2 であり、R₁、R₅、および R₇ が、表 X 中の行 X、001 ~ X、032 に定義されるとおりである) の 32 種の化合物 23、001 ~ 123、032 を開示する。

【0089】

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

20

【0090】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

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

30

40

シラミ目 (Anoplura) から、例えば、ブタジラミ属 (Haematopinus

50

s spp.）、リノグナツス属 (*Linognathus* spp.)、ペディクルス属 (*Pediculus* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.) およびフィロキセラ属 (*Phylloxera* spp.)；

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

双翅目 (*Diptera*) から、例えば、ヤブカ属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、アンテリゴナ・ソカタ (*Antherigona soccata*)、オリーブミバエ (*Bactrocea oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属 (*Bradysia* spp.)、クロバエ (*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属 (*Ceratitis* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、クテブレラ属 (*Cuterebra* spp.)、ダクス属 (*Dacus* spp.)、デリア属 (*Delia* spp.)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイェバエ属 (*Fannia* spp.)、ガストロフィラス属 (*Gastrophilus* spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツェツェバエ属 (*Glossina* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属 (*Hyppobosca* spp.)、リリオミザ属 (*Lir*

10

20

30

40

50

iomyza spp.）、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属 (*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、オルセオリア属 (*Orseolia* spp.)、キモグリバエ (*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ (*Pegomya hyoscyami*)、ホルビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivellia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) およびガガンボ属 (*Tipula* spp.) ;

10

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

20

30

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

40

50

、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属 (*Cacopsylla* spp.)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavarrella aegopodii* Scop.)、セロブラスタ属 (*Ceroplaster* spp.)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidi* um)、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyospe* rmi)、シカデラ属 (*Cicadella* spp.)、シロオオヨコバイ (*Cofan* a spectra)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp.)、シカデ ユリナ属 (*Cicadulina* spp.)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、
 ジアレウロデス属 (*Dialeurodes* spp.)、ミカンキジラミ (*Diapho* 10
rina citri)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*Dysaphis* spp.)、エンポアスカ属 (*Empoasca* spp.)、リンゴワタムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ 属 (*Erythroneura* spp.)、ガスカルジア属 (*Gascardia* spp.)、グリカスピス・ブリンブレコンベイ (*Glycaspis brimblec* ombei)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudo* brassicae)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus* spp.)、ヒペロ ミズス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨ コバイ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jac* 20
obiasca lybica)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax* spp.)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes* spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi*)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロ シフム属 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva* spp.)、メタカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギ ウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、ネオトキシ プテラ属 (*Neotoxoptera* sp.)、ツマグロヨコバイ属 (*Nephote* ttix spp.)、ニラバルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミ ドリオアブラムシ (*Nippolachnus piri* Mats.)、オドナスピス 30
・ルタエ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Ore* gma lanigera Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (*Parabem isia myrica*e)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrioza co* ckerelli)、パルラトリア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグ ス属 (*Pemphigus* spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus* maidis)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella* spp.)、ホップイボ アブラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxer* a spp.)、プラノコッカス属 (*Planococcus* spp.)、シュウダウラ カスピス属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、シュードコッカス属 (*Ps* 40
eudococcus spp.)、ワタノミハムシ (*Pseudatomosceli* s seriatus)、ブシラ属 (*Psylla* spp.)、ブルビナリア・エチオ ピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズピジオツス属 (*Qu* adraspidiotus spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gig* as)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*R* hopalosiphum spp.)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、スカホイデウス属 (*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属 (*Sch* izaphis spp.)、シトピオン属 (*Sitobion* spp.)、セジロウ ンカ (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*S* pissistilus festinus)、タロファガス・プロセルピナ (*Taro* phagus Proserpina)、トキシプテラ属 (*Toxoptera* spp) 50

)、トリアレウロデス属 (*Trialeurodes* spp)、トリジスカス・スボロボリ (*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus* spp)、ミカントガリキジラミ (*Triozia erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginidia scutellaris*) ;

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

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

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

10

20

30

40

50

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

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

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

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

ノミ目(Siphonaptera)から、例えば、ナガノミ属(Ceratophyllus spp.)、イヌノミ属(Ctenocephalides spp.)およびケオブスネズミノミ(Xenopsylla cheopis);

10

20

30

40

50

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

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

10

【0091】

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

【0092】

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

20

30

【0093】

本発明の組成物および/または方法は、花、低木、広葉樹および常緑樹を含む、任意の観賞植物および/または野菜作物にも使用され得る。

【0094】

例えば、本発明は、以下の観賞植物種のいずれかに使用され得る：カッコウアザミ属 (Ageratum spp.)、アロンソア属 (Alonsoa spp.)、イチリンソウ属 (Anemone spp.)、アニソドンテア・カペンシス (Anisodonteia capensis)、アンセミス属 (Anthemis spp.)、キンギョソウ属 (Antirrhinum spp.)、シオン属 (Aster spp.)、ペゴニア属 (Begonia spp.) (例えば、エラチオールペゴニア (Belatior)、シキザキペゴニア (B. semperflorens)、B. チュベレウクス (B. tubereux))、ブーゲンビリア属 (Bougainvillea spp.)、ブラキスコメ属 (Brachycome spp.)、アブラナ属 (Brassica spp.) (観賞植物)、カルセオラリア属 (Calceolaria spp.)、トウガラシ (Capsicum annuum)、ニチニチソウ (Catharanthus roseus)、カンナ属 (Canna spp.)、ヤグルマギク属 (Centaurea spp.)、キク属 (Chrysanthemum spp.)、シネリア属 (Cineraria spp.) (シロタエギク (C. maritime))、ハルシャギク属 (Coreopsis spp.)、クラッスラ・コッキネア (Crassula coccinea)、クフエア・イグネア (Cuphea ignea

40

50

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

【0095】

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

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

【0096】

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

【0097】

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

【0098】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫 (内部寄生性、半内部寄生性および外部寄生性線虫)、特にネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ (*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ (*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ (*Meloidogyne arenaria*) および他

10

20

30

40

50

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

フィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫；ならびにスバンギナ属 (*Subanguina* spp.)、ヒプソペリン属 (*Hypsoperine* spp.)、マクロポストニア属 (*Macroposthonia* spp.)、メリニウス属 (*Melinius* spp.)、プンクトデラ属 (*Punctodera* spp.)、およびキニスルシウス属 (*Quinisulcius* spp.) などの他の植物寄生性線虫種による植物および植物の部分への被害を防除する方法にも関する。

【0099】

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

【0100】

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

【0101】

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

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

10

【0102】

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

20

【0103】

このような毒素またはこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0374753号明細書、国際公開第93/07278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0427529号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書および国際公開第03/052073号に開示されている。

【0104】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。Cry I型のデオキシリボ核酸およびそれらの調製が、例えば、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第0367474号明細書、欧州特許出願公開第0401979号明細書および国際公開第90/13651号から公知である。

30

【0105】

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

40

【0106】

殺虫剤耐性（insecticidal resistance）をコードし、1つまたは複数の毒素を発現する1つまたは複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかは市販されている。このような植物の例は、YieldGard（登録商標）（Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Rootworm（登録商標）（Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；YieldGard Plus（登録商標）（Cry1AbおよびCry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種）；Starlink（登録商標）（Cry9C毒素を発現するトウモロコシ品種）；Herculex I（登録商標）（Cry1Fa2毒素、および除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るための酵素ホスフィノトリシン

50

N - アセチルトランスフェラーゼ (PAT) を発現するトウモロコシ品種) ; NuCOT N 33B (登録商標) (Cry1Ac毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard I (登録商標) (Cry1Ac毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard II (登録商標) (Cry1AcおよびCry2Ab毒素を発現するワタ品種) ; VipCot (登録商標) (Vip3AおよびCry1Ab毒素を発現するワタ品種) ; NewLeaf (登録商標) (Cry3A毒素を発現するジャガイモ品種) ; NatureGard (登録商標) ; Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホサート耐性形質) ; Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11アワノメイガ (CB) 形質) および Protecta (登録商標) である。

【0107】

10

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は以下のとおりである：

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

【0108】

20

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

【0109】

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

30

【0110】

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

40

【0111】

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

【0112】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C / NL / 00 / 10。特定の鱗翅目 (Lepidoptera) 昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1Fおよび除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロ

50

コシ。

【0113】

7. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium) 製のNK603 × MON 810 トウモロコシ、登録番号C / GB / 02 / M3 / 03。遺伝子組み換え品種NK603およびMON 810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ品種からなる。NK603 × MON 810 トウモロコシは、除草剤Roundup (登録商標) (グリホサートを含む) に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属 (*Agrobacterium* sp.) 菌株CP4 から得られるタンパク質CP4 EPSPS、およびヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目 (*Lepidoptera*) に対する耐性をもたらし、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

10

【0114】

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

【0115】

「作物」という用語は、例えば、いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照) などの選択的作用を有する抗病原性物質 (*antipathogenic substance*) を合成することができるように、組み換えDNA技術の使用によって形質転換された作物も含むことが理解されるべきである。このような抗病原性物質およびこのような抗病原性物質を合成することが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書、国際公開第95 / 33818号および欧州特許出願公開第0353191号明細書から公知である。このようなトランスジェニック植物を産生する方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。

20

【0116】

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

30

【0117】

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

【0118】

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

40

【0119】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る抗病原性物質としては、例えば、ナトリウムチャンネルまたはカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、例えばウイルス性KP1、KP4またはKP6毒素; スチルベンシンターゼ; ビベンジルシンターゼ; キチナーゼ; グルカナーゼ; いわゆる「病原性関連タンパク質」(PRP; 例えば、欧州特許出願公開第0392225号明細書を参照); 微生物によって産生される抗病原性物質、例えばペプチド抗生物質または複素環式抗生物質 (例えば、国際公開第95 / 33818号を参照) または植物病原体防御に関与するタンパク質またはポリペ

50

プチド因子（国際公開第03/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」）が挙げられる。

【0120】

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

【0121】

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

【0122】

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

【0123】

処理されるべき不織布、布帛または網を含む基材は、綿、ラフィア、ジュート、亜麻、サイザル、麻布もしくは羊毛などの天然繊維、またはポリアミド、ポリエステル、ポリプロピレン、ポリアクリロニトリルなどの合成繊維で作製され得る。ポリエステルが特に好適である。織物処理の方法は、例えば、国際公開第2008/151984号、国際公開第2003/034823号、米国特許第5631072号明細書、国際公開第2005/64072号、国際公開第2006/128870号、欧州特許第1724392号明細書、国際公開第2005113886号または国際公開第2007/090739号から公知である。

【0124】

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

【0125】

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

【0126】

表A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

10

20

30

40

【表 2】

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

10

【 0 1 2 7 】

表 B . 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

【表 3 - 1】

科	種	寄生される宿主または作物
タ マ ム シ 科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>)	カバノキ
	アグリルス・ポリツス(<i>Agrilus politus</i>)	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ(<i>Agrilus sayi</i>)	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス (<i>Agrilus vittaticollis</i>)	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリー、サービスベリー、サンザシ
	クリンボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカエデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニレ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウトチノキ、リンデン、カエデ、ナナカマド、オーク、ペカン、セイヨウナシ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マルメロ、アメリカハナズオウ、サービスベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤナギ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	テキサニア・カンペストリス (<i>Texania campestris</i>)	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ
	ゴエス・プルベルレンツス(<i>Goes pulverulentus</i>)	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤナギ、クロガシワ、アメリカキレハガシワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、スズカケノキ

10

20

30

40

【表 3 - 2】

科	種	寄生される宿主または作物
	ゴエス・チグリヌス(<i>Goes tigrinus</i>)	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス(<i>Neoclytus acuminatus</i>)	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オーク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、イースタンホップホーンビーム(Eastern hophornbeam)、ハナミズキ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリカサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカハリグワ、サッサfras、ライラック、マウンテン・マホガニー、セイヨウナシ、サクラランボ、プラム、モモ、リンゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ
	ネオプチコデス・トリリネツス(<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、ネットリーフハックベリー(Nettleleaf hackberry)
	オベレア・オセラータ(<i>Oberea ocellata</i>)	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイヨウナシ、スグリ、ブラックベリー(Blackberry)
	オベレア・トリプンクタータ(<i>Oberea tripunctata</i>)	ハナミズキ、ガマズミ属(Viburnum)、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ
	オンシデレス・シングラータ(<i>Oncideres cingulata</i>)	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、

10

20

30

40

【表 3 - 3】

科	種	寄生される宿主または作物
		アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属(<i>Eucalyptus</i>)、オーク、エノキ、カエデ、果樹
	サペルダ・カルカラタ(<i>Saperda calcarata</i>)	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス(<i>Strophiona nitens</i>)	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コロンビアンヌス(<i>Corthylus columbianus</i>)	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス(<i>Dendroctonus frontalis</i>)	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ(<i>Dryocoetes betulae</i>)	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム(<i>Monarthrum fasciatum</i>)	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリブス・リミナリス(<i>Phloeotribus liminaris</i>)	モモ、サクランボ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プルイノス(<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>)	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム(<i>Chickasaw plum</i>)、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ

10

20

30

40

【表 3 - 4】

科	種	寄生される宿主または作物
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランズ (<i>Paranthrene simulans</i>)	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス (<i>Sannina uroceriformis</i>)	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ (<i>Synanthedon exitiosa</i>)	モモ、プラム、ネクタリン、サ クランボ、アンズ、アーモン ド、アメリカザクラ
	シナンテドン・ピクチペス (<i>Synanthedon pictipes</i>)	モモ、プラム、サクランボ、ブ ナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシ ア(<i>Synanthedon rubrofascia</i>)	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>)	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリ ー、オーク、クリ、ブナ、カバ ノキ、アメリカザクラ、ニレ、 ナナカマド、ガマズミ属 (<i>Viburnum</i>)、ヤナギ、リンゴ、 ビワ、アメリカテマリシモツ ケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリスチフォルミス (<i>Vitacea polistiformis</i>)	ブドウ

【0128】

本発明はまた、例えば甲虫、イモムシ、ヒアリ、ワタフキカイガラムシ (ground
pearl)、ヤスデ、ダンゴムシ、ダニ、ケラ、カイガラムシ、コナカイガラムシ、
マダニ、アワフキムシ、サウザンキンクバグ (southern chinch bu
g) および地虫を含む、芝草中に存在し得る任意の昆虫有害生物を防除するのに使用され
得る。本発明は、卵、幼虫、若虫および成虫を含む、生活環の様々な段階の昆虫有害生物
を防除するのに使用され得る。

【0129】

特に、本発明は、地虫 (コガネカブト属 (*Cyclocephala* spp.)) (例
えば、マスクドコガネムシ (masked chafer)、C. ルリダ (*C. lurida*))、リゾトログス属 (*Rhizotrogus* spp.)) (例えば、ヨーロピア

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

10

【0130】

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

20

【0131】

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

30

【0132】

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

40

【0133】

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

【0134】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目 (*Anoplurida*) のうち：ブタジラミ属 (*Haematopinus* spp.)、ホソジラミ属 (*Linognathus* spp.)、ペディクルス属 (*Pediculus* spp.) およびケジラミ属 (*Phthirus* spp.)、ソレ

50

ノボテス属 (*Solenopotes* spp.)。

【0135】

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

【0136】

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

【0137】

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

【0138】

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

【0139】

ゴキブリ目 (*Blattarida*) のうち、例えば、トウヨウゴキブリ (*Blattorientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattellagermanica*) およびスベラ属 (*Supella* spp.)。

【0140】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) ならびにマダニ亜目 (*Metastigmata*) および中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えば、ナガヒメダニ属 (*Argas* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)

10

20

30

40

50

p.)), キラマダニ属 (*Amblyomma* spp.)), ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)), カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)), チマダニ属 (*Haemophysalis* spp.)), イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)), コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)), デルマニス属 (*Dermanyssus* spp.)), ライリエチア属 (*Raillietia* spp.)), ニューモニス属 (*Pneumonyssus* spp.)), ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.)), およびバロア属 (*Varroa* spp.)),

【0141】

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

【0142】

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

【0143】

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

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

10

【0144】

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

20

【0145】

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

30

【0146】

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

40

【0147】

本発明に係る組成物の調製に好適な製剤化補助剤はそれ自体公知である。液体担体として、以下のものが使用され得る：水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェ

50

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

【 0 1 4 8 】

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

【 0 1 4 9 】

多くの表面活性物質が、固体および液体製剤の両方中、特に使用前に担体で希釈され得る製剤中で有利に使用され得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、非イオン性またはポリマーであってもよく、それらは、乳化剤、湿潤剤または懸濁化剤としてまたは他の目的のために使用され得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ラウリル硫酸ジエタノールアンモニウムなどの硫酸アルキルの塩；ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムなどのアルキルアリアルスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレートなどのアルキルフェノール / アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエトキシレートなどのアルコール / アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウムなどの石けん；ナトリウムジブチルナフタレンスルホネートなどのアルキルナフタレンスルホネートの塩；ナトリウムジ (2 - エチルヘキシル) スルホスクシネートなどのスルホコハク酸塩のジアルキルエステル；オレイン酸ソルビトールなどのソルビトールエステル；ラウリルトリメチルアンモニウムクロリドなどの第四級アミン、ポリエチレングリコールステアレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシドおよびプロピレンオキシドのブロックコポリマー；ならびにモノ - およびジ - アルキルリン酸エステルの塩；ならびにさらに例えば M c C u t c h e o n ' s D e t e r g e n t s a n d E m u l s i f i e r s A n n u a l, M C P u b l i s h i n g C o r p., R i d g e w o o d N e w J e r s e y (1 9 8 1) に記載されているさらなる物質が挙げられる。

【0150】

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

【0151】

本発明に係る組成物は、植物もしくは動物由来の油、鉱油、このような油のアルキルエステルまたはこのような油と油誘導体との混合物を含む添加剤を含み得る。本発明に係る組成物中の油添加剤の量は、一般に、施用される混合物を基準にして、0.01~10%である。例えば、油添加剤は、スプレー混合物が調製された後、所望の濃度でスプレータンクに加えられ得る。好ましい油添加剤は、鉱油または植物由来の油、例えばナタネ油、オリーブ油もしくはヒマワリ油、乳化植物油、植物由来の油のアルキルエステル、例えばメチル誘導体、または魚油もしくは牛脂などの動物由来の油を含む。好ましい油添加剤は、 $C_8 \sim C_{22}$ 脂肪酸のアルキルエステル、特に $C_{12} \sim C_{18}$ 脂肪酸のメチル誘導体、例えばラウリン酸、パルミチン酸およびオレイン酸のメチルエステル（それぞれ、ラウリン酸メチル、パルミチン酸メチルおよびオレイン酸メチル）を含む。多くの油誘導体が、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

【0152】

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

【0153】

施用量は、広い範囲内で変化し、土壌の性質、施用方法、作物植物、防除される有害生物、そのときの気候条件、ならびに施用方法、施用の時期および標的作物に左右される他の要因に応じて決まる。一般的な指針として、化合物は、1~2000l/ha、特に10~1000l/haの割合で施用され得る。

【0154】

好ましい製剤は、以下の組成を有し得る（重量%）。

【0155】

乳剤：

活性成分：1~95%、好ましくは60~90%

表面活性剤：1~30%、好ましくは5~20%

液体担体：1~80%、好ましくは1~35%

【0156】

ダスト剤：

活性成分：0.1~10%、好ましくは0.1~5%

固体担体：99.9~90%、好ましくは99.9~99%

【0157】

懸濁濃縮物：

活性成分：5~75%、好ましくは10~50%

水：94~24%、好ましくは88~30%

表面活性剤：1~40%、好ましくは2~30%

【0158】

水和剤：

活性成分：0.5~90%、好ましくは1~80%

表面活性剤：0.5~20%、好ましくは1~15%

固体担体：5～95%、好ましくは15～90%

【0159】

粒剤：

活性成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体担体：99.5～70%、好ましくは97～85%

【0160】

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

【0161】

【表4】

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

10

20

【0162】

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

【0163】

【表5】

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

30

【0164】

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

【0165】

【表6】

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

40

【0166】

50

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

【 0 1 6 7 】

【表 7】

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

10

【 0 1 6 8 】

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

【 0 1 6 9 】

【表 8】

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

20

【 0 1 7 0 】

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

【 0 1 7 1 】

【表 9】

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

30

【 0 1 7 2 】

この微粉化された組合せは、ミキサー中でポリエチレングリコールで濡らされたカオリンに均一に適用される。このように、ほこりのない被覆粒剤が得られる。

【 0 1 7 3 】

【表 10】

懸濁濃縮物

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

40

【 0 1 7 4 】

50

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

【 0 1 7 5 】

【表 1 1】

種子処理用のフロアブル濃縮物

活性成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノールPO/EO	2 %
10~20モルのEOを含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中20%の溶液の形態)	0.5 %
モノアゾ顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

