

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2019-507149

(P2019-507149A)

(43) 公表日 平成31年3月14日 (2019.3.14)

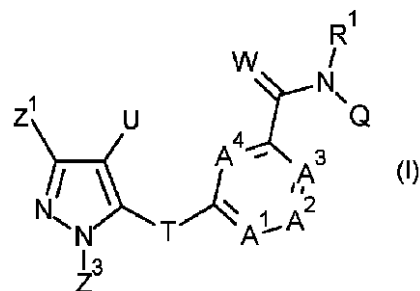
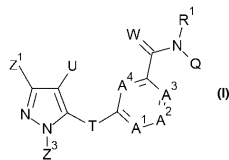
(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 401/14 (2006.01)	C O 7 D 401/14	4 C O 6 3
C O 7 D 403/04 (2006.01)	C O 7 D 403/04 C S P	4 H O 1 1
A O 1 P 7/04 (2006.01)	A O 1 P 7/04	
A O 1 P 7/02 (2006.01)	A O 1 P 7/02	
A O 1 N 43/56 (2006.01)	A O 1 N 43/56 D	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 123 頁)		

(21) 出願番号	特願2018-543660 (P2018-543660)	(71) 出願人	300091441 シンジェンタ パーティシペーションズ アーゲー スイス国 4 0 5 8 パーゼル、シュバルツ バルトアレー 2 1 5
(86) (22) 出願日	平成29年2月16日 (2017.2.16)	(74) 代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(85) 翻訳文提出日	平成30年8月30日 (2018.8.30)	(74) 代理人	100088694 弁理士 弟子丸 健
(86) 国際出願番号	PCT/EP2017/053488	(74) 代理人	100103610 弁理士 ▲吉▼田 和彦
(87) 国際公開番号	W02017/140771	(74) 代理人	100084663 弁理士 箱田 篤
(87) 国際公開日	平成29年8月24日 (2017.8.24)	(74) 代理人	100093300 弁理士 浅井 賢治
(31) 優先権主張番号	16156360.6	最終頁に続く	
(32) 優先日	平成28年2月18日 (2016.2.18)		
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		

(54) 【発明の名称】 殺有害生物活性ピラゾール誘導体

(57) 【要約】

本明細書において定義される、式 (I)



の化合物、それを調製するためのプロセス、それを含む殺有害生物性組成物、特に殺虫性、殺ダニ性、殺軟体動物性および殺線虫性組成物、ならびに昆虫、ダニ類、軟体動物および線虫有害生物などの有害生物を駆除および防除するためにそれを使用する方法。

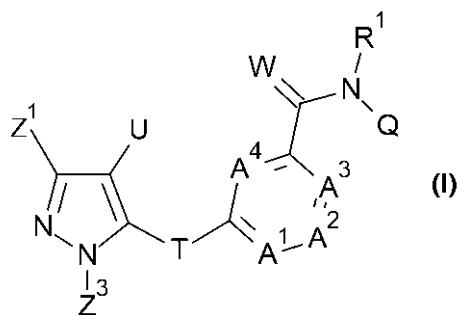
【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、

R^1 は、H、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_0 - C_3)-アルキルおよびヘテロアリール (C_0 - C_3)-アルキルから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 アルケニル、 C_3 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、アリール (C_0 - C_3)-アルキルおよびヘテロアリール (C_0 - C_3)-アルキルの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシおよび C_1 - C_6 -アルコキシカルボニルから独立して選択される 1~5 個の置換基で置換されており；

20

Qは、H、ヒドロキシ、 $HC(=O)-$ 、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_3 -アルキル- C_3 - C_7 シクロアルキル、アリール (C_0 - C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_0 - C_3)-アルキル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノ、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルカルボニルアミノおよびN、N-ジ (C_1 - C_6 -アルキル) アミノから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 アルケニル、 C_3 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_3 -アルキル- C_3 - C_7 シクロアルキル、アリール (C_0 - C_3)-アルキル、ヘテロアリール (C_0 - C_3)-アルキル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノ、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルカルボニルアミノおよびN、N-ジ (C_1 - C_6 -アルキル) アミノの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される 1~5 個の置換基で置換されており；

30

Wは、OまたはSであり；

40

A^1 は、 CR^2 またはNであり；

A^2 は、 CR^3 またはNであり；

A^3 は、 CR^4 またはNであり；

A^4 は、 CR^5 またはNであり；

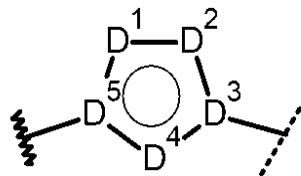
ただし、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の 3 個以下は、Nであり；

R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 $N-C_1$ - C_6 -アルコキシ-イミノ- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノおよびN、N-ジ- C_1 - C_6 -アルキルアミノから独立して選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 $N-C_1$ - C_6 -アルコキ

50

シーイミノ- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、 N - C_1 - C_6 -アルキルアミノおよび N 、 N - C_1 - C_6 -アルキルアミノの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される1～5個の置換基で置換されており；
Tは、式

【化2】



10

(式中、

【化3】



は、ピラゾール基に対する結合を示し；

20

D^1 は、 CR^{6a} 、 N 、 NR^{6b} 、 O および S から選択され；

D^2 は、 CR^{7a} 、 N 、 NR^{7b} 、 O および S から選択され；

D^3 は、 C または N であり；

D^4 は、 CR^{8a} 、 N 、 NR^{8b} および O から選択され；

D^5 は、 C または N であり；

ただし、 D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 および D^5 の少なくとも1つは、 N 、 O および S から選択され、かつ D^1 、 D^2 および D^4 の1つ以下は、 O または S であり、かつ D^3 および D^5 の少なくとも1つは、 C であり；

R^{6a} 、 R^{7a} および R^{8a} は、 H 、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニルおよび C_1 - C_6 -アルキルスルホニルから独立して選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニルの各々は、無置換であるか、または1～5個のハロゲンで置換されており；

30

R^{6b} 、 R^{7b} および R^{8b} は、 H および C_1 - C_6 -アルキルから独立して選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキルの各々は、無置換であるか、または1～5個のハロゲンで置換されている)

の5員ヘテロアリアルであり；

Z^1 は、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルおよび C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルおよび C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される1～5個の置換基で置換されており；

40

Uは、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシ、 C_3 ～ C_5 -シクロアルコキシ、 C_3 ～ C_5 -ハロシクロアルコキシ、 C_3 ～ C_5 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_5 -ハロシクロアルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_3 -アルキニル、

50

—S—C₃~C₅—シクロアルキル、—S—C₃~C₅—ハロシクロアルキル、—SO—C₃~C₅—シクロアルキル、—SO—C₃~C₅—ハロシクロアルキル、—SO₂—C₃~C₅—シクロアルキル、—SO₂—C₃~C₅—ハロシクロアルキル、—O—C₂~C₄—アルケニル、—O—C₂~C₄—ハロアルケニル、—NH₂、—SO₂F、—O—SO₂—C₁~C₄—アルキル、—O—SO₂—C₁~C₄—ハロアルキルおよびOHから選択され；