10

【 0 1 7 6 】

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

20

【 0 1 7 7 】

持続放出性カプセル懸濁剤

28部のこの組合せを、2部の芳香族溶媒および7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート-混合物(8:1)と混合する。この混合物を、所望の粒度が得られるまで、1.2部のポリビニルアルコールと、0.05部の消泡剤と、51.6部の水との混合物中で乳化する。この乳剤に5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を加える。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られたカプセル懸濁剤を、0.25部の増粘剤および3部の分散剤を加えることによって安定化させる。カプセル懸濁剤製剤は、28%の活性成分を含有する。カプセルの中間直径は8~15 μmである。得られた製剤を、該当する目的に好適な装置中の水性懸濁液として種子に施用する。

30

【 0 1 7 8 】

製剤のタイプとしては、乳剤濃縮物(EC)、懸濁濃縮物(SC)、サスポエマルジョン(SE)、カプセル懸濁剤(CS)、水和性粒剤(WG)、乳化性粒剤(EG)、油中水乳剤(EO)、水中油乳剤(EW)、マイクロエマルジョン(ME)、油性分散液(OD)、油混和性フロアブル剤(OF)、油混和性液体(OL)、可溶性濃縮物(SL)、微量散布用懸濁剤(ultra-low volume suspension)(SU)、微量散布用液剤(ultra-low volume liquid)(UL)、工業用濃縮物(technical concentrate)(TK)、分散性濃縮物(DC)、水和剤(WP)、可溶性粒剤(SG)または農学的に許容できる補助剤と組み合わされた任意の技術的に実現可能な製剤が挙げられる。

40

【実施例】

【 0 1 7 9 】

調製実施例：

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

【 0 1 8 0 】

LCMS方法：

50

方法 1 :

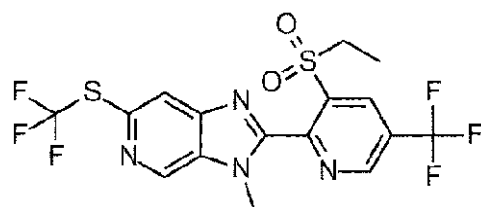
エレクトロスプレー源（極性：正イオンまたは負イオン、キャピラリー：3.00 kV、コーン範囲：30～60 V、抽出装置：2.00 V、イオン源温度：150、脱溶媒和温度：350、コーンガス流：0 L/時、脱溶媒和ガス流：650 L/時、質量範囲：100～900 Da）を備えた Waters 製の質量分析計（SQD、SQD II または ZQ シングル四重極質量分析計）および Waters 製の Acquity UPLC：バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置でスペクトルを記録した。溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイ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

【0181】

調製実施例：

実施例 P1：2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン（化合物 P10、表 P）：

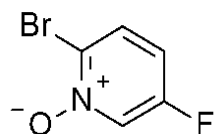
【化28】



(化合物P10)

工程 A：2-ブロモ-5-フルオロ-1-オキシド-ピリジン-1-イウム：

【化29】

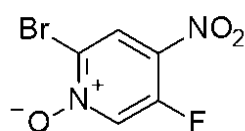


TFA（10.0 mL）中の 2-ブロモ-5-フルオロピリジン（5.0 g、28.4 mmol）の攪拌溶液に H₂O₂（30%、15 mL）を 0 で滴下して加え、混合物を一晚にわたり還流状態で攪拌した。冷却した後、反応系を氷水に注ぎ、ジクロロメタン/メタノール（10：1、50 mL×3）で抽出し、有機層を飽和炭酸水素ナトリウム溶液および塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。ろ過および減圧下での濃縮後、粗生成物をさらに精製せずに次の工程に使用した。

【0182】

工程 B：2-ブロモ-5-フルオロ-4-ニトロ-1-オキシド-ピリジン-1-イウム：

【化30】



10

20

30

40

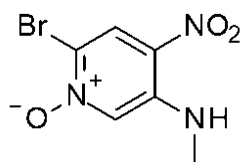
50

(濃)硫酸(20 mL)中の2-ブロモ-5-フルオロ-1-オキシド-ピリジン-1-イウム(4.6 g、23.9 mmol)の溶液に発煙硝酸(10 mL)を0 でゆっくりと加えた。添加後、反応温度を120 に上昇させ、攪拌をこの温度で4時間続けた。室温に冷ました後、反応溶液を氷水に注いだ。pH値をNH₄OHで1に調整した。沈殿物をろ過し、オープン乾燥させたところ、表題化合物が淡黄色の固体として得られた。

【0183】

工程C：6-ブロモ-N-メチル-4-ニトロ-1-オキシド-ピリジン-1-イウム-3-アミン：

【化31】



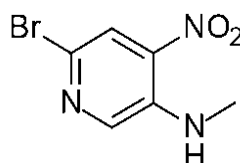
10

エタノール(10 mL)中の2-ブロモ-5-フルオロ-4-ニトロ-1-オキシド-ピリジン-1-イウム(1.1 g、4.6 mmol)の溶液にMeNH₂/エタノール(4 mL)を加えた。反応混合物を室温で4時間攪拌した。混合物を減圧下で濃縮したところ、表題化合物が固体として得られ、それをさらに精製せずに次の工程に使用した。

【0184】

工程D：6-ブロモ-N-メチル-4-ニトロ-ピリジン-3-アミン：

【化32】



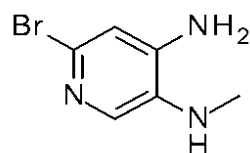
20

ジクロロメタン(10 mL)中の6-ブロモ-N-メチル-4-ニトロ-1-オキシド-ピリジン-1-イウム-3-アミン(上記からの粗生成物、4.6 mmol)の溶液にPBr₃(1.0 mL)を加えた。反応混合物を周囲温度で1時間攪拌した。混合物を減圧下で乾燥させたところ、表題化合物が赤みのあるオレンジ色の(jacinth)固体として得られ、それをさらに精製せずに次の工程に使用した。

【0185】

工程E：6-ブロモ-N3-メチル-ピリジン-3,4-ジアミン：

【化33】



30

メタノール(10 mL)中の6-ブロモ-N-メチル-4-ニトロ-ピリジン-3-アミン(粗生成物、4.6 mmol)の溶液にラネーNi(20重量%)を加え、ヒドラジン水和物(1.0 mL)を0 で滴下して加えた。反応混合物を室温で数分間攪拌した。ラネーNiをセライトに通してろ去し；ろ液を減圧下で乾燥させ、シリカゲル上のクロマトグラフィーカラム(ジクロロメタン：メタノール、10：1)で精製したところ、表題化合物が藤色の固体として得られた。融点156~158。

LCMS(標準方法1)：0.61 min、202/204(M+H)。¹H NMR(400 MHz、DMSO-d₆)：(ppm) 7.20(s, 1H)、6.65(s, 1H)、6.54(brs, 2H)、3.34(s, 1H)、2.69(d, J = 6.4

40

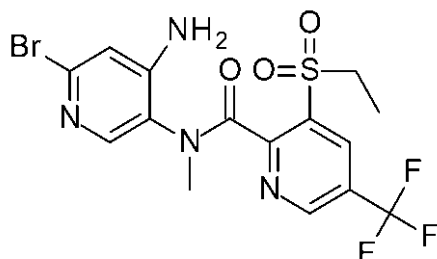
50

H z、3 H) .

【 0 1 8 6 】

工程 F : N - (4 - アミノ - 6 - ブロモ - 3 - ピリジル) - 3 - エチルスルホニル - N - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボキサミド :

【 化 3 4 】



10

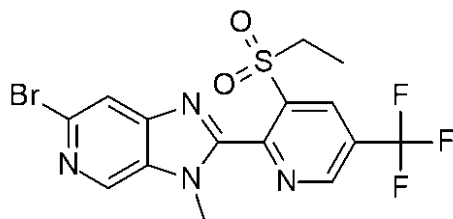
D M F (5 . 0 m L) 中の 6 - ブロモ - N 3 - メチル - ピリジン - 3 , 4 - ジアミン (0 . 6 0 g、2 . 9 6 m m o l)、3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボン酸 (0 . 9 2 g、3 . 2 6 m m o l、国際公開第 2 0 1 3 1 8 0 1 9 4 号にあるように調製される) および H A T U (1 . 4 g、3 . 6 8 m m o l) の攪拌溶液に D I P E A (1 . 2 m l、7 . 2 6 m m o l) を加えた。この系を室温で一晩攪拌した。反応物を E t O A c および H₂O で希釈し、有機層を塩水および水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥させた。ろ過および減圧下での濃縮後、粗表題生成物をさらに精製せずに次の工程に使用した。

20

【 0 1 8 7 】

工程 G : 6 - ブロモ - 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン :

【 化 3 5 】



30

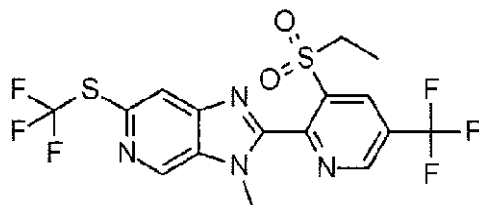
酢酸 (5 . 0 m L) 中の N - (4 - アミノ - 6 - ブロモ - 3 - ピリジル) - 3 - エチルスルホニル - N - メチル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボキサミド (粗生成物、2 . 9 6 m m o l) の溶液を 1 2 0 で一晩攪拌した。混合物を蒸発乾固させた。残渣をシリカゲル上でのクロマトグラフィー (石油エーテル : E t O A c = 4 : 1) によって精製したところ、表題化合物が白色の固体として得られた。¹H N M R (4 0 0 M H z、D M S O - d₆) : (p p m) 9 . 5 3 (s、1 H)、8 . 9 4 (s、1 H)、8 . 7 4 (s、1 H)、8 . 0 1 (s、1 H)、3 . 8 3 (q、J = 7 . 6 H z、2 H)、3 . 7 9 (s、3 H)、1 . 1 9 (t、J = 7 . 2 H z、3 H) . ¹⁹F N M R (3 0 0 M H z、D M S O - d₆) : (p p m) - 6 0 . 4 2 (s、3 F) . E S I - M S (+) : 4 4 9 (M + H)、4 7 2 (M + N a) ; E S I - M S (-) : 4 4 7 (M - H) . M p t . 1 8 8 - 1 9 0 . L C M S (標準方法 1) : R t . 0 . 9 5 m i n、4 4 9 / 4 5 1 (M + H) .

40

【 0 1 8 8 】

工程 H : 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (化合物 P 1 0、表 P)。

【化 3 6】



(化合物P10、表P)

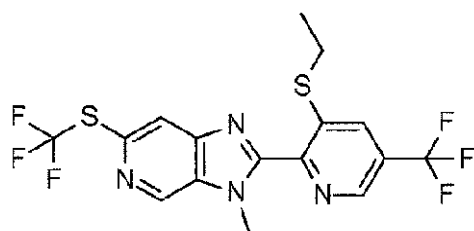
グローブボックス中で CuF_2 (5.1 g、50 mmol)、 S_8 (1.6 g、50 mmol)、および 100 mL の CH_3CN を、Teflonねじ込み弁を有するオープン乾燥された再密封可能なシュレンク管に加えた。 CF_3SiMe_3 (21.3 g、150 mmol) をこの管に加え、管を密封した。反応混合物を予熱された油浴中において 90 で 24 時間撹拌した。次に、反応混合物を室温に冷却させ、Celiteに通してろ過した。揮発性物質を減圧下で除去し、得られた暗褐色の固体を Et_2O (3 × 30 mL) で洗浄した。固体を 40 mL の CH_3CN に再度溶解させ、100 mL の Et_2O 中の 2, 2'-ビピリジン (7.8 g、50 mmol) をこの溶液に加えた。得られた溶液を室温で 2 時間撹拌し、次に 48 時間にわたって -25 に保持した。得られた赤色の結晶をジエチルエーテル (2 × 40 mL) で洗浄し、減圧下で乾燥させたところ、(bpy) CuSCF_3 が得られた。120 mL の CH_3CN 中の (bpy) CuSCF_3 (8.2 g、25.6 mmol) および 6-ブromo-2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-c]ピリジン (4 g、8.9 mmol) の溶液を窒素下で 24 時間還流させた。反応混合物を油浴から除去し、冷却させ、ジエチルエーテルで溶離しながら、 SiO_2 に通してろ過した。エーテルろ液を塩水で洗浄し、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題化合物が白色の固体として得られた。融点 180 ~ 181 。

LCMS (標準方法 1) : 1.04 min、471 (M+H). ^1H NMR (600 MHz、 CDCl_3) : ppm 1.42 (t, J = 7.5 Hz、3H)、3.91 (q, J = 7.5 Hz、2H)、3.98 (s, 3H)、8.56 (s, 1H)、8.80 (d, J = 2.1 Hz、1H)、9.02 (s, 1H)、9.27 (d, J = 1.8 Hz、1H); ^{13}C NMR (151 MHz、 CDCl_3) : ppm 7.0 (s, 1C)、32.1 (s, 1C)、52.0 (s, 1C)、114.1 (s, 1C)、122.1 (q, J = 27.2 Hz、1C)、124.9 (q, J = 33.8 Hz、1C)、128.4 (q, J = 3.5 Hz、1C)、134.6 (s, 1C)、135.3 (s, 1C)、137.3 (q, J = 4 Hz、1C)、138.4 (s, 1C)、148.0 (s, 1C)、149.5 (q, J = 2 Hz、1C)、149.7 (q, J = 3 Hz、1C)、151.4 (s, 1C)、152.5 (s, 1C); ^{19}F NMR (400 MHz、 CDCl_3) : ppm -36.9 (s, 3F)、-58.1 (s, 3F)。

【0189】

実施例 P2 : 2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-(トリフルオロメチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン (化合物 P11、表 P) :

【化 3 7】

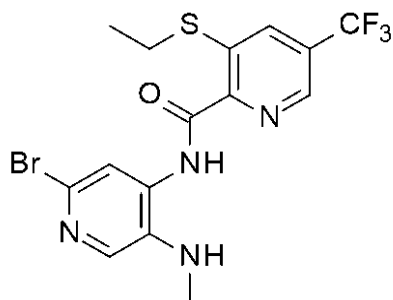


(化合物P11、表P)

10

工程 A : N - [2 - ブロモ - 5 - (メチルアミノ) - 4 - ピリジル] - 3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボキサミド

【化 3 8】



20

5 ml の DMF 中の 3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボン酸 (4 . 6 8 g 、 1 8 . 6 mmol 、 国際公開第 2 0 1 4 1 0 4 4 0 7 号に記載されているように調製される) の溶液に 6 - ブロモ - N 3 - メチル - ピリジン - 3 , 4 - ジアミン (3 . 4 2 g 、 1 6 . 9 mmol 、 工程 E 、 実施例 P 1 に記載されているように調製される) 、 [O - (7 - アザベンゾトリアゾール - 1 - イル) - N , N , N ' , N ' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート] (H A T U 、 8 . 0 6 g 、 2 1 . 0 mmol) およびジ - イソプロピルエチルアミン (5 . 3 6 g 、 4 1 . 5 mmol 、 7 . 1 0 ml) を 0 で加えた。オレンジ色の懸濁液を室温に温め、一晚撹拌した。この後の LCMS 分析により、反応の完了が示された。この時点でオレンジ色の溶液を EtOAc および水で希釈した。有機相を分離し、水相を EtOAc で逆抽出し、組み合わせられた有機相を Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシクロヘキサン : EtOAc 勾配 0 : 100 % で溶離しながら、330 g の Redi sep シリカゲルカートリッジを用いて Torrent 機械において精製したところ、表題化合物が白色の固体として得られた。

30

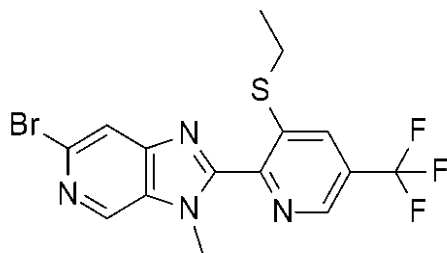
LCMS (標準方法 1) : Rt . 1 . 3 0 min 、 4 3 5 / 4 3 7 (M + H) . ¹H NMR (4 0 0 MHz 、 クロロホルム - d) ppm : 1 . 3 7 (t , J = 7 . 3 4 Hz 、 3 H) ; 2 . 9 7 - 3 . 0 7 ; (m , 2 H) ; 3 . 2 6 - 3 . 4 1 (s , 3 H) ; 4 . 6 0 - 4 . 7 5 (m , 2 H) ; 6 . 7 1 (s , 1 H) ; 7 . 7 3 (d , J = 1 . 4 7 Hz 、 1 H) ; 7 . 9 5 (s , 1 H) ; 8 . 3 5 (d , J = 0 . 7 3 Hz 、 1 H) .

40

【 0 1 9 0 】

工程 B : 6 - ブロモ - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン :

【化 3 9】



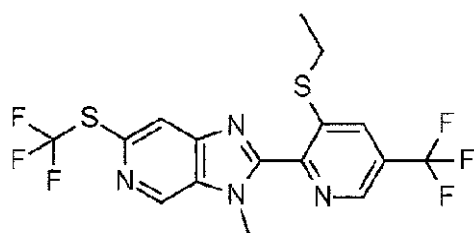
酢酸 (30 ml) 中の N - [2 - ブロモ - 5 - (メチルアミノ) - 4 - ピリジル] - 3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボキサミド (7.90 g、18.1 mmol) の溶液を 120 で 12 時間加熱し、その時点で、LCMS 分析により、反応の完了が示された。溶媒を減圧下で除去し、粗生成物をシクロヘキサン : EtOAc 勾配 0 : 100 % で溶離しながら、220 g の Redi sep シリカゲルカートリッジを用いて Torrent 機械において精製したところ、表題化合物が白色の固体として得られた。

LCMS (標準方法 1) : Rt . 0.95 min、417 / 419 (M + H) . ¹H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm ; 1.39 (t, J = 7.34 Hz、3 H) ; 3.02 (q, J = 7.34 Hz、2 H) ; 4.03 (s, 3 H) : 7.93 (d, J = 0.73 Hz、1 H) ; 7.99 (d, J = 1.10 Hz、1 H) ; 8.68 (d, J = 1.10 Hz、1 H) ; 8.74 (d, J = 0.73 Hz、1 H) .

【 0 1 9 1】

工程 C : 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (化合物 P 11、表 P)

【化 4 0】



(化合物 P11)

15 ml の CH₃CN 中の (bpy) CuSCF₃ (480 mg、1.5 mmol) および 6 - ブロモ - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (209 mg、0.5 mmol) の溶液を窒素下で 24 時間還流させた。反応混合物を油浴から除去し、冷却させ、次に SiO₂ に通してろ過し、ジエチルエーテルで溶離し、塩水で洗浄し、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題化合物がベージュ色の粉末として得られた。融点 147 ~ 148 。

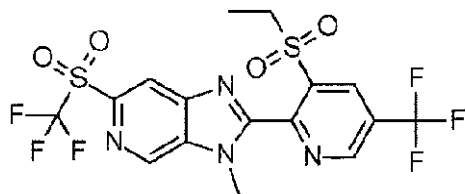
LCMS (標準方法 1) : Rt . 1.11 min、439 (M + H) . ¹H NMR (400 MHz、CDCl₃) : ppm 1.40 (t, J = 6.8 Hz、3 H) ; 3.02 (q, J = 7.2 Hz、2 H) ; 4.09 (s, 3 H) ; 7.94 (s, 1 H) ; 8.23 (s, 1 H) ; 8.75 (s, 1 H) ; 8.96 (s, 1 H) ; ¹⁹F NMR (300 MHz、CDCl₃) : ppm - 58.6 (s, 3 F) ; - 79.5 (s, 3 F) .