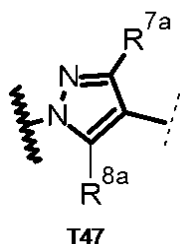
Z³は、H、C₁~C₆—アルキル、C₁~C₆—シクロアルキル、C₂~C₆—アルケニル、C₂~C₆—アルキニル、アリールおよびヘテロアリールから選択され、ここで、C₁~C₆—アルキル、C₁~C₆—シクロアルキル、C₂~C₆—アルケニル、C₂~C₆—アルキニル、アリールおよびヘテロアリールの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁~C₆—アルコキシ、C₁~C₆—アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、C₁~C₆—アルキルカルバモイル、C₃~C₆—シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される1~5個の置換基で置換されている）の化合物またはその農芸化学的に許容可能な塩もしくはN—オキシド。

10

【請求項2】

Tは、

【化4】



20

であり、式中、

【化5】



は、前記ピラゾール基に対する結合を示す、実施形態1に記載の化合物または塩。

【請求項3】

30

Uは、—OCHF₂、—OCH₂CF₃、—OCH₃、—O—シクロプロピル、シクロプロピル、OH、—O—CH=CH₂、—CH=CH₂、—C≡CH、—S—シクロプロピル、—O—CF=CF₂、—O—SO₂—F、—NH₂、—SO₂—シクロプロピル、—SO—シクロプロピル、—O—CF₂—CF₂H、—OEt、—O—CH₂—CF₂H、—O—CF₂CF₂CF₃、—O—CF₂CFHCF₃および—CF₂CF₃から選択される、請求項1または2に記載の化合物または塩。

【請求項4】

Uは、—OCHF₂、—CH=CH₂および—C≡CHから選択される、請求項1または2に記載の化合物または塩。

【請求項5】

40

Uは、—OCHF₂である、請求項1または2に記載の化合物または塩。

【請求項6】

Z¹は、メチル、エチル、1, 1—ジメチルエチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、ブロモジクロロメチル、1—フルオロエチル、1—フルオロ—1—メチルエチル、2—フルオロエチル、2, 2—ジフルオロエチル、2, 2, 2—トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2—テトラフルオロエチル、1—クロロ—1, 2, 2, 2—テトラフルオロエチル、2, 2, 2, 2—トリクロロエチル、2—クロロ—2, 2—ジフルオロエチル、1, 1—ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ—n—プロピル、ヘプタフルオロ—i—ソプロピル、ノナフルオロ—n—ブチル、シクロプロピル、1—クロロシクロプロピル、1

50

ーフルオロシクロプロピル、1-ブロモシクロプロピル、1-シアノーシクロプロピル、1-トリフルオロメチル-シクロプロピル、シクロブチルおよび2, 2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピルから選択される、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項7】

Z¹は、-CF₂CF₃である、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項8】

Z³は、H、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、エテニル、1-プロペニル、1-プロピニル、シクロプロピル、1-ブチニル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、1フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル、4-NO₂-フェニルおよび3-クロロ-ピリジン-2-イルから選択される、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物または塩。

10

【請求項9】

Z³は、メチルである、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物または塩。

【請求項10】

20

活性処方成分としての、請求項1～9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物またはその農芸化学的に許容可能な塩もしくはN-オキシドと、少なくとも1種の助剤を含む殺有害生物性組成物。

【請求項11】

1種または複数の他の殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的におよび／または殺菌的に活性な薬剤をさらに含む、請求項10に記載の組成物。

【請求項12】

有害生物を防除するための方法であって、請求項10または11に記載の組成物を前記有害生物またはその環境に施用する工程を含むが、手術または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前記ヒトまたは動物の身体において実施される診断方法を除く、方法。

30

【請求項13】

有害生物による攻撃から植物繁殖材料を保護するための方法であって、前記繁殖材料または前記繁殖材料が植えられた場所を、請求項10または11に記載の組成物で処理する工程を含む、方法。

【請求項14】

被覆植物繁殖材料であって、前記植物繁殖材料のコーティングは、請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物を含む、被覆植物繁殖材料。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

40

【0001】

本発明は、ピラゾール誘導体、それを調製するためのプロセス、それを調製するための中間体、これらの誘導体を含む殺有害生物性組成物、特に殺虫性、殺ダニ性、殺軟体動物性および殺線虫性組成物、ならびに昆虫、ダニ類、軟体動物および線虫有害生物などの有害生物を駆除および防除するためにそれを使用する方法に関する。

【背景技術】

【0002】

意外なことに、一定のピラゾール誘導体は、きわめて強い殺虫特性を有することがここで見出された。この分野における他の化合物は、国際公開第2014/122083号、国際公開第2012/107434号、国際公開第2015/067646号、国際公開

50

第2015/067647号、国際公開第2015/067648号、国際公開第2015/150442号、国際公開第2015/193218号および国際公開第2010/051926号から公知である。

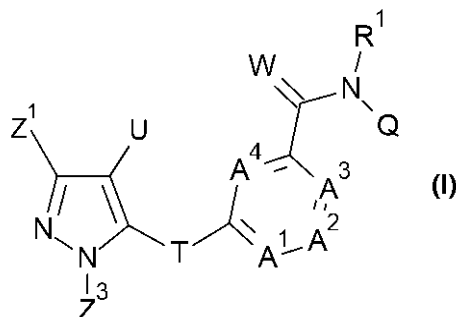
【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0003】

従って、実施形態1に記載のとおり、本発明は、式(I)

【化1】



(式中、

R^1 は、H、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、アリール(C_0 - C_3)-アルキルおよびヘテロアリール(C_0 - C_3)-アルキルから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_6 アルケニル、 C_3 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、アリール(C_0 - C_3)-アルキルおよびヘテロアリール(C_0 - C_3)-アルキルの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシおよび C_1 - C_6 -アルコキシカルボニルから独立して選択される1~5個の置換基で置換されており；

Qは、H、ヒドロキシ、 $HC(=O)-$ 、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_3 -アルキル- C_3 - C_7 シクロアルキル、アリール(C_0 - C_3)-アルキル、ヘテロアリール(C_0 - C_3)-アルキル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノ、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルカルボニルアミノおよびN、N-ジ(C_1 - C_6 -アルキル)アミノから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_3 - C_6 アルケニル、 C_3 - C_6 アルキニル、 C_3 - C_7 シクロアルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_3 - C_7 シクロアルキル- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_3 -アルキル- C_3 - C_7 シクロアルキル、アリール(C_0 - C_3)-アルキル、ヘテロアリール(C_0 - C_3)-アルキル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノ、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルカルボニルアミノおよびN、N-ジ(C_1 - C_6 -アルキル)アミノの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される1~5個の置換基で置換されており；

Wは、OまたはSであり；

A^1 は、 CR^2 またはNであり；

A^2 は、 CR^3 またはNであり；

A^3 は、 CR^4 またはNであり；

A^4 は、 CR^5 またはNであり；

ただし、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の3個以下は、Nであり；

R^2 、 R^3 、 R^4 および R^5 は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 -

10

20

30

40

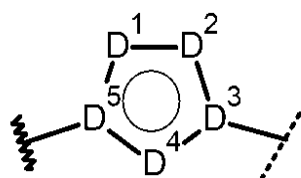
50

C_6 -アルコキシ、 $N-C_1$ - C_6 -アルコキシ-イミノ- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノおよび N 、 N -ジ- C_1 - C_6 -アルキルアミノから独立して選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 $N-C_1$ - C_6 -アルコキシ-イミノ- C_1 - C_3 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニル、 $N-C_1$ - C_6 -アルキルアミノおよび N 、 N -ジ- C_1 - C_6 -アルキルアミノの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される 1～5 個の置換基で置換されており；

10

T は、式

【化 2】



(式中、

【化 3】



20

は、ピラゾール基に対する結合を示し；

D^1 は、 CR^{6a} 、 N 、 NR^{6b} 、 O および S から選択され；

D^2 は、 CR^{7a} 、 N 、 NR^{7b} 、 O および S から選択され；

D^3 は、 C または N であり；

D^4 は、 CR^{8a} 、 N 、 NR^{8b} および O から選択され；

D^5 は、 C または N であり；

ただし、 D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 および D^5 の少なくとも 1 つは、 N 、 O および S から選択され、かつ D^1 、 D^2 および D^4 の 1 つ以下は、 O または S であり、かつ D^3 および D^5 の少なくとも 1 つは、 C であり；

30

R^{6a} 、 R^{7a} および R^{8a} は、 H 、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニルおよび C_1 - C_6 -アルキルスルホニルから独立して選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルファニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 -アルキルスルホニルの各々は、無置換であるか、または 1～5 個のハロゲンで置換されており；

R^{6b} 、 R^{7b} および R^{8b} は、 H および C_1 - C_6 -アルキルから独立して選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキルの各々は、無置換であるか、または 1～5 個のハロゲンで置換されている)

40

の 5 員ヘテロアリアルであり；

Z^1 は、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルおよび C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_3 - C_7 ヘテロシクロアルキル、 C_1 - C_6 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルおよび C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される 1～5 個の置換基で置換

50

されており；

Uは、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -シクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルコキシ、 $C_3 \sim C_5$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_3$ -アルキニル、 $-S-C_3 \sim C_5$ -シクロアルキル、 $-S-C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルキル、 $-SO-C_3 \sim C_5$ -シクロアルキル、 $-SO-C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルキル、 $-SO_2-C_3 \sim C_5$ -シクロアルキル、 $-SO_2-C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルキル、 $-O-C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $-O-C_2 \sim C_4$ -ハロアルケニル、 $-NH-CN$ 、 $-SO_2F$ 、 $-O-SO_2-C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $-O-SO_2-C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルおよびOHから選択され；

Z^3 は、H、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、アリーールおよびヘテロアリーールから選択され、ここで、 C_1 - C_6 -アルキル、 C_1 - C_6 -シクロアルキル、 C_2 - C_6 -アルケニル、 C_2 - C_6 -アルキニル、アリーールおよびヘテロアリーールの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシ、ニトロ、アミノ、シアノ、 C_1 - C_6 -アルコキシ、 C_1 - C_6 -アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、 C_1 - C_6 -アルキルカルバモイル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される1～5個の置換基で置換されている）の化合物またはその農芸化学的に許容可能な塩もしくはN-オキシドに関する。

10

【0004】

中間体化合物を含む本発明の各化合物に関連する A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 D^1 、 D^2 、 D^3 、 D^4 、 D^5 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^{6a} 、 R^{6b} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{8a} 、 R^{8b} 、Q、 Z^1 、Uおよび Z^3 の好ましい値が以下の実施形態2～25に記載されている。

20

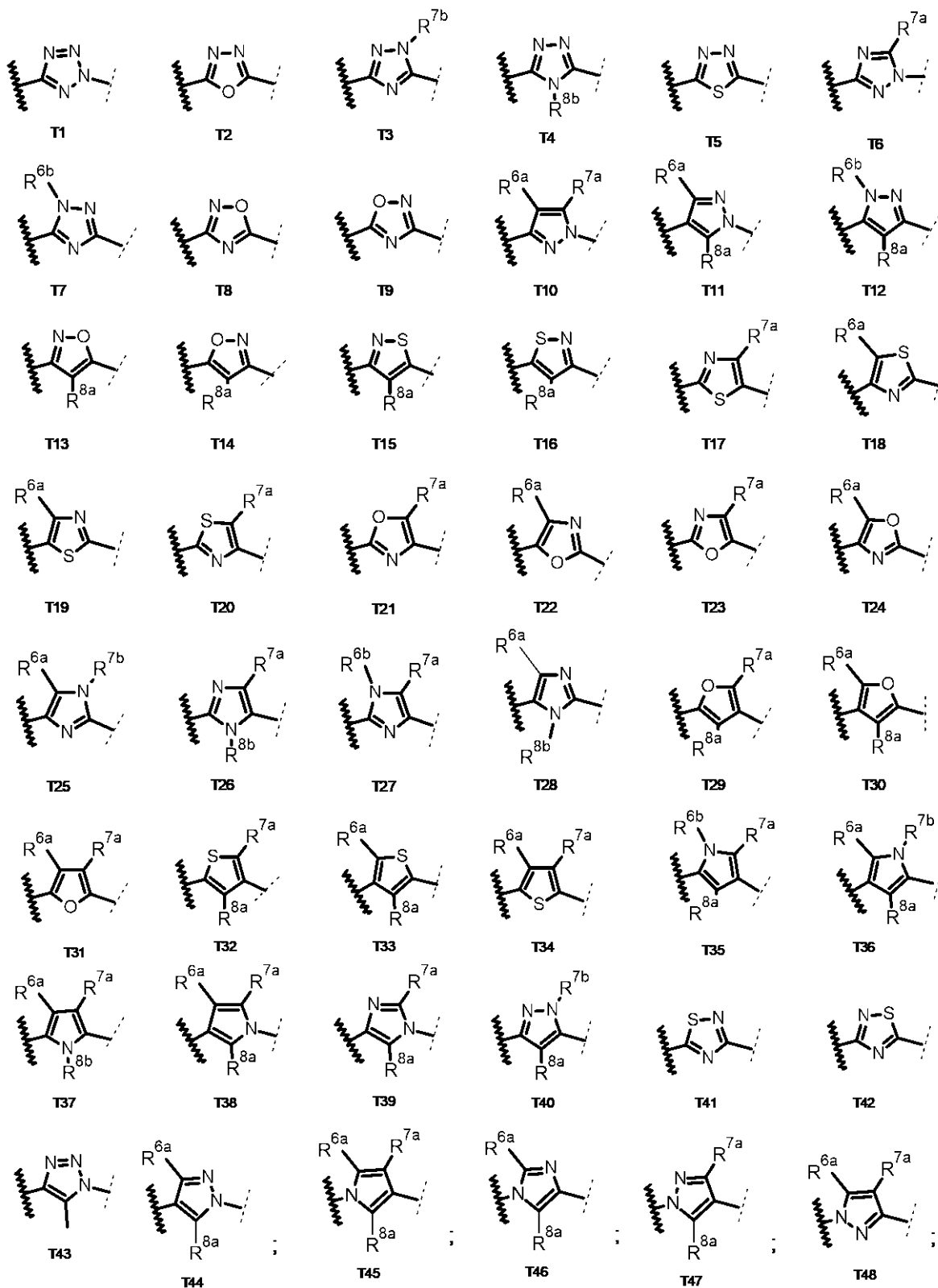
【0005】

本明細書において用いられる場合、ある実施形態が「いずれか1つに記載の」、例えば「実施形態1～23のいずれか1つに記載の」という用語を用いることにより、いくつかの他の実施形態を参照している場合、前記実施形態は、1および2などの整数により示される実施形態のみならず、例えば23.1、23.2、23.3、23.4、23.20、23.25、23.30などの小数点を伴う数字により示される実施形態も参照する。