【 0 1 9 2】

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

ン（化合物 P 8、表 P）：

【化 4 1】



(化合物P8、表P)

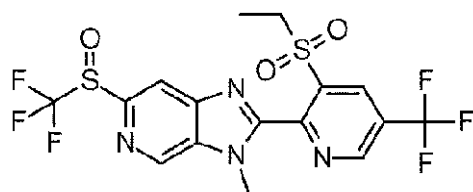
40 ml の CH_3CN 中の 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (507 mg、1.08 mmol)、 $\text{NaWO}_4 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$ (330 mg、1 mmol) および 8 ml の 30 % の H_2O_2 の溶液を 48 時間還流させた。反応混合物を油浴から除去し、冷却させ、次に水中の $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ の飽和溶液に注ぎ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題生成物が白色の粉末として得られた。融点 210 ~ 212 °C。

LCMS (標準方法 1) : Rt . 1.02 min、503 (M + H) . ^1H NMR (600 MHz、 CDCl_3) : ppm 1.43 (t , J = 7.4 Hz、3 H)、3.88 (q , J = 7.4 Hz、2 H)、4.01 (s , 3 H)、8.72 (s , 1 H)、8.80 (d , J = 1.9 Hz、1 H)、9.15 (s , 1 H)、9.28 (dq , J = 1.9、0.7 Hz、1 H) ; ^{13}C NMR (151 MHz、 CDCl_3) : ppm 7.1 (s , 1 C)、32.3 (s , 1 C)、52.0 (s , 1 C)、120.0 (q , J = 32.7 Hz、1 C)、122.1 (q , J = 27.4 Hz、1 C)、120.1 (s , 1 C)、128.6 (q , J = 35 Hz、1 C)、135.5 (s , 1 C)、136.3 (s , 1 C)、137.3 (q , J = 3 Hz、1 C)、138.5 (s , 1 C)、143.4 (s , 1 C)、147.2 (s , 1 C)、149.8 (q , J = 4 Hz、1 C)、150.9 (s , 1 C)、153.5 (s , 1 C) ; ^{19}F NMR (400 MHz、 CDCl_3) : ppm - 58.2 (s , 3 F)、- 71.6 (s , 3 F) .

【 0 1 9 3 】

実施例 P 4 . 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルフィニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (化合物 P 9、表 P) :

【化 4 2】



(化合物P9、表P)

30 ml の CH_2Cl_2 中の化合物 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (トリフルオロメチルスルファニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (540 mg、1.15 mmol) および m - CPBA (1.49 g、8.66 mmol) を室温で 6 時間撹拌した。次に、混合物を水中の NaHCO_3 および Na_2SO_3 の飽和溶液に注ぎ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗生成物をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題生成物が白色の固体として

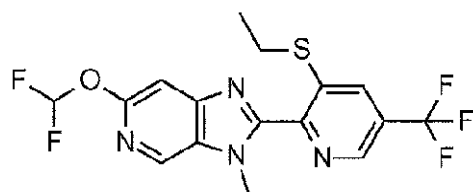
得られた。融点 206 ~ 207 。

LCMS (標準方法 1): Rt. 0.96 min、487 (M+H). ¹H NMR (600 MHz、CDCl₃): ppm 1.44 (t, J = 7.4 Hz、3 H)、3.86 (s, 3 H)、3.90 (q, J = 7.5 Hz、2 H)、8.28 (s, 1 H)、8.69 (s, 1 H)、8.79 (d, J = 1.8 Hz、1 H)、9.26 (dq, J = 1.8、0.6 Hz、1 H); ¹³C NMR (151 MHz、CDCl₃): ppm 7.1 (s, 1 C)、32.5 (s, 1 C)、52.0 (s, 1 C)、117.0 (s, 1 C)、122.1 (q, J = 274 Hz、1 C)、123.9 (s, 1 C)、128.5 (q, J = 34 Hz、1 C)、136.2 (s, 1 C)、137.5 (q, J = 4 Hz、1 C)、138.4 (s, 1 C)、140.0 (s, 1 C)、143.7 (br. s., 1 C)、149.7 (q, J = 4 Hz、1 C)、150.5 (s, 1 C)、153.2 (s, 1 C); ¹⁹F NMR (400 MHz、CDCl₃): ppm -62.1 (s, 3 F)、-71.7 (s, 3 F)。

【0194】

実施例 P5: 6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン (化合物 P13、表 P):

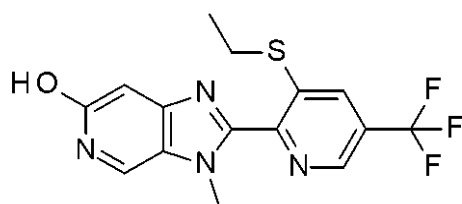
【化 4 3】



(化合物 P13、表 P)

工程 A: 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 6 - オール

【化 4 4】

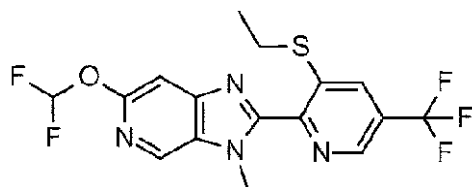


40 ml の H₂O 中の 6 - プロモ - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン: (3 g、7.2 mmol) と、K₃PO₄ (2.29 g、10.8 mmol) と、CuI (274 mg、1.44 mmol) と、N, N' - ジメチル - 1, 2 - エチレンジアミン (630 mg、7.2 mmol) との混合物を窒素下で 6 時間にわたって 120 で還流させた。次に、反応混合物を室温に冷却させ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題化合物が白色の粉末として得られた。¹H NMR (400 MHz、DMSO - d₆): ppm 1.20 (t, 3 H)、3.12 (q, 2 H)、3.81 (s, 3 H)、6.72 (s, 1 H)、8.27 (s, 1 H)、8.46 (s, 1 H)、8.91 (s, 1 H)、10.58 (bs, 1 H); ¹⁹F NMR (376 MHz、DMSO - d₆): ppm -56.2 (s, 3 F); ES I - MS (+): 355 (M+H)⁺。

【0195】

工程 B : 6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (化合物 P 13、表 P) :

【化 4 5】



(化合物P13、表P)

10

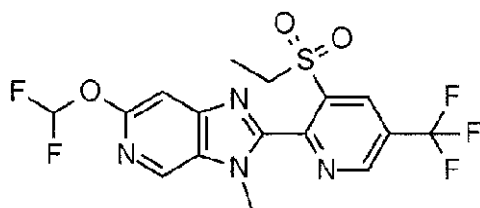
25 ml の DMF 中の 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン - 6 - オール (300 mg、0.85 mmol) および Cs_2CO_3 (1.52 g、4.66 mmol) の懸濁液を 60 で 10 分間攪拌し、 CHF_2Cl ガスを 1 時間にわたって混合物に導入した。次に、反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題生成物が白色の固体として得られた。 ^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : ppm 1.39 (t , 3 H)、3.0 (q , 2 H)、4.01 (s , 3 H)、7.28 - 7.65 (t , 1 H)、7.37 (s , 1 H)、7.93 (s , 1 H)、8.48 (s , 1 H)、8.74 (s , 1 H) ; ^{19}F NMR (376 MHz、 CDCl_3) : ppm - 62.64 (s , 3 F)、- 87 (d , 2 F) ; ESI - MS (+) : 405 (M + H)⁺.

20

【 0 1 9 6 】

実施例 P 6 : 6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (化合物、P 6、表 P) :

【化 4 6】



(化合物P6、表P)

30

15 ml の DCM 中の 6 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - [3 - エチルスルファニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (80 mg、0.2 mmol) および m - CPBA (172 mg、1 mmol) の溶液を室温で 2 時間攪拌した。次に、混合物を水中の NaHCO_3 および Na_2SO_3 の飽和溶液に注ぎ、ジクロロメタンで 3 回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製したところ、表題生成物が白色の固体として得られた。融点 172 ~ 174 。

40

LCMS (標準方法 1) : Rt . 0.98 min、452 (M + H) . ^1H NMR (400 MHz、 CDCl_3) : ppm 1.39 (t , 3 H)、3.85 (s , 3 H)、3.89 (q , 2 H)、7.3 - 7.66 (t , 1 H)、7.27 (s , 1 H)、8.52 (s , 1 H)、8.77 (s , 1 H)、9.24 (s , 1 H) ; ^{19}F NMR (376 MHz、 CDCl_3) : ppm - 62.25 (s , 3 F)、- 87.33 (d , 2 F

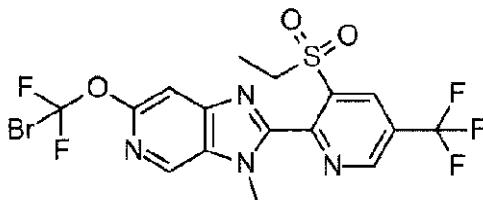
50

); ESI-MS(+): 437 (M+H)⁺, 459 (M+Na)⁺.

【0197】

実施例 P7: 6-[ブromo(ジフルオロ)メトキシ]-2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-c]ピリジン(化合物 P5、表 P):

【化47】



(化合物P5、表P)

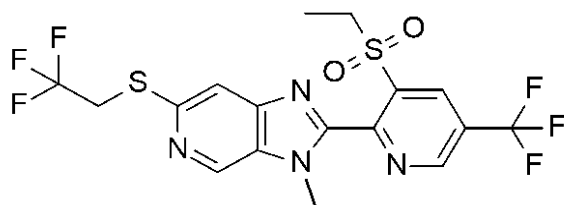
0 で30 mLのDMF中の2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-6-オール(1.2 g、3.4 mmol)の溶液に窒素雰囲気下で60%のNaH(500 mg、12.5 mmol)を加えた。室温で1時間攪拌した後、次に混合物を30分間にわたって60に加熱した。次に、乾燥DMF(17 mL、1 mol/L)中のCF₂Br₂の溶液を0でゆっくりと加えた。次に、反応混合物を室温でさらに2時間攪拌し、この後、t-BuOK(420 mg、3.74 mmol)を加えた。反応物および反応混合物を70で一晩攪拌した。混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣をシリカゲル上でのカラムクロマトグラフィーによって精製した。25 mLのジクロロメタン中の6-[ブromo(ジフルオロ)メトキシ]-2-[3-エチルスルファニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-c]ピリジン(150 mg)およびm-CPBA(470 mg、2.73 mmol)の粗生成物を室温で2時間攪拌した。次に、混合物を水中のNaHCO₃およびNa₂SO₃の飽和溶液に注ぎ、ジクロロメタンで3回抽出した。組み合わされた有機層を硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。残渣を分取HPLCによって精製したところ、表題生成物6-[ブromo(ジフルオロ)メトキシ]-2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-イミダゾ[4,5-c]ピリジンが得られた。融点164~165。

LCMS(標準方法1): Rt, 2.05 min, 515/517 (M+H). ¹H NMR(400 MHz, CDCl₃): ppm 1.41(t, 3H), 3.89(m, 5H), 7.50(s, 1H), 8.70(s, 1H), 8.78(s, 1H), 9.25(s, 1H); ¹⁹F NMR(376 MHz, CDCl₃): ppm -62.40(s, 3F), -15.49(s, 2F).

【0198】

実施例 P8: 2-[3-エチルスルホニル-5-(トリフルオロメチル)-2-ピリジル]-3-メチル-6-(2,2,2-トリフルオロエチルスルファニル)イミダゾ[4,5-c]ピリジン(化合物 P17、表 P)

【化 4 8】



マイクロ波バイアル中で 6 - ブロモ - 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (0 . 5 0 g、1 . 0 当量、1 . 1 m m o l) を D M F (1 5 m L) に溶解させた。この攪拌溶液に 2 , 2 , 2 - トリフルオロエタンチオール (0 . 1 9 g、1 . 6 m m o l) およびヨウ化銅 (I) (0 . 0 6 4 g、0 . 3 0 当量、0 . 3 3 m m o l) を加えた。反応混合物を 1 時間にわたり 1 3 0 °C においてマイクロ波オーブン中で照射した。L C / M S 分析により、約 1 : 5 の比率で所望の質量が示された。さらなる分量の 2 , 2 , 2 - トリフルオロエタンチオール (C、0 . 1 9 g、0 . 1 5 m L、1 . 4 当量、1 . 6 m m o l) およびヨウ化銅 (I) (0 . 0 6 4 g、0 . 3 0 当量、0 . 3 3 m m o l) を加え、混合物をマイクロ波中で 1 3 0 °C において 2 時間攪拌した。この後、反応混合物を希釈し、酢酸エチルで抽出した。有機相を水および塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗化合物をシクロヘキサン : 酢酸エチルで溶離しながら、シリカゲルカートリッジ (R f 2 0 0) 上で精製したところ、表題化合物が、黄色がかった固体として得られた。

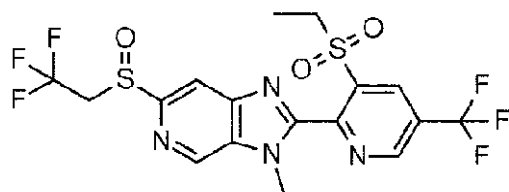
^1H NMR (4 0 0 M H z、クロロホルム - d) p p m 1 . 3 9 (t , J = 7 . 5 2 H z、3 H) 3 . 8 6 (s , 3 H) 3 . 8 6 - 3 . 9 3 (m , 2 H) 4 . 0 2 - 4 . 1 3 (m , 2 H) 7 . 7 0 (d , J = 1 . 1 0 H z、1 H) 8 . 7 6 (d , J = 1 . 8 3 H z、1 H) 8 . 8 2 (d , J = 1 . 1 0 H z、1 H) 9 . 2 3 (d , J = 1 . 1 0 H z、1 H)

L C - M S (S t d - 1) M + H (4 8 5) ; R t = 1 . 0 8 m i n

【 0 1 9 9 】

実施例 P 9 : 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルスルフィニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (化合物 P 1 5、表 P) :

【化 4 9】



(化合物P15、表P)

0 で M C P B A (0 . 0 4 6 g、1 . 0 当量、0 . 2 1 m m o l) をクロロホルム中の 2 - [3 - エチルスルホニル - 5 - (トリフルオロメチル) - 2 - ピリジル] - 3 - メチル - 6 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチルスルフィニル) イミダゾ [4 , 5 - c] ピリジン (a、0 . 1 0 g、1 . 0 当量、0 . 2 1 m m o l) の溶液に加えた。添加後、氷浴を 1 0 分間保持し、次に乳状の溶液を周囲温度に温め、反応が完了するまで攪拌した。次に、混合物を飽和チオ硫酸ナトリウム水溶液でクエンチし、飽和 NaHCO_3 (水溶液) で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、減圧下で濃縮した。シクロヘキサン / 酢酸エチルで溶離しながらのシリカゲルカートリッジ (R f 2 0 0) 上での精製により、表題化合物が白色の固体として得られた。

^1H NMR (400 MHz、クロロホルム - d) ppm 1.41 (t, $J = 7.52$ Hz, 3H) 3.47 - 3.59 (m, 1H) 3.87 - 3.94 (m, 2H) 3.96 (s, 3H) 4.05 (dd, $J = 14.31$, 10.64 Hz, 1H) 8.47 (d, $J = 0.73$ Hz, 1H) 8.78 (d, $J = 1.83$ Hz, 1H) 8.96 (d, $J = 0.73$ Hz, 1H) 9.26 (d, $J = 1.10$ Hz, 1H)

LC/MS: Rt = 0.95 分; $\text{M} + \text{H} [501]^+$

【0200】

表P: 以下の物理的および分光分析データを有する式(I)の化合物の例:

【表 1 2 - 1】

化合物	構造	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	NMR	Mpt. °C
P1		1.67	399	Std-1		-
P2		0.87	401	Std-1		177 - 178
P3		0.98	452	Std-1		172 - 174
P4		0.92	427	Std-1		198 - 200
P5		2.05	515/517	Std-1		164 - 165
P6		0.99	437	Std-1		210 - 211
P7		1.06	405	Std-1		147 - 148
P8		1,02	503	Std-1		210 - 212
P9		0.96	487	Std-1		206 - 207

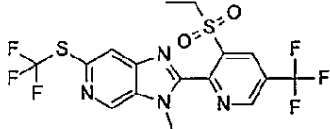
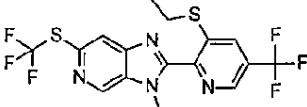
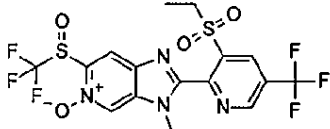
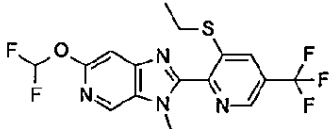
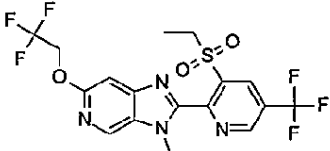
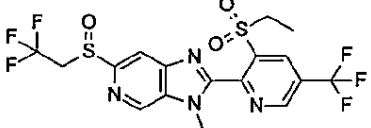
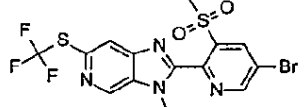
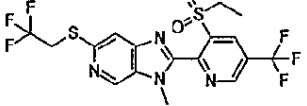
10

20

30

40

【表 1 2 - 2】

P10		1.04	471	Std-1		180 - 181
P11		1.11	439	Std-1		147 - 148
P12		0.86	503	Std-1		234 - 235
P13					¹ HNMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆): δppm 1.20 (t, 3 H), 3.12 (q, 2 H), 3.81 (s, 3 H), 6.72 (s, 1 H), 8.27 (s, 1 H), 8.46 (s, 1 H), 8.91 (s, 1 H), 10.58 (bs, 1 H);	-
P14						125 - 126
P15						204 - 205
P16		1.05	481/483	Std-1		159 - 160
P17		1.08	485	Std-1		-

式(I)の化合物のさらなる具体例が上の表1～23中に示される。

【0202】

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

【0203】

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

【0204】

式Iの化合物と、活性成分との以下の混合物が好ましい(「TX」という略語は、「本発明の表1～23およびPに記載される化合物からなる群から選択される1つの化合物」を意味する)：

石油(628)+TXからなる物質の群から選択される補助剤、

1, 1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(910)+TX、2, 4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセドアミド(IUPAC名)(1295)+TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセキノシル(3)+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アクリナトリン(9)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(863)+TX、-シベルメトリン(202)+TX、アミジチオン(870)+TX、アミドフルメト[CCN]+TX、アミドチオエート(872)+TX、アミトン(875)+TX、アミトンシュウ酸水素塩(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化二ヒ素(882)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトエート(889)+TX、ペノミル(62)+TX、ペノキサホス[CCN]+TX、ベンゾキシメート(71)+TX、安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN]+TX、ピフェナゼート(74)+TX、ピフェントリン(76)+TX、ピナパクリル(907)+TX、プロフェンバレレート+TX、プロモシクレン(918)+TX、プロモホス(920)+TX、プロモホス-エチル(921)+TX、プロモプロピレート(94)+TX、ブプロフェジン(99)+TX、プトカルボキシム(103)+TX、プトキシカルボキシム(104)+TX、ブチルピリダベン+TX、多硫化カルシウム(IUPAC名)(111)+TX、カンフェクロル(941)+TX、カーバノレート(943)+TX、カルバリル(115)+TX、カルボフラン(118)+TX、カルボフェノチオン(947)+TX、CGA 50'439(開発コード)(125)+TX、キノメチオナト(126)+TX、クロルベンシド(959)+TX、クロルジメホルム(964)+TX、クロルジメホルム塩酸塩(964)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェネトール(968)+TX、クロルフェンソン(970)+TX、クロルフェンスルフィド(971)+TX、クロルフェンピンホス(131)+TX、クロルベンジレート(975)+TX、クロロメブホルム(977)+TX、クロロメチウロン(978)+TX、クロロプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+