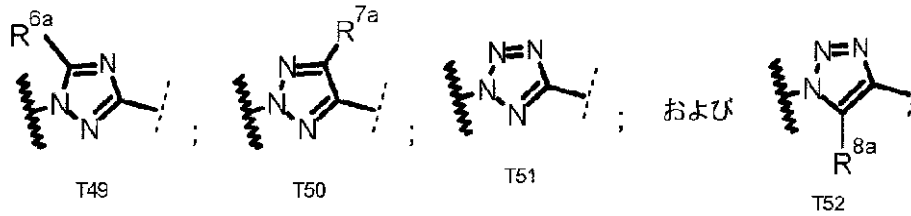
【0006】

実施形態2：実施形態1に係る化合物または塩であり、ここで、Tは、

【化 4】



【化 5】



から選択され、式中、

【化 6】

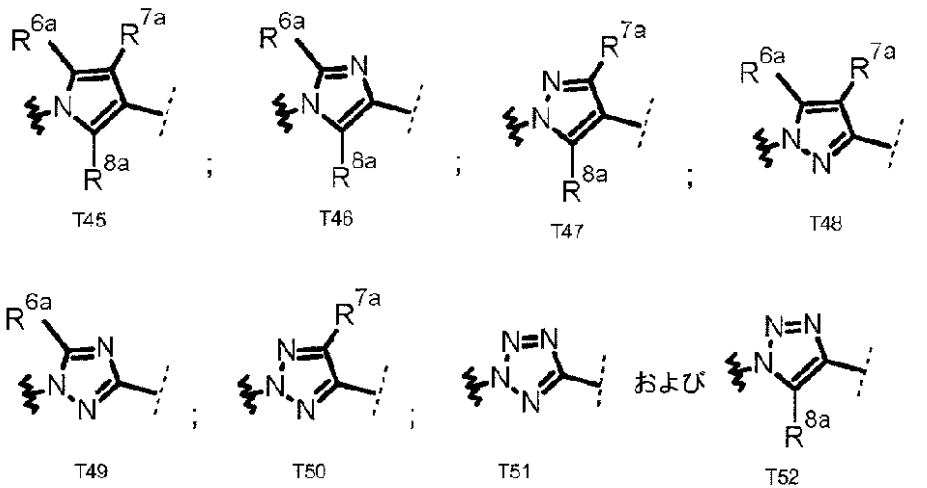


は、ピラゾール基に対する結合を示す。

【0007】

実施形態 3：実施形態 1 に係る化合物または塩であり、ここで、T は、

【化 7】



から選択され、式中、

【化 8】

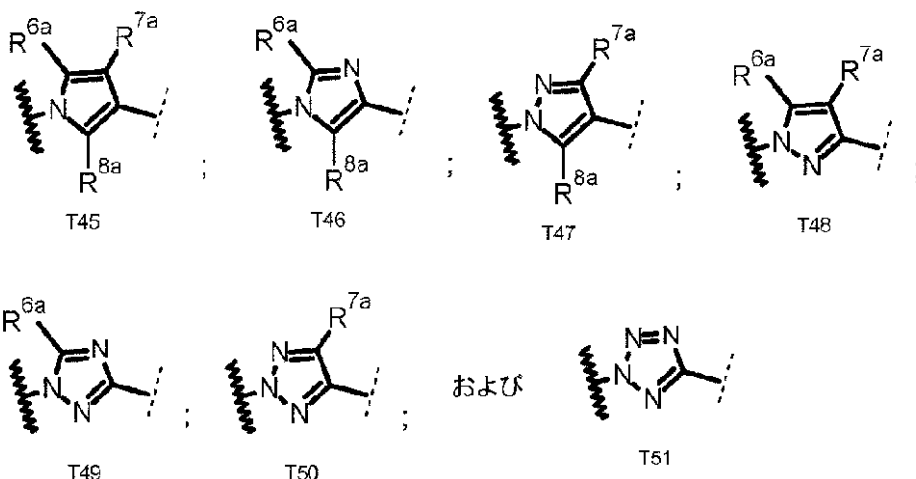


は、ピラゾール基に対する結合を示す。

【0008】

実施形態 3. 1：実施形態 1 に係る化合物または塩であり、ここで、T は、

【化 9】



10

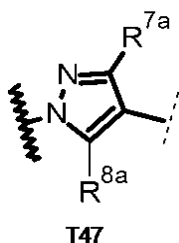
から選択される。

【0009】

実施形態 4：実施形態 1 に係る化合物または塩であり、ここで、T は、

【化 10】

20



であり、式中、

【化 11】

30



は、ピラゾール基に対する結合を示す。

【0010】

実施形態 5：実施形態 1～4 のいずれか 1 つに係る化合物または塩であり、ここで、 R^1 は、H、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、プロペニル、プロパルギル、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、メチルカルボニル、エチルカルボニル、*n*-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、*s*-ブチルカルボニル、*t*-ブチルカルボニル、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、*n*-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、*s*-ブトキシカルボニル、*t*-ブトキシカルボニル、シアノメチル、2-シアノエチル、ベンジル、4-メトキシベンジル、ピリド-2-イル-メチル、ピリド-3-イル-メチル、ピリド-4-イル-メチルおよび 4-クロロ-ピリド-3-イル-メチルから選択される。

40

【0011】

実施形態 6：実施形態 1～5 のいずれか 1 つに係る化合物または塩であり、ここで、 R^1 は、H、メチル、エチル、*n*-プロピル、*n*-プロピルカルボニルおよびプロペニルから選択される。

【0012】

実施形態 6. 1：実施形態 1～5 のいずれか 1 つに係る化合物または塩であり、ここで、 R^1 は、H、メチルおよびエチルから選択される。

50

【0013】

実施形態7：実施形態1～5のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、R¹は、Hまたはメチルである。

【0014】

実施形態8：実施形態1～7のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Qは、H、ヒドロキシ、HC(=O)－、C₁‑C₆‑アルキル、C₁‑C₆‑アルコキシ、C₂‑C₆‑アルケニル、C₂‑C₆‑アルキニル、C₃‑C₇‑シクロアルキル、C₃‑C₇‑ヘテロシクロアルキル、C₃‑C₇‑シクロアルキル‑C₁‑C₃‑アルキル、C₁‑C₃‑アルキル‑C₃‑C₇‑シクロアルキル、アリール(C₀‑C₃)‑アルキル、ヘテロアリール(C₀‑C₃)‑アルキル、N‑C₁‑C₆‑アルキルアミノ、N‑C₁‑C₆‑アルキルカルボニルアミノおよびN、N‑ジ(C₁‑C₆‑アルキル)アミノから選択され、ここで、C₁‑C₆‑アルキル、C₁‑C₆‑アルコキシ、C₂‑C₆‑アルケニル、C₂‑C₆‑アルキニル、C₃‑C₇‑シクロアルキル、C₃‑C₇‑ヘテロシクロアルキル、C₃‑C₇‑シクロアルキル‑C₁‑C₃‑アルキル、C₁‑C₃‑アルキル‑C₃‑C₇‑シクロアルキル、アリール(C₀‑C₃)‑アルキル、ヘテロアリール(C₀‑C₃)‑アルキル、N‑C₁‑C₆‑アルキルアミノ、N‑C₁‑C₆‑アルキルカルボニルアミノおよびN、N‑ジ(C₁‑C₆‑アルキル)アミノの各々は、無置換であるか、またはハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、シアノ、C₁‑C₆‑アルコキシ、C₁‑C₆‑アルコキシカルボニル、ヒドロキシカルボニル、C₁‑C₆‑アルキルカルバモイル、C₃‑C₆‑シクロアルキルカルバモイルおよびフェニルから独立して選択される1～5個の置換基で置換されている。

【0015】

実施形態9：実施形態1～8のいずれか1つに記載の化合物または塩であり、ここで、Qは、H、メチル、エチル、n‑プロピル、1‑メチルエチル、1, 1‑ジメチルエチル、1‑メチルプロピル、n‑ブチル、2‑メチルプロピル、2‑メチルブチル、ヒドロキシエチル、2‑ヒドロキシプロピル、シアノメチル、2‑シアノエチル、2‑フルオロエチル、2, 2‑ジフルオロエチル、2, 2, 2‑トリフルオロエチル、1‑トリフルオロメチルエチル、2, 2‑ジフルオロプロピル、3, 3, 3‑トリフルオロプロピル、2, 2‑ジメチル‑3‑フルオロプロピル、シクロプロピル、1‑シアノ‑シクロプロピル、1‑メトキシカルボニル‑シクロプロピル、1‑(N‑メチルカルバモイル)‑シクロプロピル、1‑カルバモイル‑シクロプロピル、1‑カルバモチオイル‑シクロプロピル、1‑(N‑シクロプロピルカルバモイル)‑シクロプロピル、シクロプロピル‑メチル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、1‑シクロプロピルエチル、ビス(シクロプロピル)メチル、2, 2‑ジメチルシクロプロピル‑メチル、2‑フェニルシクロプロピル、2, 2‑ジクロロシクロプロピル、トランス‑2‑クロロシクロプロピル、シス‑2‑クロロシクロプロピル、2, 2‑ジフルオロシクロプロピル、トランス‑2‑フルオロシクロプロピル、シス‑2‑フルオロシクロプロピル、トランス‑4‑ヒドロキシシクロヘキシル、4‑トリフルオロメチルシクロヘキシル、プロプ‑2‑エニル、2‑メチルプロプ‑2‑エニル、プロプ‑2‑イニル、1, 1‑ジメチルブタ‑2‑イニル、3‑クロロ‑プロプ‑2‑エニル、3‑フルオロ‑プロプ‑2‑エニル、3, 3‑ジクロロ‑プロプ‑2‑エニル、3, 3‑ジクロロ‑1, 1‑ジメチルプロプ‑2‑エニル、オキセタン‑3‑イル、チエタン‑3‑イル、1‑オキシド‑チエタン‑3‑イル、1, 1‑ジオキシド‑チエタン‑3‑イル、イソキサゾール‑3‑イルメチル、1, 2, 4‑トリアゾール‑3‑イルメチル、3‑メチルオキセタン‑3‑イルメチル、ベンジル、2, 6‑ジフルオロフェニルメチル、3‑フルオロフェニルメチル、2‑フルオロフェニルメチル、2, 5‑ジフルオロフェニルメチル、1‑フェニルエチル、4‑クロロフェニルエチル、2‑トリフルオロメチルフェニルエチル、1‑ピリジン‑2‑イルエチル、ピリジン‑2‑イルメチル、5‑フルオロピリジン‑2‑イルメチル、(6‑クロロ‑ピリジン‑3‑イル)メチル、ピリミジン‑2‑イルメチル、メトキシ、2‑エトキシエチル、2‑メトキシエチル、2‑(メチルスルファニル)エチル、1‑メチル‑2‑(エチルスルファニル)エチル、2‑メチル‑1‑(メチルスルファニル)プロパン‑2‑イル、メトキシカ

ルボニル、メトキシカルボニルメチル、 NH_2 、 N -エチルアミノ、 N -アリルアミノ、 N 、 N -ジメチルアミノ、 N 、 N -ジエチルアミノ、2-チエニルメチル、イソプロピル、イソブチル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、3-(メチルスルファニル)-シクロブチル、2-オキソ-2-[(2, 2, 2)-トリフルオロエチル]アミノ]エチル、1-(CF_3)シクロプロピル、2-メチルシクロプロピル、1, 1, 1-トリフルオロプロパン-2-イル、ブタ-2, 3-ジエン-1-イル、3-クロロプロプ-2-エン-1-イル、3-シアノチエンタン-3-イル、3-(メチルスルホニル)シクロブチル、4-フルオロフェニル、2-[(メチルスルフィニル)メチル]シクロブチル、3-メチルブタン-2-イル、2-(メチルスルホニル)シクロブチル、2-(ジメチルアミノ)エチルおよび2-メトキシエチルから選択され；または

10

Qは、フェニル、ナフチル、ピリダジン、ピラジン、ピリミジン、トリアジン、ピリジン、ピラゾール、チアゾールイソチアゾール、オキサゾール、イソオキサゾール、トリアゾール、イミダゾール、フラン、チオフエン、ピロール、オキサジアゾール、チアジアゾール、テトラゾールおよびテトラヒドロフランから選択され、その各々は、無置換であるか、またはVから独立して選択される1~4個の置換基で置換されており；

Vは、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、ジフルオロメチル、ヒドロキシル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチルヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロ-イソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロ-ジフルオロメトキシ、ジクロロ-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、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)-エチル、メチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルファニルおよびN, N-ジメチルアミノから選択される。

20

30

【0016】

実施形態10：実施形態1~9のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Qは、1-シアノ-シクロプロピル、ベンジル、シクロプロピル、2-チエニルメチル、カルバモチオイルシクロプロピル、ピリド-4-イル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メチルスルホニル、チエタン-3-イルおよび1-カルバモイルシクロプロピルから選択される。

【0017】

実施形態10. 1：実施形態1~9のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Qは、1-シアノ-シクロプロピル、ベンジルおよびシクロプロピルから選択される。

40

【0018】

実施形態11：実施形態1~10のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Wは、Oである。

【0019】

実施形態12：実施形態1~11のいずれか1つに記載の化合物または塩であり、ここで、

A^1 は、 CR^2 またはNであり；

A^2 は、 CR^3 またはNであり；

A^3 は、 CR^4 またはNであり；

A^4 は、 CR^5 またはNであり；

50

ただし、 A^1 、 A^2 、 A^3 および A^4 の3つ以下は、Nであり；
 R^2 および R^5 は、H、メチル、メトキシ、フルオロおよびクロロから独立して選択され；
 R^3 および R^4 は、H、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)-エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニルおよびトリフルオロメチルスルフィニルから独立して選択される。