10

20

30

40

50

TX、クロルピリホス - メチル (1 4 6) + TX、クロルチオホス (9 9 4) + TX、シ
 ネリン I (6 9 6) + TX、シネリン II (6 9 6) + TX、シネリン (6 9 6) + TX
 、クロフェンテジン (1 5 8) + TX、クロサンテル [C C N] + TX、クマホス (1 7
 4) + TX、クロタミトン [C C N] + TX、クロトキシホス (1 0 1 0) + TX、クフ
 ラネブ (1 0 1 3) + TX、シアントエート (1 0 2 0) + TX、シフルメトフェン (C
 A S 登録番号 : 4 0 0 8 8 2 - 0 7 - 7) + TX、シハロトリン (1 9 6) + TX、シヘ
 キサチン (1 9 9) + TX、シペルメトリン (2 0 1) + TX、DCPM (1 0 3 2) +
 TX、DDT (2 1 9) + TX、デメフィオン (1 0 3 7) + TX、デメフィオン - O (1
 0 3 7) + TX、デメフィオン - S (1 0 3 7) + TX、デメトン (1 0 3 8) + TX
 、デメトン - メチル (2 2 4) + TX、デメトン - O (1 0 3 8) + TX、デメトン - O
 - メチル (2 2 4) + TX、デメトン - S (1 0 3 8) + TX、デメトン - S - メチル (2
 2 4) + TX、デメトン - S - メチルスルホン (1 0 3 9) + TX、ジアフェンチウロ
 ン (2 2 6) + TX、ジアリホス (1 0 4 2) + TX、ジアジノン (2 2 7) + TX、ジ
 クロフルアニド (2 3 0) + TX、ジクロルボス (2 3 6) + TX、ジクリホス + TX、
 ジコホル (2 4 2) + TX、ジクロトホス (2 4 3) + TX、ジエノクロル (1 0 7 1)
 + TX、ジメボックス (1 0 8 1) + TX、ジメトエート (2 6 2) + TX、ジナクチン
 (6 5 3) + TX、ジネクス (1 0 8 9) + TX、ジネクス - ジクレキシ (1 0 8 9)
 + TX、ジノブトン (2 6 9) + TX、ジノカップ (2 7 0) + TX、ジノカップ - 4 [C
 C N] + TX、ジノカップ - 6 [C C N] + TX、ジノクトン (1 0 9 0) + TX、ジ
 ノペントン (1 0 9 2) + TX、ジノスルホン (1 0 9 7) + TX、ジノテルボン (1 0
 9 8) + TX、ジオキサチオン (1 1 0 2) + TX、ジフェニルスルホン (I U P A C 名)
 (1 1 0 3) + TX、ジスルフィラム [C C N] + TX、ジスルホトン (2 7 8) + T
 X、DNOC (2 8 2) + TX、ドフェナピン (1 1 1 3) + TX、ドラメクチン [C C
 N] + TX、エンドスルファン (2 9 4) + TX、エンドチオン (1 1 2 1) + TX、E
 P N (2 9 7) + TX、エブリノメクチン [C C N] + TX、エチオン (3 0 9) + TX
 、エトエート - メチル (1 1 3 4) + TX、エトキサゾール (3 2 0) + TX、エトリム
 ホス (1 1 4 2) + TX、フェナザフロル (1 1 4 7) + TX、フェナザキン (3 2 8)
 + TX、酸化フェンブタズ (3 3 0) + TX、フェノチオカルブ (3 3 7) + TX、フ
 ェンプロパトリン (3 4 2) + TX、フェンピラド + TX、フェンピロキシメート (3 4
 5) + TX、フェンソン (1 1 5 7) + TX、フェントリファニル (1 1 6 1) + TX、
 フェンバレート (3 4 9) + TX、フィプロニル (3 5 4) + TX、フルアクリピリム
 (3 6 0) + TX、フルアズロン (1 1 6 6) + TX、フルベンジミン (1 1 6 7) + T
 X、フルシクロクスロン (3 6 6) + TX、フルシトリネート (3 6 7) + TX、フルエ
 ネチル (1 1 6 9) + TX、フルフェノクスロン (3 7 0) + TX、フルメトリン (3 7
 2) + TX、フルオルベンシド (1 1 7 4) + TX、フルバリネート (1 1 8 4) + TX
 、FMC 1 1 3 7 (開発コード) (1 1 8 5) + TX、ホルメタネート (4 0 5) + T
 X、塩酸ホルメタネート (4 0 5) + TX、ホルモチオン (1 1 9 2) + TX、ホルムパ
 ラネート (1 1 9 3) + TX、 - H C H (4 3 0) + TX、グリオジン (1 2 0 5) +
 TX、ハルフェンブロックス (4 2 4) + TX、ヘプテノホス (4 3 2) + TX、ヘキサ
 デシルシクロプロパンカルボキシレート (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1
 2 1 6) + TX、ヘキシチアゾクス (4 4 1) + TX、ヨードメタン (I U P A C 名) (5
 4 2) + TX、イソカルボホス (4 7 3) + TX、イソプロピル O - (メトキシアミノ
 チオホスホリル) サリチレート (I U P A C 名) (4 7 3) + TX、イベルメクチン [C
 C N] + TX、ジャスモリン I (6 9 6) + TX、ジャスモリン II (6 9 6) + TX、
 ヨードフェンホス (1 2 4 8) + TX、リンダン (4 3 0) + TX、ルフェヌロン (4 9
 0) + TX、マラチオン (4 9 2) + TX、マロノベン (1 2 5 4) + TX、メカルバム
 (5 0 2) + TX、メホスホラン (1 2 6 1) + TX、メスルフェン [C C N] + TX、
 メタクリホス (1 2 6 6) + TX、メタミドホス (5 2 7) + TX、メチダチオン (5 2
 9) + TX、メチオカルブ (5 3 0) + TX、メトミル (5 3 1) + TX、臭化メチル (5
 3 7) + TX、メトルカルブ (5 5 0) + TX、メビンホス (5 5 6) + TX、メキサ

カルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム[CCN]+TX、ミバホックス(1293)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、NC-512(化合物コード)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニコマイシン[CCN]+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラチオン(615)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(628)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホキシム(642)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347)+TX、ポリナクチン(653)+TX、プロクロノール(1350)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロマシル(1354)+TX、プロパルギット(671)+TX、プロペタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロトエート(1362)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、キナルホス(711)+TX、キンチオキス(1381)+TX、R-1492(開発コード)(1382)+TX、RA-17(開発コード)(1383)+TX、ロテノン(722)+TX、シュラーダン(1389)+TX、セブホス+TX、セラメクチン[CCN]+TX、SI-0009(化合物コード)+TX、ソファミド(1402)+TX、スピロジクロフェン(738)+TX、スピロメシフェン(739)+TX、SSI-121(開発コード)(1404)+TX、スルフィラム[CCN]+TX、スルフルアミド(750)+TX、スルホテップ(753)+TX、硫黄(754)+TX、SZI-121(開発コード)(757)+TX、一フルバリネート(398)+TX、テブフェンピラド(763)+TX、TEPP(1417)+TX、テルバム+TX、テトラクロロピンホス(777)+TX、テトラジホン(786)+TX、テトラナクチン(653)+TX、テトラスル(1425)+TX、チアフェノックス+TX、チオカルボキシム(1431)+TX、チオファノックス(800)+TX、チオメトン(801)+TX、チオキノックス(1436)+TX、ツリンギエンシン[CCN]+TX、トリアミホス(1441)+TX、トリアラテン(1443)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン+TX、トリクロロホン(824)+TX、トリフェノホス(1455)+TX、トリナクチン(653)+TX、バミドチオン(847)+TX、バニリプロール[CCN]およびYI-5302(化合物コード)+TXからなる物質の群から選択される殺ダニ剤、

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

アバメクチン(1)+TX、クルホマート(1011)+TX、ドラメクチン[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、エブリノメクチン[CCN]+TX、イベルメクチン[CCN]+TX、ミルベマイシンオキシム[CCN]+TX、モキシデクチン[CCN]+TX、ピペラジン[CCN]+TX、セラメクチン[CCN]+TX、スピノサド(737)およびチオファネート(1

10

20

30

40

50

435) + TX からなる物質の群から選択される駆虫剤、

クロラロス (127) + TX、エンドリン (1122) + TX、フェンチオン (346) + TX、ピリジン - 4 - アミン (IUPAC 名) (23) およびストリキニーネ (745) + TX からなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1 - ヒドロキシ - 1H - ピリジン - 2 - チオン (IUPAC 名) (1222) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (748) + TX、8 - ヒドロキシキノリン硫酸塩 (446) + TX、プロノポール (97) + TX、ジオクタン酸銅 (IUPAC 名) (170) + TX、水酸化銅 (IUPAC 名) (169) + TX、クレゾール [CCN] + TX、ジクロロフェン (232) + TX、ジピリチオン (1105) + TX、ドジシン (1112) + TX、フェナミノスルフ (1144) + TX、ホルムアルデヒド (404) + TX、ヒドラルガフェン [CCN] + TX、カスガマイシン (483) + TX、塩酸カスガマイシン水和物 (483) + TX、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート) (IUPAC 名) (1308) + TX、ニトラピリン (580) + TX、オクチリノン (590) + TX、オキソリン酸 (606) + TX、オキシテトラサイクリン (611) + TX、カリウムヒドロキシキノリン硫酸塩 (446) + TX、プロベナゾール (658) + TX、ストレプトマイシン (744) + TX、セスキ硫酸ストレプトマイシン (744) + TX、テクロフタラム (766) + TX、およびチオメルサル [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺菌剤、

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

10

20

30

40

50

coverpa zea) NPV (431) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオ
 フォラ (Heterorhabdus bacteriophora) および H. メ
 ギディス (H. megidis) (433) + TX、サカハチテントウ (Hippoda
 mia convergens) (442) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ
 (Leptomastix dactylopii) (488) + TX、マクロロフス・
 カリギノス (Macrolophus caliginosus) (491) + TX、
 ヨトウガ (Mamestra brassicae) NPV (494) + TX、メタフィ
 カス・ヘルボルス (Metaphycus helvolus) (522) + TX、メタ
 リジウム・アニソプリエ変種アクリヅム (Metarhizium anisopliae
 var. acridum) (学名) (523) + TX、メタリジウム・アニソプリエ
 変種アニソプリエ (Metarhizium anisopliae var. anis
 opliae) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (Neodiprion s
 ertifer) NPV および N. レコンティ (N. lecontei) NPV (575
) + TX、オリウス属 (Orius spp.) (596) + TX、ペシロマイセス・フ
 モソロセウス (Paecilomyces fumosoroseus) (613) + T
 X、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (644) +
 TX、シロイチモジヨトウ (Spodoptera exigua) 多カブシド核多角体
 病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナーネマ・ビビオニス (Steinern
 ema bibionis) (742) + TX、スタイナーネマ・カルボカプサエ (St
 einnernema carpocapsae) (742) + TX、スタイナーネマ・フ
 ェルティアエ (Steinnernema feltiae) (742) + TX、スタイナ
 ーネマ・グラッセリ (Steinnernema glaseri) (742) + TX、ス
 タイナーネマ・リオブラベ (Steinnernema riobrave) (742) +
 TX、スタイナーネマ・リオブラビス (Steinnernema riobravis)
 (742) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (Steinnernema scap
 terisci) (742) + TX、スタイナーネマ属 (Steinnernema spp.)
 (742) + TX、トリコグラムマ属 (Trichogramma spp.) (826)
 + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (Typhlodromus occ
 identalis) (844) およびバーティシリウム・レカニ (Verticill
 ium lecanii) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、
 ヨードメタン (IUPAC 名) (542) および臭化メチル (537) + TX からなる
 物質の群から選択される土壌滅菌剤、

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

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートおよび (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オ
 ール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテ
 ート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オ
 ール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン -
 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1
 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナ
 ール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルア
 セテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 -
 イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 -
 エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン -
 1 - アール (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オ

10

20

30

40

50

ール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC 名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールおよび 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC 名) (544) + TX、 - マルチストリアチン [CCN] + TX、プレビコミン [CCN] + TX、コドレルア [CCN] + TX、コドレモン (167) + TX、キュールア (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア [CCN] + TX、4 - メチルオクタン酸エチル (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール [CCN] + TX、フロンタリン [CCN] + TX、ゴシップルア (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (421) + TX、グランドルア II (421) + TX、グランドルア III (421) + TX、グランドルア IV (421) + TX、ヘキササルア [CCN] + TX、イブスジェノール [CCN] + TX、イブセノール [CCN] + TX、ジャポニルア (481) + TX、リネアチン [CCN] + TX、リトルア [CCN] + TX、ルーブルア [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 [CCN] + TX、メチルオイゲノール (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、オルフラルア [CCN] + TX、オリクタルア (317) + TX、オストラモン [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (736) + TX、スルカトール [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルア A (839) + TX、トリメドルア B₁ (839) + TX、トリメドルア B₂ (839) + TX、トリメドルア C (839) および トランク - コール (trunc-call) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

10

20

30

2 - (オクチルチオ) エタノール (IUPAC 名) (591) + TX、ブトピロノキシル (933) + TX、ブトキシ (ポリプロピレングリコール) (936) + TX、アジピン酸ジブチル (IUPAC 名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル (1047) + TX、コハク酸ジブチル (IUPAC 名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド [CCN] + TX、ジメチルカルベート [CCN] + TX、フタル酸ジメチル [CCN] + TX、エチルヘキサンジオール (1137) + TX、ヘキサアミド [CCN] + TX、メトキン - ブチル (1276) + TX、メチルネオデカンアミド [CCN] + TX、オキサメート [CCN] および ピカリジン [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫忌避剤、

1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1058) + TX、1, 1 - ジクロロ - 2, 2 - ビス (4 - エチルフェニル) エタン (IUPAC 名) (1056) + TX、1, 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1062) + TX、1, 2 - ジクロロプロパンおよび 1, 3 - ジクロロプロパン (IUPAC 名) (1063) + TX、1 - ブロモ - 2 - クロロエタン (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (916) + TX、2, 2, 2 - トリクロロ - 1 - (3, 4 - ジクロロフェニル) エチルアセテート (IUPAC 名) (1451) + TX、2, 2 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート (IUPAC 名) (1066) + TX、2 - (1, 3 - ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1109) + TX、2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルチオシアネート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (935

40

50

) + TX、2 - (4, 5 - ジメチル - 1, 3 - ジオキソラン - 2 - イル) フェニルメチル
 カルバメート (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1084) + TX、2 - (4
 - クロロ - 3, 5 - キシリルオキシ) エタノール (IUPAC 名) (986) + TX、2
 - クロロビニルジエチルホスフェート (IUPAC 名) (984) + TX、2 - イミダゾ
 リドン (IUPAC 名) (1225) + TX、2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオ
 ン (IUPAC 名) (1246) + TX、2 - メチル (プロパ - 2 - イニル) アミノフェ
 ニルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1284) + TX、2 - チオシアナトエチル
 ラウレート (IUPAC 名) (1433) + TX、3 - ブロモ - 1 - クロロプロパ - 1 -
 エン (IUPAC 名) (917) + TX、3 - メチル - 1 - フェニルピラゾール - 5 - イ
 ルジメチルカルバメート (IUPAC 名) (1283) + TX、4 - メチル (プロパ - 2
 - イニル) アミノ - 3, 5 - キシリルメチルカルバメート (IUPAC 名) (1285)
 + TX、5, 5 - ジメチル - 3 - オキソシクロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート
 (IUPAC 名) (1085) + TX、アバメクチン (1) + TX、アセフェート (2)
 + TX、アセタミプリド (4) + TX、アセチオン [CCN] + TX、アセトプロール [C
 CN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUPAC 名) (8
 61) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、アルドキシ
 カルブ (863) + TX、アルドリッ (864) + TX、アレトリン (17) + TX、ア
 ロサミジン [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、 - シペルメトリン (2
 02) + TX、 - エクジソン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + T
 X、アミジチオン (870) + TX、アミドチオエート (872) + TX、アミノカルブ
 (873) + TX、アミトン (875) + TX、アミトンシュウ酸水素塩 (875) + T
 X、アミトラズ (24) + TX、アナバシン (877) + TX、アチダチオン (883)
 + TX、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) +
 TX、アザジラクチン (41) + TX、アザメチホス (42) + TX、アジンホス - エチ
 ル (44) + TX、アジンホス - メチル (45) + TX、アゾトエート (889) + TX
 、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デル
 タエンドトキシン (52) + TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム [CCN] + TX、多
 硫化バリウム (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (892) + TX、バルトリ
 ン [CCN] + TX、Bayer 22 / 190 (開発コード) (893) + TX、Bayer 22408 (開発コード) (894) + TX、ベンジ
 オカルブ (58) + TX、ベン
 フラカルブ (60) + TX、ベンスルタップ (66) + TX、 - シフルトリン (19
 4) + TX、 - シペルメトリン (203) + TX、ピフェントリン (76) + TX、ピ
 オアレトリン (78) + TX、ピオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (79) + T
 X、ピオエタノメトリン [CCN] + TX、ピオペルメトリン (908) + TX、ピオレ
 スメトリン (80) + TX、ビス (2 - クロロエチル) エーテル (IUPAC 名) (90
 9) + TX、ピストリフルロン (83) + TX、ハウ砂 (86) + TX、プロフェンバレ
 レート + TX、プロムフェンビンホス (914) + TX、プロモシクレン (918) + T
 X、プロモ - DDT [CCN] + TX、プロモホス (920) + TX、プロモホス - エチ
 ル (921) + TX、プフェンカルブ (924) + TX、ププロフェジン (99) + TX
 、ブタカルブ (926) + TX、ブタチオホス (927) + TX、ブトカルボキシム (1
 03) + TX、ブトネート (932) + TX、ブトキシカルボキシム (104) + TX、
 プチルピリダベン + TX、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + T
 X、シアン化カルシウム (444) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC 名) (111
) + TX、カンフェクロル (941) + TX、カーバノレート (943) + TX、カルバ
 リル (115) + TX、カルボフラン (118) + TX、二硫化炭素 (IUPAC / ケミ
 カルアブストラクツ名) (945) + TX、四塩化炭素 (IUPAC 名) (946) + T
 X、カルボフェノチオン (947) + TX、カルボスルファン (119) + TX、カルタ
 ップ (123) + TX、カルタップ塩酸塩 (123) + TX、セバジン (725) + TX
 、クロルビシクレン (960) + TX、クロルダン (128) + TX、クロルデコン (9
 63) + TX、クロルジメホルム (964) + TX、クロルジメホルム塩酸塩 (964)