10

【0020】

実施形態13：実施形態1～12のいずれか1つに記載の化合物または塩であり、ここで、

A^1 および A^4 は、CHであり；

A^2 は、CH、NまたはCFであり；

A^3 は、CN、CFまたはCClである。

【0021】

実施形態13. 1：実施形態1～12のいずれか1つに記載の化合物または塩であり、ここで、

20

A^1 は、CHまたはCFであり；

A^2 は、CHまたはNであり；

A^3 は、CCNまたはCClであり、

A^4 は、CHである。

【0022】

実施形態14：実施形態1～13のいずれか1つに記載の化合物または塩であり、ここで、

R^{6a} 、 R^{7a} および R^{8a} は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、メチルカルボニル、エチルカルボニル、トリフルオロメチルカルボニル、メチルスルファニル、メチルスルフィニル、メチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルファニルおよびトリフルオロメチルスルフィニルから独立して選択され；

30

R^{6b} 、 R^{7b} および R^{8b} は、Hまたはメチルから独立して選択される。

【0023】

実施形態15：実施形態1～14のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、

R^{6a} 、 R^{7a} および R^{8a} は、H、F、メチルおよびトリフルオロメトキシから独立して選択され；

40

R^{6b} 、 R^{7b} および R^{8b} は、Hおよびメチルから独立して選択される。

【0024】

実施形態15. 1：実施形態1～14のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、 R^{6a} 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 R^{6b} 、 R^{7b} および R^{8b} は、Hである。

【0025】

実施形態16：実施形態1～15のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、 Z^1 は、メチル、エチル、1, 1-ジメチルエチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、ブロモジクロロメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2

50

ーテトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロ-イソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-ブromoシクロプロピル、1-シアノ-シクロプロピル、1-トリフルオロメチル-シクロプロピル、シクロブチルおよび2, 2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピルから選択される。

【0026】

実施形態17：実施形態1～15のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、 Z^1 は、 $-CF_2CF_3$ である。

10

【0027】

実施形態18：実施形態1～17のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Uは、 C_{1-3} -ハロアルコキシおよび C_{2-4} -アルケニルから選択される。

【0028】

実施形態18. 1：実施形態1～17のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Uは、 $C_1\sim C_4$ -アルコキシ、 $C_1\sim C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_3\sim C_5$ -シクロアルコキシ、 $C_3\sim C_5$ -シクロアルキル、 $C_2\sim C_4$ -アルケニル、 $C_2\sim C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2\sim C_3$ -アルキニル、 $-S-C_3\sim C_5$ -シクロアルキル、 $-SO-C_3\sim C_5$ -シクロアルキル、 $-SO_2-C_3\sim C_5$ -シクロアルキル、 $-O-C_2\sim C_4$ -アルケニル、 $-O-C_2\sim C_4$ -ハロアルケニル、 $-NHCN$ 、 $-SO_2F$ およびOHから選択される。

20

【0029】

実施形態19：実施形態1～17のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Uは、 $-OCHF_2$ 、 $-OCH_2CF_3$ 、 $-OCH_3$ 、 $-O$ -シクロプロピル、シクロプロピル、OH、 $-O-CH=CH_2$ 、 $-CH=CH_2$ 、 $-C\equiv CH$ 、 $-S$ -シクロプロピル、 $-O-CF=CF_2$ 、 $-O-SO_2-F$ 、 $-NHCN$ 、 $-SO_2$ -シクロプロピル、 $-SO$ -シクロプロピル、 $-O-CF_2-CF_2H$ 、 $-OEt$ 、 $-O-CH_2-CF_2H$ 、 $-O-CF_2CF_2CF_3$ 、 $-O-CF_2CFHCF_3$ および $-CF_2CF_3$ から選択される。

【0030】

実施形態20：実施形態1～17のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、Uは、 $-OCHF_2$ 、 $-CH=CH_2$ および $-C\equiv CH$ 、特に $-OCHF_2$ から選択される。

30

【0031】

実施形態21：実施形態1～20のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、 Z^3 は、H、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、エテニル、1-プロペニル、シクロプロピル、1-プロピニル、1-ブチニル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、1フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル、4- NO_2 -フェニルおよび3-クロロ-ピリジン-2-イルから選択される。

40

【0032】

実施形態22：実施形態1～20のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、 Z^3 は、メチルである。

【0033】

実施形態23：実施形態1～4のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、 R^1 は、Hであり；

Qは、1-シアノ-シクロプロピル、ベンジル、シクロプロピル、2-チエニルメチル、

50

ルバモチオイルシクロプロピル、ピリド-4-イル、2, 2, 2-トリフルオルエチル、メチルスルホニル、チエタン-3-イルおよび1-カルバモチオイルシクロプロピルから選択され；

Wは、Oであり；

A¹は、CR²またはNであり；

A²は、CR³またはNであり；

A³は、CR⁴またはNであり；

A⁴は、CR⁵またはNであり；

ただし、A¹、A²、A³およびA⁴の3個以下は、Nであり；

R²およびR⁵は、H、メチル、メトキシ、フルオロおよびクロロから独立して選択され；

R³およびR⁴は、H、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)-エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニルおよびトリフルオロメチルスルフィニルから独立して選択され；

Z¹は、メチル、エチル、1, 1-ジメチルエチル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、ブロモジクロロメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、1-クロロ-1, 2, 2, 2-テトラフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエチル、1, 1-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチル、ヘプタフルオロ-n-プロピル、ヘプタフルオロ-イソプロピル、ノナフルオロ-n-ブチル、シクロプロピル、1-クロロシクロプロピル、1-フルオロシクロプロピル、1-ブロモシクロプロピル、1-シアノ-シクロプロピル、1-トリフルオロメチル-シクロプロピル、シクロブチルおよび2, 2-ジフルオロ-1-メチル-シクロプロピルから選択され；

Uは、-OCHF₂、-OCH₂CF₃、-OCH₃、-O-シクロプロピル、シクロプロピル、OH、-O-CH=CH₂、-CH=CH₂、-C≡CH、-S-シクロプロピル、-O-CF=CF₂、-O-SO₂-F、-NH-CN、-SO₂-シクロプロピル、-SO-シクロプロピル、-O-CF₂-CF₂H、-OEt、-O-CH₂-CF₂H、-O-CF₂CF₂CF₃、-O-CF₂CFHCF₃および-CF₂CF₃から選択され；

Z³は、H、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチル、エテニル、1-プロペニル、1-プロピニル、シクロプロピル、1-ブチニル、ジフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、1-フルオロ-1-メチルエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、フェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル、4-NO₂-フェニルおよび3-クロロ-ピリジン-2-イルから選択される。

【0034】

実施形態24：実施形態1～4のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで、R¹は、Hであり；

Qは、1-シアノ-シクロプロピル、ベンジル、シクロプロピル、2-チエニルメチル、カルバモチオイルシクロプロピル、ピリド-4-イル、2, 2, 2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

、メチルスルホニル、チエタン-3-イルおよび1-カルバモイルシクロプロピルから選択され；

Wは、Oであり；

A¹は、CR²またはNであり；

A²は、CR³またはNであり；

A³は、CR⁴またはNであり；

A⁴は、CR⁵またはNであり；

ただし、A¹、A²、A³およびA⁴の3個以下は、Nであり；

R²およびR⁵は、H、メチル、フルオロおよびクロロから独立して選択され；

R³およびR⁴は、H、フルオロ、クロロ、ブロモ、ヨード、シアノ、ニトロ、メチル、エチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2, 2-ジフルオロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、N-メトキシイミノメチル、1-(N-メトキシイミノ)-エチル、メチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、メチルスルホニル、メチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルホニルおよびトリフルオロメチルスルフィニルから独立して選択され；

Z¹は、-CF₂CF₃であり；

Uは、-OCHF₂、-CH=CH₂および-C≡CH、特に-OCHF₂から選択され；

Z³は、メチルである。

【0035】

実施形態25：実施形態1～24のいずれか1つに係る化合物または塩であり、ここで

R^{6a}、R^{7a}およびR^{8a}は、H、メチルおよびトリフルオロメトキシから独立して選択され；

R^{6b}、R^{7b}およびR^{8b}は、Hおよびメチルから独立して選択される。

R¹は、Hであり；

Qは、1-シアノシクロプロピル、ベンジル、シクロプロピル、2-チエニルメチル、カルバモチオイルシクロプロピル、ピリド-4-イル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、メチルスルホニル、チエタン-3-イルおよび1-カルバモイルシクロプロピルから選択され；

Wは、Oであり；

A¹およびA⁴は、CHであり；

A²は、N、CHまたはCFであり；

A³は、CH、CFまたはCClであり；

Z¹は、-CF₂CF₃であり；

Uは、-OCHF₂、-CH=CH₂および-C≡CH、特に-OCHF₂から選択され；

Z³は、メチルである。

【0036】

実施形態25. 1：以下から選択される、実施形態1に係る化合物または塩である。

【0037】

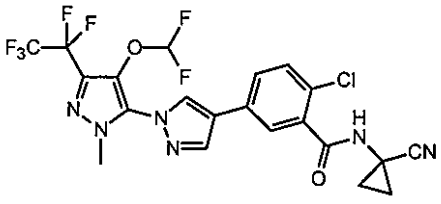
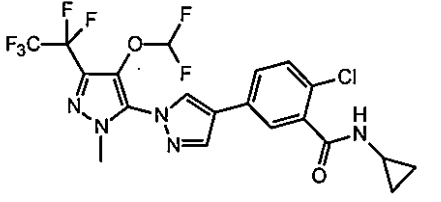
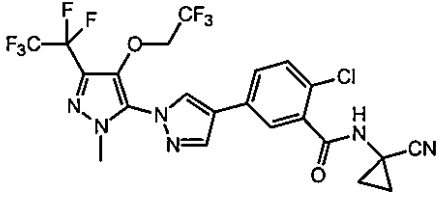
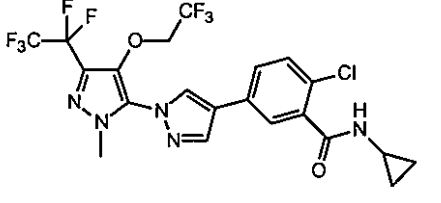
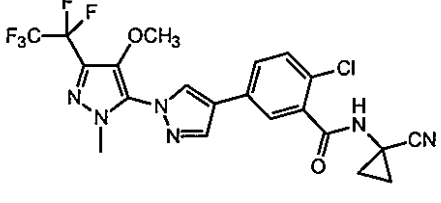
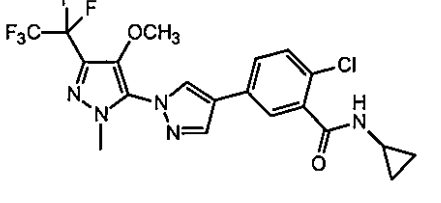
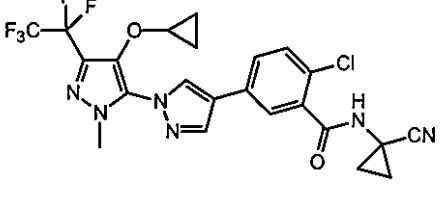
10

20

30

40

【表 1 - 1】

1	
2	
3	
4	
5	
6	
7	

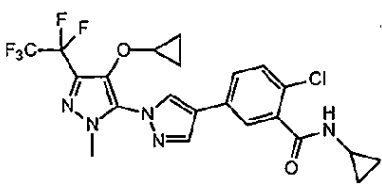
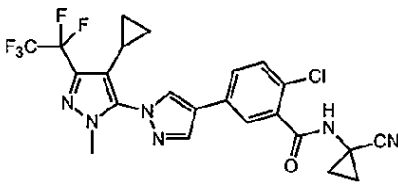
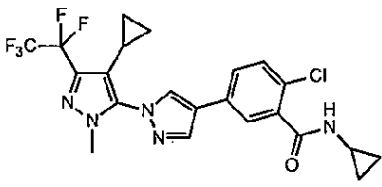
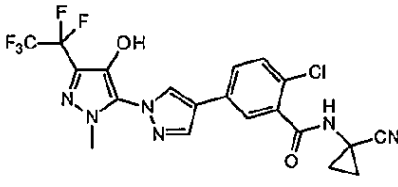
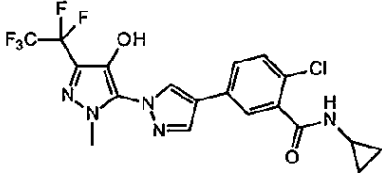
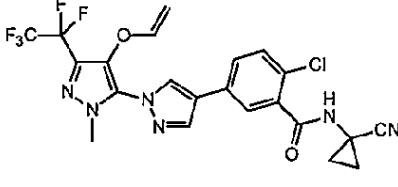
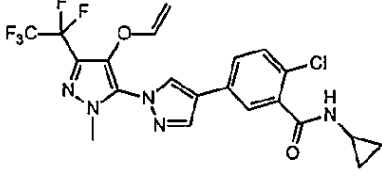
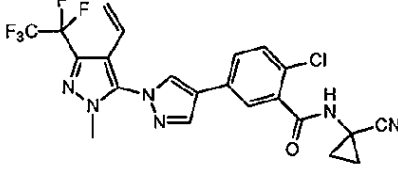
10