10

20

30

40

50

+ TX、クロルエトキシホス(129)+TX、クロルフェナビル(130)+TX、クロルフェンビンホス(131)+TX、クロルフルアズロン(132)+TX、クロルメホス(136)+TX、クロロホルム[CCN]+TX、クロロピクリン(141)+TX、クロルホキシム(989)+TX、クロルブラゾホス(990)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、クロマフェノジド(150)+TX、シネリンI(696)+TX、シネリンII(696)+TX、シネリン(696)+TX、シス-レスメトリン+TX、シスメトリン(80)+TX、クロシトリン+TX、クロエトカルブ(999)+TX、クロサンテル[CCN]+TX、クロチアニジン(165)+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、ヒ酸銅[CCN]+TX、オレイン酸銅[CCN]+TX、クマホス(174)+TX、クミトエート(1006)+TX、クロタミトン[CCN]+TX、クロトキシホス(1010)+TX、クルホマート(1011)+TX、氷晶石(177)+TX、CS 708(開発コード)(1012)+TX、シアノフェンホス(1019)+TX、シアノホス(184)+TX、シアントエート(1020)+TX、シクレトリン[CCN]+TX、シクロプロトリン(188)+TX、シフルトリン(193)+TX、シハロトリン(196)+TX、シベルメトリン(201)+TX、シフェノトリン(206)+TX、シロマジン(209)+TX、サイチオアート[CCN]+TX、d-リモネン[CCN]+TX、d-テトラメトリン(788)+TX、DAEP(1031)+TX、ダゾメット(216)+TX、DDT(219)+TX、デカルボフラン(1034)+TX、デルタメトリン(223)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-O(1037)+TX、デメフィオン-S(1037)+TX、デメトン(1038)+TX、デメトン-メチル(224)+TX、デメトン-O(1038)+TX、デメトン-O-メチル(224)+TX、デメトン-S(1038)+TX、デメトン-S-メチル(224)+TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039)+TX、ジアフェンチウロン(226)+TX、ジアリホス(1042)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジアジノン(227)+TX、ジカプチオン(1050)+TX、ジクロフェンチオン(1051)+TX、ジクロルボス(236)+TX、ジクリホス+TX、ジクレシル[CCN]+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジシクラニル(244)+TX、ジエルドリン(1070)+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート(IUPAC名)(1076)+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジロール[CCN]+TX、ジメフルトリン[CCN]+TX、ジメホックス(1081)+TX、ジメタン(1085)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジメトリン(1083)+TX、ジメチルビンホス(265)+TX、ジメチラン(1086)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクス-ジクレキシシ(1089)+TX、ジノプロブ(1093)+TX、ジノサム(1094)+TX、ジノセブ(1095)+TX、ジノテフラン(271)+TX、ジオフェノラン(1099)+TX、ジオキサベンゾホス(1100)+TX、ジオキサカルブ(1101)+TX、ジオキサチオン(1102)+TX、ジスルホトン(278)+TX、ジチクロホス(1108)+TX、DNOC(282)+TX、ドラメクチン[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エクジステロン[CCN]+TX、EI 1642(開発コード)(1118)+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチン安息香酸塩(291)+TX、EMPC(1120)+TX、エンペントリン(292)+TX、エンドスルファン(294)+TX、エンドチオン(1121)+TX、エンドリン(1122)+TX、EPBP(1123)+TX、EPN(297)+TX、エポフェノナン(1124)+TX、エプリノメクチン[CCN]+TX、エスフェンバレレート(302)+TX、エタホス[CCN]+TX、エチオフェンカルブ(308)+TX、エチオン(309)+TX、エチプロール(310)+TX、エトエート-メチル(1134)+TX、エトプロホス(312)+TX、ギ酸エチル(IUPAC名)[CCN]+TX、エチル-DDD(1056)+TX、二臭化エチレン(316)+TX、二塩化エチレン(化学名)(1136)+TX、エチレンオキシド[CCN]+TX、エトフェンブロックス(319)+TX、エトリ

10

20

30

40

50

ムホス(1142)+TX、EXD(1143)+TX、ファンファー(323)+TX、
 フェナミホス(326)+TX、フェナザフロル(1147)+TX、フェンクロルホ
 ス(1148)+TX、フェネタカルブ(1149)+TX、フェンフルトリン(115
 0)+TX、フェニトロチオン(335)+TX、フェノブカルブ(336)+TX、フ
 ェノキサクリム(1153)+TX、フェノキシカルブ(340)+TX、フェンピリト
 リン(1155)+TX、フェンプロパトリン(342)+TX、フェンピラド+TX、
 フェンスルホチオン(1158)+TX、フェンチオン(346)+TX、フェンチオン
 -エチル[CCN]+TX、フェンバレレート(349)+TX、フィプロニル(354
)+TX、フロニカミド(358)+TX、フルベンジアミド(CAS登録番号:272
 451-65-7)+TX、フルコフロニル(1168)+TX、フルシクロクスロン(3
 66)+TX、フルシトリネート(367)+TX、フルエネチル(1169)+TX、
 フルフェネリム[CCN]+TX、フルフェノクスロン(370)+TX、フルフェンブ
 ロックス(1171)+TX、フルメトリン(372)+TX、フルバリネート(118
 4)+TX、FMC 1137(開発コード)(1185)+TX、ホノホス(1191
)+TX、ホルメタネート(405)+TX、塩酸ホルメタネート(405)+TX、ホ
 ルモチオン(1192)+TX、ホルムパラネート(1193)+TX、ホスメチラン(1
 194)+TX、ホスピレート(1195)+TX、ホスチアゼート(408)+TX

10

、
 ホスチエタン(1196)+TX、フラチオカルブ(412)+TX、フレトリン(12
 00)+TX、 -シハロトリン(197)+TX、 -HCH(430)+TX、グア
 ザチン(422)+TX、酢酸グアザチン(422)+TX、GY-81(開発コード)
 (423)+TX、ハルフェンブロックス(424)+TX、ハロフェノジド(425)
 +TX、HCH(430)+TX、HEOD(1070)+TX、ヘプタクロル(121
 1)+TX、ヘプテノホス(432)+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヘキサフル
 ムロン(439)+TX、HHDN(864)+TX、ヒドラメチルノン(443)+TX
 X、シアン化水素(444)+TX、ハイドロブレン(445)+TX、ヒキンカルブ(1
 223)+TX、イミダクロプリド(458)+TX、イミプロトリン(460)+TX
 X、インドキサカルブ(465)+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX
 X、IPSP(1229)+TX、イサゾホス(1231)+TX、イソベンザン(12
 32)+TX、イソカルボホス(473)+TX、イソドリル(1235)+TX、イソ
 フェンホス(1236)+TX、イソラン(1237)+TX、イソプロカルブ(472
)+TX、イソプロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPA
 C名)(473)+TX、イソプロチオラン(474)+TX、イソチオエート(124
 4)+TX、イソキサチオン(480)+TX、イベルメクチン[CCN]+TX、ジャ
 スモリンI(696)+TX、ジャスモリンII(696)+TX、ヨードフェンホス(1
 248)+TX、幼若ホルモンI[CCN]+TX、幼若ホルモンII[CCN]+TX
 X、幼若ホルモンIII[CCN]+TX、ケレバン(1249)+TX、キノブレン(4
 84)+TX、 -シハロトリン(198)+TX、ヒ酸鉛[CCN]+TX、レビメ
 クチン(CCN)+TX、レプトホス(1250)+TX、リンダン(430)+TX、
 リリムホス(1251)+TX、ルフェヌロン(490)+TX、リチダチオン(125
 3)+TX、m-クメニルメチルカルバメート(IUPAC名)(1014)+TX、リン
 化マグネシウム(IUPAC名)(640)+TX、マラチオン(492)+TX、マ
 ロノベン(1254)+TX、マジドックス(1255)+TX、メカルバム(502)
 +TX、メカルフォン(1258)+TX、メナゾン(1260)+TX、メホスホラン
 (1261)+TX、塩化第一水銀(513)+TX、メスルフェンホス(1263)+TX
 X、メタフルミゾン(CCN)+TX、メタム(519)+TX、メタム-カリウム(5
 19)+TX、メタム-ナトリウム(519)+TX、メタクリホス(1266)+TX
 X、メタミドホス(527)+TX、フッ化メタンスルホニル(IUPAC/ケミカルア
 プストラクツ名)(1268)+TX、メチダチオン(529)+TX、メチオカルブ(5
 30)+TX、メトクロトホス(1273)+TX、メトミル(531)+TX、メト

20

30

40

50

プレン(532)+TX、メトキン-ブチル(1276)+TX、メトトリン(533)+TX、メトキシクロル(534)+TX、メトキシフェノジド(535)+TX、臭化メチル(537)+TX、メチルイソチオシアネート(543)+TX、メチルクロロホルム[CCN]+TX、塩化メチレン[CCN]+TX、メトフルトリン[CCN]+TX、メトルカルブ(550)+TX、メトキサジアゾン(1288)+TX、メビンホス(556)+TX、メキサカルベート(1290)+TX、ミルベメクチン(557)+TX、ミルベマイシンオキシム[CCN]+TX、ミパホックス(1293)+TX、ミレックス(1294)+TX、モノクロトホス(561)+TX、モルホチオン(1300)+TX、モキシデクチン[CCN]+TX、ナフタロホス[CCN]+TX、ナレド(567)+TX、ナフタレン(IUPAC/ケミカルアブストラクツ名)(1303)+TX、NC-170(開発コード)(1306)+TX、NC-184(化合物コード)+TX、ニコチン(578)+TX、硫酸ニコチン(578)+TX、ニフルリジド(1309)+TX、ニテンピラム(579)+TX、ニチアジン(1311)+TX、ニトリラカルブ(1313)+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313)+TX、NNI-0101(化合物コード)+TX、NNI-0250(化合物コード)+TX、ノルニコチン(慣用名)(1319)+TX、ノバルロン(585)+TX、ノビフルムロン(586)+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057)+TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1074)+TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075)+TX、O,O,O',O'-テトラブロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424)+TX、オレイン酸(IUPAC名)(593)+TX、オメトエート(594)+TX、オキサミル(602)+TX、オキシデメトン-メチル(609)+TX、オキシデプロホス(1324)+TX、オキシジスルホトン(1325)+TX、pp'-DDT(219)+TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN]+TX、パラチオン(615)+TX、パラチオン-メチル(616)+TX、ペンフルロン[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623)+TX、ペルメトリン(626)+TX、石油(628)+TX、PH 60-38(開発コード)(1328)+TX、フェンカプトン(1330)+TX、フェノトリン(630)+TX、フェントエート(631)+TX、ホレート(636)+TX、ホサロン(637)+TX、ホスホラン(1338)+TX、ホスメット(638)+TX、ホスニクロール(1339)+TX、ホスファミドン(639)+TX、ホスフィン(IUPAC名)(640)+TX、ホキシム(642)+TX、ホキシム-メチル(1340)+TX、ピリメタホス(1344)+TX、ピリミカルブ(651)+TX、ピリミホス-エチル(1345)+TX、ピリミホス-メチル(652)+TX、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346)+TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347)+TX、亜ヒ酸カリウム[CCN]+TX、カリウムチオシアネート[CCN]+TX、ブラレトリン(655)+TX、プレコセンI[CCN]+TX、プレコセンII[CCN]+TX、プレコセンIII[CCN]+TX、プリミドホス(1349)+TX、プロフェノホス(662)+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル(1354)+TX、プロメカルブ(1355)+TX、プロパホス(1356)+TX、プロベタンホス(673)+TX、プロボクサー(678)+TX、プロチダチオン(1360)+TX、プロチオホス(686)+TX、プロトエート(1362)+TX、プロトリフエンビュート[CCN]+TX、ピメトロジン(688)+TX、ピラクロホス(689)+TX、ピラゾホス(693)+TX、ピレスメトリン(1367)+TX、ピレトリンI(696)+TX、ピレトリンII(696)+TX、ピレトリン(696)+TX、ピリダベン(699)+TX、ピリダリル(700)+TX、ピリダフェンチオン(701)+TX、ピリミジフェン(706)+TX、ピリミテート(1370)+TX、ピリプロキシフェン(708)+TX、クアッシア[CCN]+TX、キナルホス(711

10

20

30

40

50

) + TX、キナルホス - メチル (1 3 7 6) + TX、キノチオン (1 3 8 0) + TX、キンチオキス (1 3 8 1) + TX、R - 1 4 9 2 (開発コード) (1 3 8 2) + TX、ラフォキサニド [C C N] + TX、レスメトリン (7 1 9) + TX、ロテノン (7 2 2) + TX、RU 1 5 5 2 5 (開発コード) (7 2 3) + TX、RU 2 5 4 7 5 (開発コード) (1 3 8 6) + TX、リアニア (1 3 8 7) + TX、リアノジン (慣用名) (1 3 8 7) + TX、サバジラ (7 2 5) + TX、シュラーダン (1 3 8 9) + TX、セブホス + TX、セラメクチン [C C N] + TX、SI - 0 0 0 9 (化合物コード) + TX、SI - 0 2 0 5 (化合物コード) + TX、SI - 0 4 0 4 (化合物コード) + TX、SI - 0 4 0 5 (化合物コード) + TX、シラフルオフエン (7 2 8) + TX、SN 7 2 1 2 9 (開発コード) (1 3 9 7) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [C C N] + TX、シアン化ナトリウム (4 4 4) + TX、フッ化ナトリウム (IUPAC / ケミカルアブストラクツ名) (1 3 9 9) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム (1 4 0 0) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (6 2 3) + TX、セレン酸ナトリウム (IUPAC 名) (1 4 0 1) + TX、ナトリウムチオシアネート [C C N] + TX、ソファミド (1 4 0 2) + TX、スピノサド (7 3 7) + TX、スピロメシフェン (7 3 9) + TX、スピロテトラマト (C C N) + TX、スルコフロニ (7 4 6) + TX、スルコフロニ - ナトリウム (7 4 6) + TX、スルフルアミド (7 5 0) + TX、スルホテップ (7 5 3) + TX、フッ化スルフルリル (7 5 6) + TX、スルプロオス (1 4 0 8) + TX、タール油 (7 5 8) + TX、フルバリネート (3 9 8) + TX、タジムカルブ (1 4 1 2) + TX、TDE (1 4 1 4) + TX、テブフェノジド (7 6 2) + TX、テブフェンピラド (7 6 3) + TX、テブピリムホス (7 6 4) + TX、テフルベンズロン (7 6 8) + TX、テフルトリリン (7 6 9) + TX、テメホス (7 7 0) + TX、TEPP (1 4 1 7) + TX、テラレトリリン (1 4 1 8) + TX、テルバム + TX、テルブホス (7 7 3) + TX、テトラクロロエタン [C C N] + TX、テトラクロロルピンホス (7 7 7) + TX、テトラメトリン (7 8 7) + TX、シペルメトリン (2 0 4) + TX、チアクロプリド (7 9 1) + TX、チアフェノックス + TX、チアメトキサム (7 9 2) + TX、チクロホス (1 4 2 8) + TX、チオカルボキシム (1 4 3 1) + TX、チオシクラム (7 9 8) + TX、チオシクラムシュウ酸水素塩 (7 9 8) + TX、チオジカルブ (7 9 9) + TX、チオフアノックス (8 0 0) + TX、チオメトン (8 0 1) + TX、チオナジン (1 4 3 4) + TX、チオスルタップ (8 0 3) + TX、チオスルタップ - ナトリウム (8 0 3) + TX、ツリンギエンシン [C C N] + TX、トルフェンピラド (8 0 9) + TX、トラロメトリン (8 1 2) + TX、トランスフルトリリン (8 1 3) + TX、トランスペルメトリン (1 4 4 0) + TX、トリアミホス (1 4 4 1) + TX、トリアザメート (8 1 8) + TX、トリアゾホス (8 2 0) + TX、トリアズロン + TX、トリクロロホン (8 2 4) + TX、トリクロルメタホス - 3 [C C N] + TX、トリクロロナート (1 4 5 2) + TX、トリフェノホス (1 4 5 5) + TX、トリフルムロン (8 3 5) + TX、トリメタカルブ (8 4 0) + TX、トリブレン (1 4 5 9) + TX、バミドチオン (8 4 7) + TX、パニリプロール [C C N] + TX、ベラトリジン (7 2 5) + TX、ベラトリリン (7 2 5) + TX、XMC (8 5 3) + TX、キシリルカルブ (8 5 4) + TX、YI - 5 3 0 2 (化合物コード) + TX、シペルメトリン (2 0 5) + TX、ゼタメトリン (z e t a m e t h r i n) + TX、リン化亜鉛 (6 4 0) + TX、ゾラプロホス (1 4 6 9) および ZXI 8 9 0 1 (開発コード) (8 5 8) + TX、シアントラニリプロール [7 3 6 9 9 4 - 6 3 - 1 9 + TX、クロルアントラニリプロール [5 0 0 0 0 8 - 4 5 - 7] + TX、シエノピラフェン [5 6 0 1 2 1 - 5 2 - 0] + TX、シフルメトフェン [4 0 0 8 8 2 - 0 7 - 7] + TX、ピリフルキナゾン [3 3 7 4 5 8 - 2 7 - 2] + TX、スピネトラム [1 8 7 1 6 6 - 4 0 - 1 + 1 8 7 1 6 6 - 1 5 - 0] + TX、スピロテトラマト [2 0 3 3 1 3 - 2 5 - 1] + TX、スルホキサフロール [9 4 6 5 7 8 - 0 0 - 3] + TX、フルフィプロール [7 0 4 8 8 6 - 1 8 - 0] + TX、メペルフルトリリン [9 1 5 2 8 8 - 1 3 - 0] + TX、テトラメチルフルトリリン [8 4 9 3 7 - 8 8 - 2] + TX、トリ

10

20

30

40

50

フルメゾピリム（国際公開第2012/092115号に開示される）+TXからなる物質の群から選択される殺虫剤、

ビス（トリブチルスズ）オキシド（IUPAC名）（913）+TX、プロモアセトアミド[CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ（999）+TX、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅（172）+TX、フェンチン（347）+TX、リン酸第二鉄（IUPAC名）（352）+TX、メタアルデヒド（518）+TX、メチオカルブ（530）+TX、ニクロサミド（576）+TX、ニクロサミド-オールアミン（576）+TX、ペンタクロロフェノール（623）+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド（623）+TX、タジムカルブ（1412）+TX、チオジカルブ（799）+TX、酸化トリブチルスズ（913）+TX、トリフェンモルフ（1454）+TX、トリメタカルブ（840）+TX、酢酸トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）および水酸化トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）+TX、ピリプロール[394730-71-3]+TX、フルキサメタミド（国際公開第2007/026965号）+TXからなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、

AKD-3088（化合物コード）+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン（IUPAC/ケミカルアブストラクツ名）（1045）+TX、1,2-ジクロロプロパン（IUPAC/ケミカルアブストラクツ名）（1062）+TX、1,2-ジクロロプロパンおよび1,3-ジクロロプロペン（IUPAC名）（1063）+TX、1,3-ジクロロプロペン（233）+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフェン1,1-ジオキシド（IUPAC/ケミカルアブストラクツ名）（1065）+TX、3-（4-クロロフェニル）-5-メチルローダニン（IUPAC名）（980）+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸（IUPAC名）（1286）+TX、6-イソペンテニルアミノプリン（210）+TX、アバメクチン（1）+TX、アセトプロール[CCN]+TX、アラニカルブ（15）+TX、アルジカルブ（16）+TX、アルドキシカルブ（863）+TX、AZ 60541（化合物コード）+TX、ベンクロチアズ[CCN]+TX、ベノミル（62）+TX、ブチルピリダベン+TX、カズサホス（109）+TX、カルボフラン（118）+TX、二硫化炭素（945）+TX、カルボスルファン（119）+TX、クロロピクリン（141）+TX、クロルピリホス（145）+TX、クロエトカルブ（999）+TX、サイトカイニン（210）+TX、ダゾメット（216）+TX、DBCP（1045）+TX、DCIP（218）+TX、ジアミダホス（1044）+TX、ジクロフェンチオン（1051）+TX、ジクリホス+TX、ジメトエート（262）+TX、ドラメクチン[CCN]+TX、エマメクチン（291）+TX、エマメクチン安息香酸塩（291）+TX、エプリノメクチン[CCN]+TX、エトプロホス（312）+TX、二臭化エチレン（316）+TX、フェナミホス（326）+TX、フェンピラド+TX、フェンスルホチオン（1158）+TX、ホスチアゼート（408）+TX、ホスチエタン（1196）+TX、フルフラール[CCN]+TX、GY-81（開発コード）（423）+TX、ヘテロホス[CCN]+TX、ヨードメタン（IUPAC名）（542）+TX、イサミドホス（1230）+TX、イサゾホス（1231）+TX、イベルメクチン[CCN]+TX、キネチン（210）+TX、メカルフォン（1258）+TX、メタム（519）+TX、メタム-カリウム（519）+TX、メタム-ナトリウム（519）+TX、臭化メチル（537）+TX、メチルイソチオシアネート（543）+TX、ミルベマイシンオキシム[CCN]+TX、モキシデクチン[CCN]+TX、クワ暗斑病菌（*Myrothecium verrucaria*）組成物（565）+TX、NC-184（化合物コード）+TX、オキサミル（602）+TX、ホレート（636）+TX、ホスファミドン（639）+TX、ホスホカルブ[CCN]+TX、セブホス+TX、セラメクチン[CCN]+TX、スピノサド（737）+TX、テルバム+TX、テルブホス（773）+TX、テトラクロロチオフェン（IUPAC/ケミカルアブストラクツ名）（1422）+TX、チアフェノックス+TX、チオナジン（1434）+TX、トリアゾホス（820）+TX、トリアズロン+TX、キシレノール[CCN]+TX、YI-53

10

20

30

40

50

02 (化合物コード) およびゼアチン (210) + TX、フルエンシルホン [318290 - 98 - 1] + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤、

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

アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル - S - メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) およびオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、

2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (748) + TX、
- クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX
、アンチュ (*ant u*) (880) + TX、三酸化二ヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、プロディファコウム (89) + TX、プロマジオロン (91) + TX、プロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、コレカルシフェロール (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、
- HCH (430) + TX、HCH
(430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC 名) (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、ホサセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC 名) (640) + TX、リン [CCN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリヌロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) + TX、ストリキニーネ (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン (851) およびリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、

2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC 名) (934) + TX、5 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン (IUPAC 名) (903) + TX、ファルネソールおよびネロリドール (324) + TX、MB - 599 (開発コード) (498) + TX、MGK 264 (開発コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1343) + TX、プロピル異性体 (1358) + TX、S421 (開発コード) (724) + TX、セサメクス (1393) + TX、セサモリン (1394) およびスルホキシド (1406) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、

アントラキノン (32) + TX、クロラロース (127) + TX、ナフテン酸銅 [CCN] + TX、オキシ塩化銅 (171) + TX、ジアジノン (227) + TX、ジシクロペンタジエン (化学名) (1069) + TX、グアザチン (422) + TX、酢酸グアザチン (422) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ピリジン - 4 - アミン (IUPAC 名) (23) + TX、チラム (804) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、ナフテン酸亜鉛 [CCN] およびジラム (856) + TX からなる物質の群から選択される動物忌避剤、

イマニン [CCN] およびリバピリン [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、

酸化第二水銀 (512) + TX、オクチリノン (590) およびチオフアネート - メチル (802) + TX からなる物質の群から選択される傷保護剤、

ならびにアザコナゾール (60207 - 31 - 0) + TX、ピテルタノール [70585 - 36 - 3] + TX、プロムコナゾール [116255 - 48 - 2] + TX、シブロコ

10

20

30

40

50

ナゾール [9 4 3 6 1 - 0 6 - 5] + T X、ジフェノコナゾール [1 1 9 4 4 6 - 6 8 - 3] + T X、ジニコナゾール [8 3 6 5 7 - 2 4 - 3] + T X、エポキシコナゾール [1 0 6 3 2 5 - 0 8 - 0] + T X、フェンブコナゾール [1 1 4 3 6 9 - 4 3 - 6] + T X、フルキンコナゾール [1 3 6 4 2 6 - 5 4 - 5] + T X、フルシラゾール [8 5 5 0 9 - 1 9 - 9] + T X、フルトリアホール [7 6 6 7 4 - 2 1 - 0] + T X、ヘキサコナゾール [7 9 9 8 3 - 7 1 - 4] + T X、イマザリル [3 5 5 5 4 - 4 4 - 0] + T X、イミベンコナゾール [8 6 5 9 8 - 9 2 - 7] + T X、イブコナゾール [1 2 5 2 2 5 - 2 8 - 7] + T X、メトコナゾール [1 2 5 1 1 6 - 2 3 - 6] + T X、ミクロブタニル [8 8 6 7 1 - 8 9 - 0] + T X、ペフラゾエート [1 0 1 9 0 3 - 3 0 - 4] + T X、ペンコナゾール [6 6 2 4 6 - 8 8 - 6] + T X、プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8 - 7 0 - 6] + T X、ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + T X、プロクロラズ [6 7 7 4 7 - 0 9 - 5] + T X、プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + T X、シメコナゾール [1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + T X、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3] + T X、テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + T X、トリアジメホン [4 3 1 2 1 - 4 3 - 3] + T X、トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + T X、トリフルミゾール [9 9 3 8 7 - 8 9 - 0] + T X、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7] + T X、アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + T X、フェナリモル [6 0 1 6 8 - 8 8 - 9] + T X、ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + T X、ブピリメート [4 1 4 8 3 - 4 3 - 6] + T X、ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + T X、エチリモル [2 3 9 4 7 - 6 0 - 6] + T X、ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + T X、フェンブプロピジン [6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + T X、フェンブプロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1 - 4] + T X、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + T X、トリデモルフ [8 1 4 1 2 - 4 3 - 3] + T X、シブロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + T X、メパニピリム [1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7] + T X、ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + T X、フェンピクロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + T X、フルジオキサニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1] + T X、ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + T X、フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + T X、メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + T X、R - メタラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + T X、オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + T X、オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3] + T X、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + T X、カルベンダジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + T X、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + T X、フベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + T X、チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8] + T X、クロゾリネート [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + T X、ジクロゾリン [2 4 2 0 1 - 5 8 - 9] + T X、イブプロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + T X、マイクロゾリン [5 4 8 6 4 - 6 1 - 8] + T X、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + T X、ピンクロゾリン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + T X、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + T X、カルボキシシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + T X、フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] + T X、フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + T X、メプロニル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + T X、オキシカルボキシシン [5 2 5 9 - 8 8 - 1] + T X、ペンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + T X、チフルザミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7] + T X、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + T X、ドジン [2 4 3 9 - 1 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + T X、イミノクタジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3] + T X、アゾキシストロピン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8] + T X、ジモキシストロピン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + T X、エネステロブリン { P r o c . B C P C , I n t . C o n g r . , G l a s g o w , 2 0 0 3 , 1 , 9 3 } + T X、フルオキサストロピン [3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + T X、クレソキシム - メチル [1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0] + T X、メトミノストロピン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] + T X、トリフロキシストロピン [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + T X、オリザストロピン [2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + T X、ピコキシストロピン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + T X、ピラクロストロピン [1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + T X、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + T X、マンコゼブ [8 0 1 8 - 0 1 - 7] + T X、マネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + T X、メチラム [9

0 0 6 - 4 2 - 2] + T X、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + T X、チラム [1 3
 7 - 2 6 - 8] + T X、ジネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + T X、ジラム [1 3 7 - 3 0
 - 4] + T X、カプタホール [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + T X、カプタン [1 3 3 - 0 6 -
 2] + T X、ジクロフルアニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + T X、フルオロイミド [4 1 2
 0 5 - 2 1 - 4] + T X、ホルベット [1 3 3 - 0 7 - 3] + T X、トリルフルアニド [7 3 1 - 2 7 - 1] + T X、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + T X、水酸化銅 [2 0
 4 2 7 - 5 9 - 2] + T X、オキシ塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + T X、硫酸銅 [7 7
 5 8 - 9 8 - 7] + T X、酸化銅 [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + T X、マンコッパー (man
 copper) [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + T X、オキシ銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6]
 + T X、ジノカップ [1 3 1 - 7 2 - 6] + T X、ニトロタール - イソプロピル [1 0 5
 5 2 - 7 4 - 6] + T X、エジフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + T X、イプロベン
 ホス [2 6 0 8 7 - 4 7 - 8] + T X、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] + T
 X、ホスジフェン [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + T X、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 - 6
] + T X、トルクロホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + T X、アシベンゾラル - S
 - メチル [1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2] + T X、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + T X、
 ベンチアバリカルブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + T X、プラストサイジン - S [2 0 7
 9 - 0 0 - 7] + T X、キノメチオナト [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + T X、クロロネブ [2
 6 7 5 - 7 7 - 6] + T X、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + T X、シフルフェ
 ナミド [1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3] + T X、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] + T
 X、ジクロロ [1 1 7 - 8 0 - 6] + T X、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4]
 + T X、ジクロメジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + T X、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9]
 + T X、ジエトフェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + T X、ジメトモルフ [1 1 0 4
 8 8 - 7 0 - 5] + T X、S Y P - L I 9 0 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9]
 + T X、ジチアノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + T X、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7 7
 - 3] + T X、エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 - 9] + T X、ファモキサドン [1 3
 1 8 0 7 - 5 7 - 3] + T X、フェナミドン [1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + T X、フェノ
 キサニル [1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + T X、フェンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + T X、
 フェリムゾン [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + T X、フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6]
 + T X、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7] + T X、フルスルファミド [1 0 6
 9 1 7 - 5 2 - 6] + T X、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + T X、ホセ
 チル - アルミニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + T X、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 - 4
 4 - 1] + T X、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7] + T X、I K F - 9 1 6
 (シアゾファミド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] + T X、カスガマイシン [6 9 8 0 - 1
 8 - 3] + T X、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2 - 4 9 - 6] + T X、メトラフェノン [2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6] + T X、ペンシクロン [6 6 0 6 3 - 0 5 - 6] + T X、フタ
 リド [2 7 3 5 5 - 2 2 - 2] + T X、ポリオキシシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7] + T X、
 プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 - 1] + T X、プロパモカルブ [2 5 6 0 6 - 4 1 -
 1] + T X、プロキンアジド [1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4] + T X、ピロキロン [5 7 3 6
 9 - 3 2 - 1] + T X、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] + T X、キントゼン
 [8 2 - 6 8 - 8] + T X、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + T X、チアジニル [2 2 3 5
 8 0 - 5 1 - 6] + T X、トリアゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + T X、トリシクラ
 ゴール [4 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + T X、トリホリン [2 6 6 4 4 - 4 6 - 2] + T X、
 バリダマイシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + T X、ゾキサミド (R H 7 2 8 1) [1 5 6
 0 5 2 - 6 8 - 5] + T X、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + T X、イソ
 ピラザム [8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1] + T X、セダキサン [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6] +
 T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 - ジ
 クロロメチレン - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノ - ナフタレン - 5 - イ
 ル) - アミド (国際公開第 2 0 0 7 / 0 4 8 5 5 6 号に開示される) + T X、3 - ジフル
 オロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (3', 4', 5' - トリ
 フルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド (国際公開第 2 0 0 6 / 0 8 7 3 4 3 号に開

10

20

30

40

50

示される) + TX、[(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル) オキシ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6a, 12b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H, 11Hナフト[2, 1 - b]ピラノ[3, 4 - e]ピラン - 4 - イル]メチル - シクロプロパンカルボキシレート[915972 - 17 - 7] + TXおよび1, 3, 5 - トリメチル - N - (2 - メチル - 1 - オキソプロピル) - N - [3 - (2 - メチルプロピル) - 4 - [2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル]フェニル] - 1H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド[926914 - 55 - 8] + TX、フルフィプロール[704886 - 18 - 0] + TX、シクラニリプロール[1031756 - 98 - 5] + TX、テトラニリプロール[1229654 - 66 - 3] + TX、グアジピル(guadipyr)(国際公開第2010/060231号に記載される) + TXおよびシクロキサプリド(cycloxa prid)(国際公開第2005/077934号に記載される) + TXからなる物質の群から選択される生物学的に活性な化合物; および

以下のものを含む微生物(microbials): アシネトバクター・ルオフィイ(Acinetobacter lwoffii) + TX、アクレモニウム・アルタナツム(Acremonium alternatum) + TX + TX、アクレモニウム・セファロスפורウム(Acremonium cephalosporium) + TX + TX、アクレモニウム・ディオスピリ(Acremonium diospyri) + TX、アクレモニウム・オブクラバツム(Acremonium obclavatum) + TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス(Adoxophyes orana granulovirus)(AdoxGV)(Capex(登録商標)) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター(Agrobacterium radiobacter)菌株K84(Galltrol - A(登録商標)) + TX、アルテルナリア・アルテルナータ(Alternaria alternate) + TX、アルテルナリア・カシアエ(Alternaria cassia) + TX、アルテルナリア・デストルエンズ(Alternaria destruens)(Smolder(登録商標)) + TX、アンペロマイセス・キスカリス(Ampelomyces quisqualis)(AQ10(登録商標)) + TX、アスペルギルス・フラブス(Aspergillus flavus)AF36(AF36(登録商標)) + TX、アスペルギルス・フラブス(Aspergillus flavus)NRRL 21882(Aflaguard(登録商標)) + TX、アスペルギルス属(Aspergillus spp.) + TX、アウレオバシジウム・プルランス(Aureobasidium pullulans) + TX、アゾスピリillum属(Azospirillum) + TX、(MicroAZ(登録商標)) + TX、TAZO B(登録商標)) + TX、アゾトバクター属(Azotobacter) + TX、アゾトバクター・クロオコッカム(Azotobacter chroococcum)(Azotomeal(登録商標)) + TX、アゾトバクター(Azotobacter)シスト(cyst)(Bionatural Blooming Blossoms(登録商標)) + TX、バチルス・アミロリケファシエンズ(Bacillus amyloliquefaciens) + TX、セレウス菌(Bacillus cereus) + TX、バチルス・キチノスポルス(Bacillus chitinosporus)菌株CM - 1 + TX、バチルス・キチノスポルス(Bacillus chitinosporus)菌株AQ746 + TX、バチルス・リケニフォルミス(Bacillus licheniformis)菌株HB - 2(Biostart(商標)Rhizoboost(登録商標)) + TX、バチルス・リケニフォルミス(Bacillus licheniformis)菌株3086(EcoGuard(登録商標)) + TX、Green Releaf(登録商標)) + TX、バチルス・サーキュランス(Bacillus circulans) + TX、バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)(BioSafe(登録商標)、BioNem - WP(登録商標)、VOTiVO(登録商標)) + TX、バチルス・フィルムス(Bacillus fi

10

20

30

40

50

rmus) 菌株 I - 1582 + TX、バチルス・マセランス (*Bacillus macerans*) + TX、バチルス・マリスモルトウイ (*Bacillus marismortui*) + TX、バチルス・メガテリウム (*Bacillus megaterium*) + TX、バチルス・ミコイデス (*Bacillus mycooides*) 菌株 AQ726 + TX、バチルス・ポピリエ (*Bacillus papillae*) (Milky Spore Powder (登録商標)) + TX、バチルス・プミルス種 (*Bacillus pumilus* spp.) + TX、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株 GB34 (Yield Shield (登録商標)) + TX、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株 AQ717 + TX、バチルス・プミルス (*Bacillus pumilus*) 菌株 QST 2808 (Sonata (登録商標)) + TX、Ballad Plus (登録商標)) + TX、バチルス・スフェリカス (*Bacillus spahericus*) (VectoLex (登録商標)) + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ175 + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ177 + TX、バチルス属 (*Bacillus* spp.) 菌株 AQ178 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST 713 (CEASE (登録商標)) + TX、Serenade (登録商標) + TX、Rhapsody (登録商標)) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST 714 (JAZZ (登録商標)) + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 AQ153 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 AQ743 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST3002 + TX、枯草菌 (*Bacillus subtilis*) 菌株 QST3004 + TX、枯草菌変種アミロリケファシエンス (*Bacillus subtilis* var. amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Taegro (登録商標)) + TX、Rhizopro (登録商標)) + TX、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 2Ae + TX、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) Cry 1Ab + TX、バチルス・チューリゲンシス・アイザワイ (*Bacillus thuringiensis aizawai*) GC 91 (Agree (登録商標)) + TX、バチルス・チューリゲンシス・イスラエレンシス (*Bacillus thuringiensis israelensis*) (BMP123 (登録商標)) + TX、Aquabac (登録商標) + TX、VectoBac (登録商標)) + TX、バチルス・チューリゲンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) (Javelin (登録商標)) + TX、Deliver (登録商標) + TX、CryMax (登録商標) + TX、Bonide (登録商標) + TX、Scutella WP (登録商標) + TX、Turilav WP (登録商標) + TX、Astuto (登録商標) + TX、Dipel WP (登録商標) + TX、Biobit (登録商標) + TX、Foray (登録商標)) + TX、バチルス・チューリゲンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) BMP 123 (Baritone (登録商標)) + TX、バチルス・チューリゲンシス・クルスターキ (*Bacillus thuringiensis kurstaki*) HD-1 (Bioprotec-CAF/3P (登録商標)) + TX、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株 BD#32 + TX、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) 菌株 AQ52 + TX、バチルス・チューリゲンシス変種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* var. aizawai) (XenTari (登録商標)) + TX、Dipel (登録商標)) + TX、細菌種 (*bacteria* spp.) (GROWMEND (登録商標)) + TX、GROWSWEET (登録商標) + TX、Shootup (登録商標)) + TX、クラビバクター・ミシガネンシス (*Clavibacter michiganensis*) のバクテリオファージ (AgriPhage (登録商標)) + TX、Bakflor (登録商標) + TX、ビューベリ

10

20

30

40

50

ア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) (Beaugenic (登録商標) + TX、Brocaril WP (登録商標) + TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) GHA (Mycotrol ES (登録商標) + TX、Mycotrol O (登録商標) + TX、BotaniGuard (登録商標) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniartii*) (Engerlingspilz (登録商標) + TX、Schweizer Beauveria (登録商標) + TX、Melocont (登録商標) + TX、ビューベリア属 (*Beauveria* spp.) + TX、灰色かび病菌 (*Botrytis cineria*) + TX、ブラディリゾビウム・ジャポニクム (*Bradyrhizobium japonicum*) (TerraMax (登録商標) + TX、プレババチルス・ブレビス (*Brevibacillus brevis*) + TX、バチルス・チューリンゲンシス・テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis tenebrionis*) (Novodor (登録商標) + TX、BtBooster + TX、パークホルデリア・セパシア (*Burkholderia cepacia*) (Deny (登録商標) + TX、Intercept (登録商標) + TX、Blue Circle (登録商標) + TX、パークホルデリア・グラディ (*Burkholderia gladii*) + TX、パークホルデリア・グラディオリ (*Burkholderia gladioli*) + TX、パークホルデリア属 (*Burkholderia* spp.) + TX、セイヨウトゲアザミの菌 (*Canadian thistle fungus*) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標) + TX、カンジダ・ブチリ (*Candida butyri*) + TX、カンジダ・ファマータ (*Candida famata*) + TX、カンジダ・フルクタス (*Candida fructus*) + TX、カンジダ・グラブラタ (*Candida glabrata*) + TX、カンジダ・ギリエルモンディ (*Candida guilliermondii*) + TX、カンジダ・メリビオシカ (*Candida melibiosica*) + TX、カンジダ・オレオフィラ (*Candida oleophila*) 菌株 O + TX、カンジダ・パラプシロシス (*Candida parapsilosis*) + TX、カンジダ・ペリキュローザ (*Candida pelliculosa*) + TX、カンジダ・プルケリマ (*Candida pulcherrima*) + TX、カンジダ・レウカウフィ (*Candida reukaufii*) + TX、カンジダ・サイトアナ (*Candida saitoana*) (Bio-Coat (登録商標) + TX、Biocure (登録商標) + TX、カンジダ・サケ (*Candida sake*) + TX、カンジダ属 (*Candida* spp.) + TX、カンジダ・テヌイス (*Candida tenuis*) + TX、セデセア・ダビセ (*Cedecia dravisae*) + TX、セルロモナス・フラビゲナ (*Cellulomonas flavigena*) + TX、カエトミウム・コクリオイデス (*Chaetomium cochliodes*) (Nova-Cide (登録商標) + TX、カエトミウム・グロボスム (*Chaetomium globosum*) (Nova-Cide (登録商標) + TX、クロモバクテリウム・スブツガエ (*Chromobacterium subtsugae*) 菌株 PRAA 4-1T (Grandevo (登録商標) + TX、クラドスポリウム・クラドスポリオイデス (*Cladosporium cladosporioides*) + TX、クラドスポリウム・オキシスポルム (*Cladosporium oxysporum*) + TX、クラドスポリウム・クロロセファルム (*Cladosporium chlorocephalum*) + TX、クラドスポリウム属 (*Cladosporium* spp.) + TX、クラドスポリウム・テヌイシマム (*Cladosporium tenuissimum*) + TX、クロノスタキス・ロゼア (*Clonostachys rosea*) (EndoFine (登録商標) + TX、コレトトリクム・アクタータム (*Colletotrichum acutatum*) + TX、コニオチリウム・ミニタンス (*Coniothyrium minitans*) (Cotans WG (登録商標) + TX、コニオチリウム属 (Co

niothyrium spp.) + TX、クリプトコッカス・アルビダス (*Cryptococcus albidus*) (YIELDPLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカス・フミコラ (*Cryptococcus humicola*) + TX、クリプトコッカス・インフィルモ - ミニアツス (*Cryptococcus infirmominatus*) + TX、クリプトコッカス・ローレンティ (*Cryptococcus laurentii*) + TX、クリプトフレビア・レウコトレタ顆粒病ウイルス (*Cryptophlebia leucotreta granulovirus*) (*Cryptex* (登録商標)) + TX、カプリアビダス・カンピネンシス (*Cupriavidus campinensis*) + TX、コドリंगा顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (CYD-X (登録商標)) + TX、コドリंगा顆粒病ウイルス (*Cydia pomonella granulovirus*) (Madex (登録商標)) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Max / Carpovirusine (登録商標) + TX、エビコウヤクタケ (*Cylindrobasidium laeve*) (Stumpout (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (*Cylindrocladium*) + TX、デバリオマイセス・ハンセニ (*Debaryomyces hansenii*) + TX、ドレクスレラ・ハワイエンシス (*Drechslera hawaiiensis*) + TX、エンテロバクター・クロアカ (*Enterobacter cloacae*) + TX、腸内細菌科 (*Enterobacteriaceae*) + TX、エントモフトラ・ビルレンタ (*Entomophthora virulenta*) (Vektor (登録商標)) + TX、エピコッカム・ニグラム (*Epicoccum nigrum*) + TX、エピコッカム・パーパラセンス (*Epicoccum purpurascens*) + TX、エピコッカム属 (*Epicoccum* spp.) + TX、フィロバシディウム・フロリフォルム (*Filobasidium floriforme*) + TX、フザリウム・アクミナツム (*Fusarium acuminatum*) + TX、フザリウム・クラミドスポルム (*Fusarium chlamydosporum*) + TX、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) (*Fusaclean* (登録商標) / Biofox C (登録商標)) + TX、フザリウム・プロリフェラツム (*Fusarium proliferatum*) + TX、フザリウム属 (*Fusarium* spp.) + TX、ガラクトマイセス・ゲオトリスム (*Galactomyces geotrichum*) + TX、グリオクラジウム・カテヌラツム (*Gliocladium catenulatum*) (Primastop (登録商標)) + TX、Prestop (登録商標) + TX、グリオクラジウム・ロセウム (*Gliocladium roseum*) + TX、グリオクラジウム属 (*Gliocladium* spp.) (SoilGard (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (*Gliocladium virens*) (Soilgard (登録商標)) + TX、顆粒病ウイルス (*Granulovirus*) (Granupom (登録商標)) + TX、ハロバチルス・ハロフィルス (*Halobacillus halophilus*) + TX、ハロバチルス・リトラリス (*Halobacillus litoralis*) + TX、ハロバチルス・トルウエペリ (*Halobacillus trueperi*) + TX、ハロモナス属 (*Halomonas* spp.) + TX、ハロモナス・スブグラシエスコラ (*Halomonas subglaciescola*) + TX、ハロビブリオ・バリアビリス (*Halovibrio variabilis*) + TX、ハンセニアスポラ・ウバルム (*Hanseniaspora uvarum*) + TX、オオタバコガ核多角体病ウイルス (*Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus*) (*Helicovex* (登録商標)) + TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス (*Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus*) (Gemstar (登録商標)) + TX、イソフラボン - ホルモノネチン (*Myconate* (登録商標)) + TX、クロエケラ・アピキュラータ (*Kloeckera apiculata*) + TX、クロエケラ属 (*Kloeckera* spp.) + TX、ラゲニジウ

ム・ギガンテウム (*Lagenidium giganteum*) (*Laginex* (登録商標)) + TX、レカニシリウム・ロンギスポルム (*Lecanicillium longisporum*) (*Vertiblast* (登録商標)) + TX、レカニシリウム・ムスカリウム (*Lecanicillium muscarium*) (*Vertikil* (登録商標)) + TX、マイマイガ核多角体病ウイルス (*Lymantria Dispar nucleopolyhedrosis virus*) (*Disparvirus* (登録商標)) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス (*Marinococcus halophilus*) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ (*Meira geulakonigii*) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Met52* (登録商標)) + TX、メタリジウム・アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Destruxin WP* (登録商標)) + TX、メチニコピア・フルクチコラ (*Metschnikowia fruticola*) (*Shemer* (登録商標)) + TX、メチニコピア・プルケリマ (*Metschnikowia pulcherrima*) + TX、ミクロドチウム・ジメルム (*Microdochium dimerum*) (*Antibot* (登録商標)) + TX、ミクロモノスポラ・ケルレア (*Micromonospora coerulea*) + TX、ミクロスファエロプシス・オクラセ (*Microsphaeropsis ochracea*) + TX、ムスコドル・アルプス (*Muscodor albus*) 620 (*Muscudor* (登録商標)) + TX、ムスコドル・ロセウス (*Muscodor roseus*) 菌株 A3-5 + TX、ミコリザエ属 (*Mycorrhizae spp.*) (*AMykor* (登録商標)) + TX、Root Maximizer (登録商標)) + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 AARC-0255 (*DiTera* (登録商標)) + TX、BROS PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマ・ピリフェルム (*Ophiostoma piliiferum*) 菌株 D97 (*Sylvanex* (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・ファリノス (*Paecilomyces farinosus*) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (*PFR-97* (登録商標)) + TX、PreFeRal (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces linacinus*) (*Biostat WP* (登録商標)) + TX、ペシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (*MeloCon WG* (登録商標)) + TX、パエニバチルス・ポリミキサ (*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエア・アグロメラン (*Pantoea agglomerans*) (*BlightBan C9-1* (登録商標)) + TX、パントエア属 (*Pantoea spp.*) + TX、パストーリア属 (*Pasteuria spp.*) (*Econem* (登録商標)) + TX、パストーリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウム・オーランティオグリセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + TX、ペニシリウム・ビライ (*Penicillium billai*) (*Jumpstart* (登録商標)) + TX、TagTeam (登録商標)) + TX、ペニシリウム・ブレビコンパクトム (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウム・フレクエンタス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペニシリウム・ブルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属 (*Penicillium spp.*) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオプシス・ギガンテア (*Phlebiopsis gigantea*) (*Rotstop* (登録商標)) + TX、リン酸塩溶解細菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィトファトラ・クリプトゲア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトファトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (*Devine* (登録商標)) + TX、ピヒア・アノマラ (*Pichia anoma*

10

20

30

40

50

la) + TX、ピヒア・ギリエルモンディ (*Pichia guilhermondii*) + TX、ピヒア・メンブラネファシエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピヒア・オニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピヒア・スチピチス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) + TX、シュードモナス・オーレオファシエンス (*Pseudomonas aureofaciens*) (Spot-Less Biofungicide (登録商標)) + TX、シュードモナス・セパシア (*Pseudomonas cepacia*) + TX、シュードモナス・クロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*) (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナス・コルガータ (*Pseudomonas corrugate*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標)) + TX、シュードモナス・プチダ (*Pseudomonas putida*) + TX、シュードモナス・リアクタンズ (*Pseudomonas reactans*) + TX、シュードモナス属 (*Pseudomonas spp.*) + TX、シュードモナス・シリंगाエ (*Pseudomonas syringae*) (Bio-Save (登録商標)) + TX、シュードモナス・ビリジフラバ (*Pseudomonas viridiflava*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluorescens*) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマ・フロクロサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF-A22 UL (Sporodex L (登録商標)) + TX、プッシニア・カナリクラタ (*Puccinia canaliculata*) + TX、プッシニア・テラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (

Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウム・パレカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、ピシウム・オリガンドルム (*Pythium oligandrum*) (Polygandron (登録商標)) + TX、Polyversum (登録商標)) + TX、ピシウム病菌 (*Pythium periplocum*) + TX、ラーネラ・アクアティリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラーネラ属 (*Rhanelia spp.*) + TX、リゾビウム属 (*Rhizobia*) (Dormal (登録商標)) + TX、Vault (登録商標)) + TX、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) 菌株 AQ719 + TX、ロドスポリジウム・ディオボバタム (*Rhodospiridium diobovatum*) + TX、ロドスポリジウム・トルロイデス (*Rhodospiridium toruloides*) + TX、ロドトルラ属 (*Rhodotorula spp.*) + TX、ロドトルラ・グルチニス (*Rhodotorula glutinis*) + TX、ロドトルラ・グラミニス (*Rhodotorula graminis*) + TX、ロドトルラ・ムチラギノーザ (*Rhodotorula mucilagnosa*) + TX、ロドトルラ・ルブラ (*Rhodotorula rubra*) + TX、サッカロマイセス・セレビシエ (*Saccharomyces cerevisiae*) + TX、サリニコッカス・ロセウス (*Salinococcus roseus*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia minor*) (SARRITOR (登録商標)) + TX、スキタリジウム属 (*Scytalidium spp.*) + TX、スキタリジウム・ウレジニコラ (*Scytalidium uredinicola*) + TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus*) (Spod-X (登録商標)) + TX、Spexit (登録商標)) + TX、セラチア・マルセッセンズ (*Serratia marcescens*) + TX、セラチア・プリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラチア属 (*Serratia spp.*) + TX、ソルダリア・フィミコーラ (*Sordaria fimicola*) + TX、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera littoralis*

s nucleopolyhedrovirus) (Littovir (登録商標)) + TX、スポロボロマイセス・ロセウス (Sporobolomyces roseus) + TX、ステノトロホモナス・マルトフィリア (Stenotrophomonas maltophilia) + TX、ストレプトマイセス・ヒグロスコピクス (Streptomyces ahigroscopicus) + TX、ストレプトマイセス・アルバドゥンカス (Streptomyces albaduncus) + TX、ストレプトマイセス・エクスフォリエータス (Streptomyces exfoliates) + TX、ストレプトマイセス・ガルバス (Streptomyces galbus) + TX、ストレプトマイセス・グリセオプラヌス (Streptomyces griseoplanus) + TX、ストレプトマイセス・グリセオビリディス (Streptomyces griseoviridis) (Mycostop (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (Streptomyces lydicus) (Actinovate (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディカス (Streptomyces lydicus) WYEC-108 (Actinogrow (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・ビオラセウス (Streptomyces violaceus) + TX、チレチオブシス・ミノル (Tilletiopsis minor) + TX、チレチオブシス属 (Tilletiopsis spp.) + TX、トリコデルマ・アスペレルム (Trichoderma asperellum) (T34 Biocontrol (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (Trichoderma gamsii) (Tenet (登録商標)) + TX、トリコデルマ・アトリビリデ (Trichoderma atroviride) (Plantmate (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハマトム (Trichoderma hamatum) TH 382 + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム・リファイ (Trichoderma harzianum rifai) (Mycostar (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-22 (Triatum-P (登録商標)) + TX、PlantShield HC (登録商標) + TX、RootShield (登録商標) + TX、Triatum-G (登録商標) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T-39 (Trichodex (登録商標)) + TX、トリコデルマ・インハマトム (Trichoderma inhamatum) + TX、トリコデルマ・コニングイ (Trichoderma koningii) + TX、トリコデルマ属 (Trichoderma spp.) LC 52 (Sentinel (登録商標)) + TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichoderma lignorum) + TX、トリコデルマ・ロンギブラキアタム (Trichoderma longibrachiatum) + TX、トリコデルマ・ポリスポラム (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標)) + TX、トリコデルマ・タキシ (Trichoderma taxi) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (旧グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) GL-21) (SoilGuard (登録商標)) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標)) + TX、トリコスボロン・プルランス (Trichosporon pullulans) + TX、トリコスボロン属 (Trichosporon spp.) + TX、トリコセシウム属 (Trichothecium spp.) + TX、トリコセシウム・ロセウム (Trichothecium roseum) + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94671 + TX、ウロクラジウム・アトラム (Ulocladium atrum) + TX、ウロクラジウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansii) (Botry-Zen (登録商標)) + TX、トウモロコシ黒穂病菌 (Ustilago mayd

is) + TX、様々な細菌および補助微量栄養素 (Natural II (登録商標)) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標)) + TX、バーチシリウム・クラミドスポリウム (Verticillium chlamydosporium) + TX、バーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標)) + TX、Vertalec (登録商標)) + TX、Vip3Aa20 (VIPteral (登録商標)) + TX、ビルジバチルス・マリスモルツイ (Virgibacillus marismortui) + TX、キサントモナス・カムペストリス病原型ボアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標)) + TX、ゼノラブダス・ボヴィエニイ (Xenorhabdus bovienii) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィラ (Xenorhabdus nematophilus) ; および

10

以下のものを含む植物抽出物：松油 (Retenol (登録商標)) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標)) + TX、AzaGuard (登録商標) + TX、MeemAzal (登録商標) + TX、Molt-X (登録商標) + TX、植物性の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標)、Neemix (登録商標)) + TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標)) + TX、アメリカアリタソウ (Chenopodium ambrosioides near ambrosioides) (Requiem (登録商標)) + TX、キク属 (Chrysanthemum) 抽出物 (Crisant (登録商標)) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標)) + TX、シソ科植物 (Labiatae) の精油 (Botania (登録商標)) + TX、クローブローズマリーペパーミントおよびタイム油の抽出物 (Garden insect killer (登録商標)) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標)) + TX、ニンニク + TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標)) + TX、ニーム油 + TX、イヌハッカ (Nepeta cataria) (キャットニップ油) + TX、イヌハッカ (Nepeta catarina) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (MossBuster (登録商標)) + TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標)) + TX、除虫菊 + TX、シャボンノキ (Quillaja saponaria) (NemaQ (登録商標)) + TX、オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) (Regalia (登録商標)) + TX、Sakalia (登録商標)) + TX、ロテノン (Eco Roten (登録商標)) + TX、ミカン科植物 (Rutaceae) 抽出物 (Soleo (登録商標)) + TX、大豆油 (Ortho ecosense (登録商標)) + TX、ティーツリー油 (Timorex Gold (登録商標)) + TX、タイム油 + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、BugOil (登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパーミントタイムおよびシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標)) + TX、クローブローズマリーおよびペパーミント抽出物の混合物 (EF 400 (登録商標)) + TX、クローブペパーミントニンニク油およびミントの混合物 (Soil Shot (登録商標)) + TX、カオリン (Screen (登録商標)) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標)) + TX ; および

20

30

40

以下のものを含むフェロモン：クロネハイイロヒメハマキ (blackheaded fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標)) + TX、コドリंगा (Codling Moth) フェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C-Plus (登録商標)) + TX、グレープベリーモス (Grape Berry Moth) フェロモン (3M MEC-GBM Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、ハマキガ科のガ (Leafroller) フェロモン (3M MEC-LR Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、ムスカモン (Snip7 Fly Bait (登録商標)) + TX、Starbar Premium Fly Bait (登録商標)) + TX、ナシヒメシンクイ (Ori

50

ental Fruit Moth) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標)) + TX、スカシバガ科のガ (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate - P (登録商標)) + TX、トマトピンworm (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標)) + TX、Entostat 粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標)) + TX、テトラデカトリエニルアセテート + TX、13 - ヘキサデカトリエナル + TX、(E + TX, Z) - 7 + TX, 9 - ドデカジエンジエン - 1 - イルアセテート + TX、2 - メチル - 1 - ブタノール + TX、酢酸カルシウム + TX、Scenturion (登録商標) + TX、Bio lure (登録商標) + TX、Check - Mate (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオアート (Lavandulyl senecioate) ; および

10

以下のものを含む生物 (Macrobials) : アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus - System (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus papaya) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia - System (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標)) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Ageniaspis citricola) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標)) + TX、Andersoni - System (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標)) + TX、Spical (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thripex (登録商標)) + TX、Bugline cucumeris (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (Amblyseius fallacis) (Fallacis (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・スウィルスキー (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標)) + TX、Swirskii - Mite (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ウォマースレイ (Amblyseius womersleyi) (Womer Mite (登録商標)) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) + TX、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) + TX、アナギルス・フスベントリス (Anagyrus fusciventris) + TX、アナギルス・カマリ (Anagyrus kamali) + TX、アナギルス・ロエッキ (Anagyrus loeckii) + TX、アナギルス・シュードコッカス (Anagyrus pseudococci) (Citripa (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris - System (登録商標)) + TX、アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標)) + TX、Aphiline (登録商標)) + TX、アフェリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Ahipar (登録商標)) + TX、アフィジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Ervi par (登録商標)) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuensis) + TX、アフィジウス・マトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Ahipar - M (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標)) + TX、アフィドレテス・アフィディマ

20

30

40

50

イザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (*Aphidoline* (登録商標)) + TX、アフィチス・リングナネンシス (*Aphytis lingnanensis*) + TX、アフィチス・メリヌス (*Aphytis melinus*) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイイ (*Aprostocetus hagenowii*) + TX、アセタ・コリアリア (*Atheta coriaria*) (*Staphyline* (登録商標)) + TX、マルハナバチ属 (*Bombus* spp.) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Natupol Beehive* (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Beeline* (登録商標)) + TX、Tripol (登録商標)) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (*Cephalonomia stephanoderis*) + TX、チノコルス・ニグリツス (*Chilocorus nigritus*) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysoline* (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*Chrysopa* (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフイラブリス (*Chrysoperla rufilabris*) + TX、シロスピルス・インゲヌウス (*Cirrospilus ingenuus*) + TX、シロスピルス・クアドリストラアツス (*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、シトロスチクス・フィロクニストイデス (*Citrostichus phyllocnistoides*) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (*Closterocerus chamaeleon*) + TX、クロステロセルス属 (*Closterocerus* spp.) + TX、コシドキセノイデス・ペルミヌツス (*Coccidoxenoides permirutus*) (*Planopar* (登録商標)) + TX、コッコファグス・コウペリ (*Coccophagus cowperi*) + TX、コッコファグス・リシムニア (*Coccophagus lycimnia*) + TX、キアシサムライコマユバチ (*Cotesia flavipes*) + TX、コナガサムライコマユバチ (*Cotesia plutellae*) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (*Cryptobug* (登録商標)) + TX、Cryptoline (登録商標)) + TX、キムネタマキスイ (*Cybocephalus nipponicus*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*Minusa* (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Diminex* (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (*Delphastus catalinae*) (*Delphastus* (登録商標)) + TX、デルファスツス・プシルス (*Delphastus pusillus*) + TX、ディアカスミモルファ・クラウシイ (*Diachasmimorpha krausii*) + TX、ディアカスミモルファ・ロンギカウダ (*Diachasmimorpha longicaudata*) + TX、ディアパルス・ジュクンダ (*Diaparsis jucunda*) + TX、ディアホレンシルツス・アリガレンシス (*Diaphorencyrtus aligarhensis*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (*Miglyphus* (登録商標)) + TX、Digline (登録商標)) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (*DacDigline* (登録商標)) + TX、Minex (登録商標)) + TX、ディベルシネルプス属 (*Diversinervus* spp.) + TX、エンカルシア・シトリナ (*Encarsia citrina*) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (*Encarsia max* (登録商標)) + TX、Encarline (登録商標)) + TX、En-Strip (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (*Enermix* (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ (*Encarsia guadeloupae*) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (*Encarsia haitiensis*) + TX、ホソヒラタアブ (*Episyrphus balteatus*)

10

20

30

40

50

(Syrphidend (登録商標)) + TX、エルトモセリス・シフォニニ (Eretmoceris siphonini) + TX、エルトモセルス・カリフォルニクス (Eretmocerus californicus) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Ercal (登録商標)) + TX、Eretline e (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Bemimix (登録商標)) + TX、エルトモセルス・ハヤチ (Eretmocerus hayatii) + TX、エルトモセルス・ムンヅス (Eretmocerus mundus) (Bemipar (登録商標)) + TX、Eretline m (登録商標)) + TX、エルトモセルス・シフォニニ (Eretmoceris siphonini) + TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス (Exochomus quadripustulatus) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Spidend (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Feltiline (登録商標)) + TX、フォピウス・アリサヌス (Fopius arisanus) + TX、フォピウス・セラチチボルス (Fopius ceratitivorus) + TX、ホルモノネチン (Wirless Beehome (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (Franklinothrips vespiformis) (Vespop (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (Galendromus occidentalis) + TX、ゴニオズス・レグネリ (Goniozus legneri) + TX、シマメイガコマユバチ (Habrobracon hebetor) + TX、ナミテントウ (Harmonia axyridis) (HarmoBeetle (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (Heterorhabdittis spp.) (Lawn Patrol (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (Heterorhabdittis bacteriophora) (NemaShield HB (登録商標)) + TX、Nemaseek (登録商標) + TX、Terranem - Nam (登録商標) + TX、Terranem (登録商標) + TX、Larvanem (登録商標) + TX、B - Green (登録商標) + TX、NemaAttack (登録商標) + TX、Nematop (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・メジデイス (Heterorhabdittis megidis) (Nemasys H (登録商標)) + TX、BioNem H (登録商標) + TX、Exhibitline hm (登録商標) + TX、Larvanem - M (登録商標)) + TX、サカハチテントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer - System (登録商標)) + TX、Entomite - A (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標)) + TX、Entomite - M (登録商標)) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbalia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (Lecanoid eus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンヅス (Lemophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Leptomastidea abnormis) + TX、レプトマスチクス・ダクチロピイ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エボナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophanthae) + TX、リポレクシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標)) + TX、リシフレプス・テストケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノス (Macrolophus caliginosus) (Mirical - N (登録商標)) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Mirical (登録商標)) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulus

longipes) + TX、メタフィクス・フラブス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンスブライ (Metaphycus lounsburyi) + TX、ミクロムス・アングラツス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標)) + TX、ミクロテリス・フラブス (Microterys flavus) + TX、ムスシディフラクス・ラポトレルス (Muscidi furax raptorellus) およびスパランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登録商標)) + TX、ネオドリユス・チフロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・クメリス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (Nesideocoris tenuis) (Nesidio Bug (登録商標)) + TX、Nesibug (登録商標)) + TX、オフィラ・アエネセンス (Ophyra aenescens) (Biofly (登録商標)) + TX、シノビハナカメムシ (Orius insidiosus) (Thripor - I (登録商標)) + TX、Oriline i (登録商標)) + TX、エルヒメハナカメムシ (Orius laevigatus) (Thripor - L (登録商標)) + TX、Oriline l (登録商標)) + TX、オリウス・マジュスクルス (Orius majusculus) (Oriline m (登録商標)) + TX、タイリクヒメハナカメムシ (Orius strigicollis) (Thripor - S (登録商標)) + TX、
 パウエシア・ジュニペロルム (Pauesia juniperorum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pediobius foveolatus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmarhabditis hermaphrodita) ((Nemaslug (登録商標)) + TX、フィマスティクス・コフエア (Phymastichus coffea) + TX、フィトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus) + TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (Spidex (登録商標)) + TX、Phytoline p (登録商標)) + TX、ポディスス・マクリベントリス (Podisus maculiventris) (Podisus (登録商標)) + TX、
 シューダクテオン・クルバツス (Pseudacteon curvatus) + TX、
 シューダクテオン・オブツス (Pseudacteon obtusus) + TX、
 シューダクテオン・トリクスピス (Pseudacteon tricuspis) + TX、
 シューダフィクス・マクリペンニス (Pseudaphycus maculipennis) + TX、シュードレプトマスティクス・メキシカーナ (Pseudleptomastix mexicana) + TX、サイラエファグス・ピロス (Psyllaephagus pilosus) + TX、サイタリア・コンコロル (Psytalia concolor) (複合体) + TX、クアドラスティクス属 (Quadrastichus spp.) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (Rhizophobius lophanthae) + TX、ベダリアテントウ (Rodolia cardinalis) + TX、オオクビキレガイ (Rumina decollate) + TX、セミエラケア・ペティオラツス (Semiellacher petiolatus) + TX、シトビオン・アベナエ (Sitobion avenae) (Ervibank (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・カルボカプサエ (Steinernema carpocapsae) (Nematac C (登録商標)) + TX、Millenium (登録商標) + TX、BioNem C (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nemastar (登録商標) + TX、Capsanem (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (Steinernema feltiae) (NemaShield (登録商標)) + TX、Nemasys F (登録商標) + TX、BioNem F (登録商標) + TX、Steinernema - System (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nemaplus (登録商標) + TX、Exhibi

tline sf (登録商標) + TX、Scia-rid (登録商標) + TX、Ento
 nem (登録商標) + TX、スタイナーネマ・クラッセイ (Steinernema
 krausseii) (Nemasys L (登録商標) + TX、BioNem L (登録
 商標) + TX、Exhibitline srb (登録商標) + TX、スタイナーネマ
 ・リオブラベ (Steinernema riobrave) (BioVector (登
 録商標) + TX、BioVektor (登録商標) + TX、スタイナーネマ・スカプテ
 リシ (Steinernema scapterisci) (Nematac S (登録
 商標) + TX、スタイナーネマ属 (Steinernema spp.) + TX、スタ
 イナーネマチド属 (Steinernematid spp.) (Guardian N
 ematodes (登録商標) + TX、ステルス・プンクチルム (Stethoru
 s punctillum) (Stethorus (登録商標) + TX、タマリキシア
 ・ラジアタ (Tamarixia radiata) + TX、テトラスティクス・セティ
 ファー (Tetrastichus setifer) + TX、トリボビウス・セミルテ
 ウス (Thripobius semiluteus) + TX、トリムス・シネンシス (Torymus
 sinensis) + TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma
 brassicae) (Tricholine b (登録商標) + TX、タマゴ
 ヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Tricho-Str
 ip (登録商標) + TX、ヨトウタマゴバチ (Trichogramma evane
 scens) + TX、トリコグラムマ・ミヌツム (Trichogramma minu
 tum) + TX、アワノメイガタマゴバチ (Trichogramma ostrini
 ae) + TX、トリコグラムマ・プラトネリ (Trichogramma platne
 ri) + TX、トリコグラムマ・プレチオスム (Trichogramma preti
 osum) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (Xanthopimpla stem
 mator) ; および

10

20

以下のものを含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 + TX、bioSea (登録商標)
 + TX、コンドロステレウム・ブルブレウム (Chondrostereum purp
 ureum) (Chontrol Paste (登録商標) + TX、コレトトリクム・
 グレオスポリオイデス (Colletotrichum gloeosporioides) (Collego (登録商標) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標) + TX、デルタトラップ (Trapline d (登録商標) + TX、エルウィニア・
 アミロボラ (Erwinia amylovora) (ハーピン) (ProAct (登録
 商標) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標) + TX、リン酸第二
 鉄 (Ferri-phosphate) (Ferramol (登録商標) + TX、ファ
 ネルトラップ (Trapline y (登録商標) + TX、Gallex (登録商標)
 + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (Ho
 mo-brassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Wo
 rry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標) + TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標) + TX、ミク
 ロクトヌス・ヒペロダエ (Microctonus hyperodae) + TX、ミコ
 レプトジスクス・テレストリス (Mycoleptodiscus terrestri
 s) (Des-X (登録商標) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Amin
 omite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標) + TX、炭酸水素カリウム (MilStop (登録商標) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標) + TX、ケイ
 酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標) + TX、ヨウ化カリウム + チオシ
 アン酸カリウム (Enzicur (登録商標) + TX、SuffOil-X (登録商標)
 + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (Nosema locustae) (S
 emaspoire Organic Grasshopper Control (登録商
 標) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標) + TX、Rebell
 l Amarillo (登録商標) + TX およびトラップ (Takitrapline

30

40

50

y + b (登録商標) + TX。

【0205】

活性成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば、[3878-19-1]は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。上記の混合の相手は公知である。活性成分が、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会 (The British Crop Protection Council)] に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号(1)で記載されている。「[CCN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names” に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, (著作権) 1995-2013]；例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス：<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> に記載されている。

10

【0206】

上記の活性成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」または別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され；その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクツ名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」または「開発コード」が使用される。

20

【0207】

表1～23およびPから選択される式Iの化合物と、上記の活性成分との活性成分混合物は、表1～23およびPから選択される化合物および上記の活性成分を、好ましくは、100:1～1:6000、特に50:1～1:50の混合比で、より特に20:1～1:20、さらにより特に10:1～1:10、非常に特に5:1および1:5の比率で(2:1～1:2の比率が特に好ましく、4:1～2:1の比率が同様に好ましい)、とりわけ、1:1、または5:1、または5:2、または5:3、または5:4、または4:1、または4:2、または4:3、または3:1、または3:2、または2:1、または1:5、または2:5、または3:5、または4:5、または1:4、または2:4、または3:4、または1:3、または2:3、または1:2、または1:600、または1:300、または1:150、または1:35、または2:35、または4:35、または1:75、または2:75、または4:75、または1:6000、または1:3000、または1:1500、または1:350、または2:350、または4:350、または1:750、または2:750、または4:750の比率で含む。それらの混合比は、重量基準の比率である。

30

【0208】

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

40

【0209】

表1～23およびPから選択される式Iの化合物と、上記の1つまたは複数の活性成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス (ready-mix) 形態で、「タンクミックス」などの単一の活性成分の別個の製剤から構成される組み合わせられたスプレー混合物として、および逐次、すなわち、数時間または数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の活性成分の併用で施用され得る。表1～23およびPから選択される式Iの化合物および上記の活性成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要で

50

ない。

【0210】

生物学的実施例：

実施例B1：タバコナジラミ (*Bemisia tabaci*) (ワタコナジラミ)：
摂食/接触活性

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

【0211】

以下の化合物：P5、P6、P8、P9、P10、P12、P13、P15およびP16は、200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0212】

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

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置かれたトウモロコシの芽を、噴霧により10'000ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫(ウェル当たり6~10匹)を外寄生させた。試料を外寄生の4日後の非処理の試料と比較した死亡率および成長阻害について評価した。

【0213】

以下の化合物：P1、P3、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P15、P16およびP17は、200ppmの施用量で2つのカテゴリー(死亡率または成長阻害)の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

【0214】

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

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に10'000ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉にN2若虫を外寄生させた。試料を外寄生の5日後の非処理の試料と比較した死亡率および成長阻害について評価した。

【0215】

以下の化合物：P1、P3、P5、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15およびP16は、200ppmの施用量で2つのカテゴリー(死亡率または成長阻害)の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

【0216】

実施例B4：ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) (ミカンキイロアザミウマ)：摂食/接触活性

ヒマワリ葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10'000DMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、この葉片に様々な年齢数のフランクリニエラ属 (*Frankliniella*) 個体群を外寄生させた。試料を外寄生の7日後の死亡率について評価した。

【0217】

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

【0218】

実施例B5：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)：摂食/接触活性

ヒマワリ葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10'000ppmのDMSOストック溶液から調製された試験水溶液を噴霧した。乾燥させた後、こ

10

20

30

40

50

の葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。試料を外寄生の6日後の死亡率について評価した。

【0219】

以下の化合物：P3、P5、P6、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16およびP17 P1およびP2は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0220】

実施例B6：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)。全身活性

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

【0221】

以下の化合物：P2、P8、P9、P10、P12、P14およびP15は、24 ppmの試験量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0222】

実施例B7：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)

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

【0223】

以下の化合物：P1、P3、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P15およびP16は、200 ppmの施用量で2つのカテゴリー(死亡率または成長阻害)の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

【0224】

実施例B8：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ)

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

【0225】

以下の化合物：P3、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P13、P15およびP16は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした。

【0226】

実施例B9：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ)

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

【0227】

以下の化合物：P3、P5、P8、P9、P10、P15およびP16は、12.5 p

10

20

30

40

50

p mの試験量で3つのカテゴリー（死亡率、摂食阻害、または成長阻害）の少なくとも1つの少なくとも80%の効果を示した。

【0228】

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

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

【0229】

以下の化合物：P8は、200 p mの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0230】

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

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

【0231】

以下の化合物：P5、P6、P8、P9、P10、P15およびP16は、200 p mの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした。

【0232】

実施例B12：ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）（黄熱病蚊）：

試験溶液をエタノール中200 p mの施用量で12ウェル組織培養プレートに入れた。堆積物を乾燥させてから、5匹の2～5日齢の雌成虫ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）を各ウェルに加え、脱脂綿の塊中の10%のスクロース溶液で育てた。ノックダウンの評価を導入の1時間後に行い、死亡率を導入の24時間後および48時間後に評価した。

【0233】

以下の化合物：P5、P8、P9、P10、P11、P13、P15およびP16は、48時間後および／または24時間後のネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）の少なくとも80%の防除を示した。

【0234】

実施例B13：ハマダラカ（*Anopheles stephensi*）（インドマラリア蚊（*Indian malaria mosquito*））：

試験溶液をエタノール中200 p mの施用量で12ウェル組織培養プレートに入れた。堆積物を乾燥させてから、5匹の2～5日齢の雌成虫ハマダラカ（*Anopheles stephensi*）を各ウェルに加え、脱脂綿の塊中の10%のスクロース溶液で育てた。ノックダウンの評価を導入の1時間後に行い、死亡率を導入の24時間後および48時間後に評価した。

【0235】

以下の化合物：P5、P8、P9、P10、P11、P13、P15およびP16は、48時間後および／または24時間後のハマダラカ（*Anopheles stephensi*）の少なくとも80%の防除を示した。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

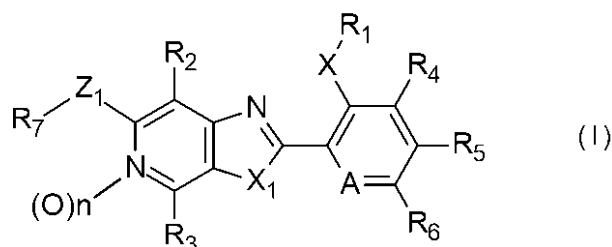
〔1〕式I

10

20

30

40



(式中、

A が、C H、N、またはN Oであり；

X が、S、S OまたはS O₂であり；

X₁ が、O、S、またはN (C₁ ~ C₃アルキル) であり；

R₁ が、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₃ ~ C₆シクロアルキル、C₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₆アルキルであるか；または

R₁ が、ハロゲン、シアノおよびC₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₆アルキルであるか；または

R₁ が、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニルまたはC₂ ~ C₆アルキニルであり；

R₂ が、水素またはC₁ ~ C₃アルキルであり；

R₃ が、水素またはC₁ ~ C₃アルキルであり；

R₄およびR₆が、水素またはC₁ ~ C₃アルキルであり；

R₅が、水素、ハロゲン、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₁ ~ C₆ハロアルコキシ、C₁ ~ C₆アルキルスルファニル、C₁ ~ C₆アルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆アルキルスルホニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルファニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁ ~ C₆ハロアルキルスルホニル、またはC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキルであり；

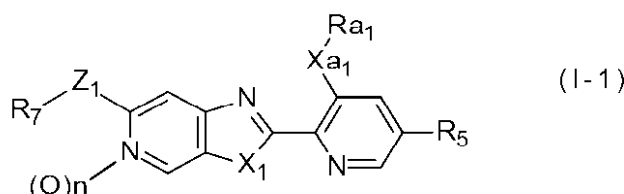
Z₁が、酸素、S、S OまたはS O₂であり、ただし、R₇が水素である場合、Z₁が、S OおよびS O₂と異なっており；

R₇が、水素、C₁ ~ C₆アルキル、C₁ ~ C₆ハロアルキル、C₂ ~ C₆アルケニル、C₂ ~ C₆ハロアルケニルまたはC₂ ~ C₆アルキニル、C₂ ~ C₆ハロアルキニル、C₁ ~ C₆アルキルシアノ、C₃ ~ C₆シクロアルキル、C₃ ~ C₆ハロシクロアルキル、C₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキル、またはハロゲン、シアノおよびC₁ ~ C₄アルキルからなる群から選択される置換基で一置換または多置換されるC₃ ~ C₆シクロアルキル - C₁ ~ C₄アルキルであり；

n が、0または1である)

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

〔2〕式 I - 1



(式中、R₅、R₇、Z₁、nおよびX₁が、前記〔1〕に定義されるとおりであり；

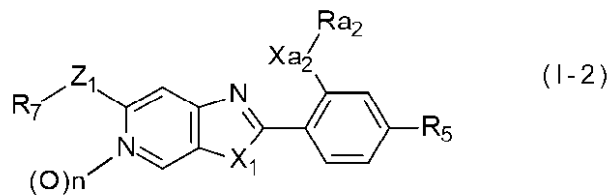
X_{a1}が、S、S OまたはS O₂であり；

R_{a1}が、メチル、エチル、n - プロピル、i - プロピルまたはシクロプロピルメチルである)

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

互変異性体によって表される、前記〔１〕に記載の式１の化合物。

〔３〕式Ⅰ－２



（式中、 R_5 、 R_7 、 Z_1 、 n および X_1 が、前記〔１〕に記載の式Ⅰで定義されるとおりであり；

X_{a1} が、 S 、 SO または SO_2 であり； R_{a1} が、メチル、エチル、 n -プロピル、 i -プロピルまたはシクロプロピルメチルである）

の化合物、ならびに前記化合物の農芸化学的に許容できる塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体によって表される、前記〔１〕に記載の式Ⅰの化合物。

〔４〕 A が、 N であり；

X が、 S または SO_2 であり；

X_1 が、 N （ $C_1 \sim C_3$ アルキル）であり；

R_1 が、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が、水素であり；

Z_1 が、酸素、 S 、 SO または SO_2 であり；

R_5 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルまたはハロゲンであり；および

R_7 が、シアノで置換され得る $C_1 \sim C_4$ アルキルであるか、または

R_7 が、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである、前記〔１〕に記載の式Ⅰの化合物。

〔５〕殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的にまたは殺軟体動物的に有効な量の前記〔１〕に記載の式Ⅰの化合物と、そのための好適な担体または希釈剤とを含む、殺虫、殺ダニ、殺線虫または殺軟体動物組成物。

〔６〕有害生物に対処(combat)し、かつそれを防除する方法であって、殺有害生物的に有効な量の前記〔１〕に記載の式Ⅰの化合物または前記化合物を含む組成物を有害生物、有害生物の場所、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用する工程を含む方法。

〔７〕有害生物に対処し、かつそれを防除する方法であって、前記〔６〕に記載の殺有害生物組成物を有害生物、有害生物の場所、または有害生物による攻撃を受けやすい植物に施用する工程を含む方法。

10

20

30

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I
A 0 1 P 9/00 (2006.01)		A 0 1 P 5/00
A 6 1 K 31/444 (2006.01)		A 0 1 P 9/00
A 6 1 P 33/14 (2006.01)		A 6 1 K 31/444
		A 6 1 P 33/14

(74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796
弁理士 服部 博信

(74)代理人 100162422
弁理士 志村 将

(72)発明者 エドマンズ アンドリュウ
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 ユング ピエール ヨーゼフ マルセル
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 ミュールバッハ ミヒエル
スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ シンジェンタ クロップ プロ
テクション ミュンヒヴィーレン アーゲー内

(72)発明者 ルー ロン
中華人民共和国 2 0 0 0 3 2 シャンハイ フェンリン ロード ナンバー 3 5 4 チャイニ
ーズ アカデミー オブ サイエンスーズ シャンハイ インスティテュート オブ オーガニック
ケミストリー内

(72)発明者 ウー ヤミン
中華人民共和国 2 0 0 0 3 2 シャンハイ リンリン ロード ナンバー 3 4 5 チャイニ
ーズ アカデミー オブ サイエンスーズ シャンハイ インスティテュート オブ オーガニック
ケミストリー内

(72)発明者 チェン ルイファン
中華人民共和国 2 0 0 0 3 2 シャンハイ リンリン ロード ナンバー 3 4 5 チャイニ
ーズ アカデミー オブ サイエンスーズ シャンハイ インスティテュート オブ オーガニック
ケミストリー内

審査官 早乙女 智美

(56)参考文献 国際公開第2014/104407(WO, A1)
国際公開第2014/178363(WO, A1)
特開昭58-090586(JP, A)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D
A 0 1 N
A 6 1 K
C A p l u s / R E G I S T R Y / M A R P A T (S T N)