20

30

40

【表 1 - 2】

8	
9	
10	
11	
12	
13	
14	
15	

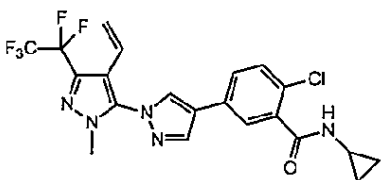
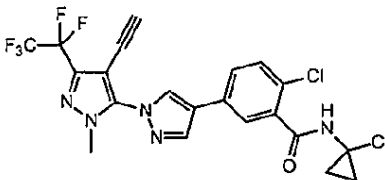
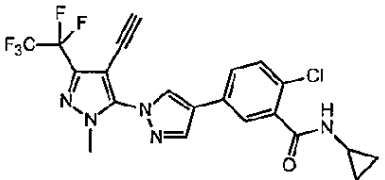
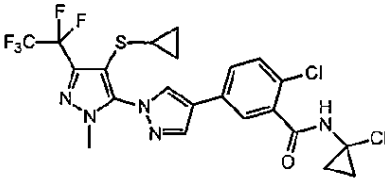
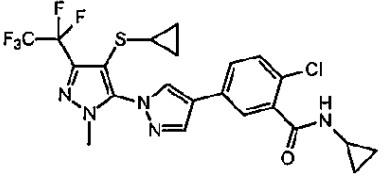
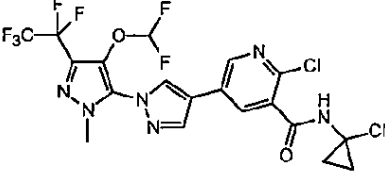
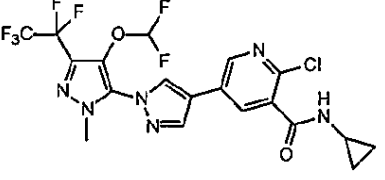
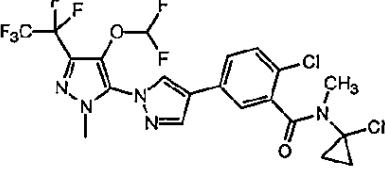
10

20

30

40

【表 1 - 3】

16	
17	
18	
19	
20	
21	
22	
23	

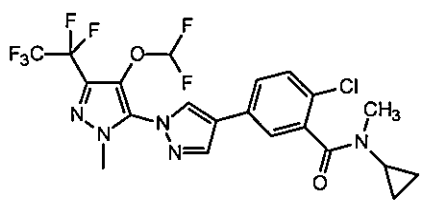
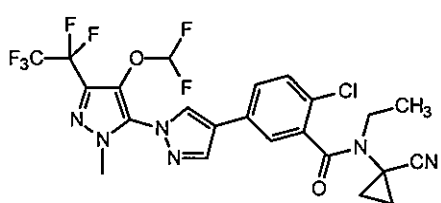
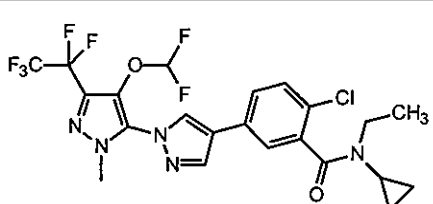
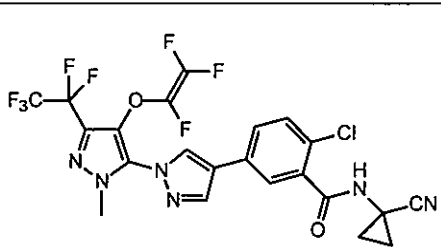
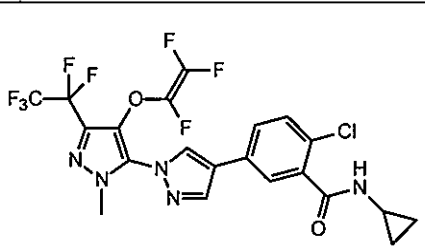
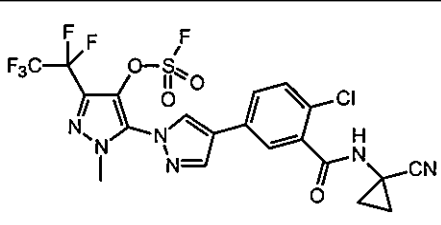
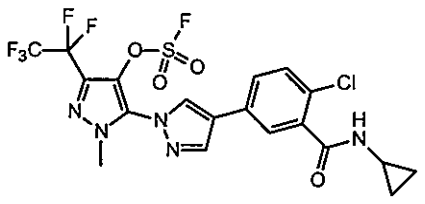
10

20

30

40

【表 1 - 4】

24	
25	
26	
27	
28	
29	
30	

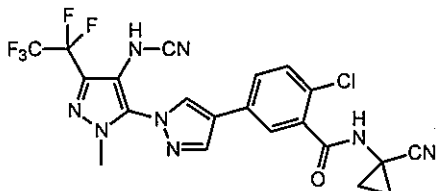
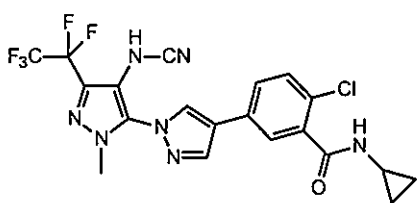
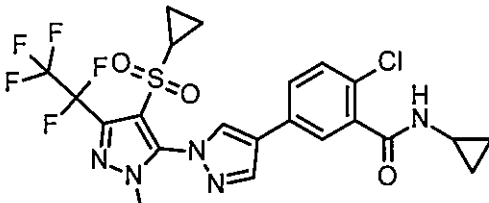
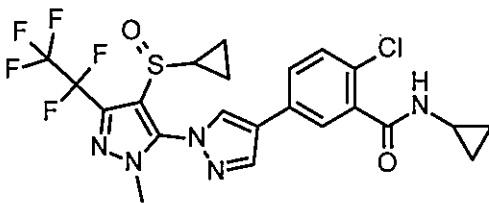
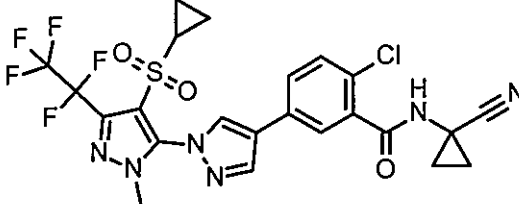
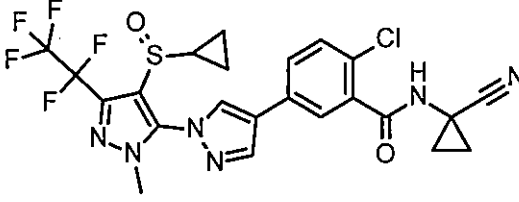
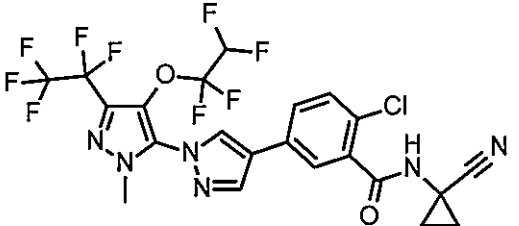
10

20

30

40

【表 1 - 5】

31	
32	
33	
34	
35	
36	
37	

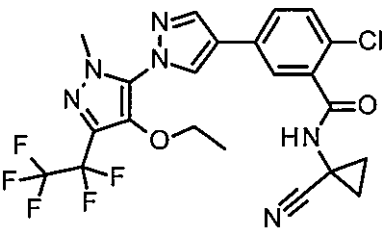
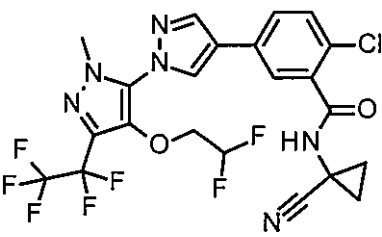
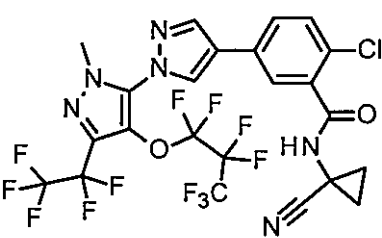
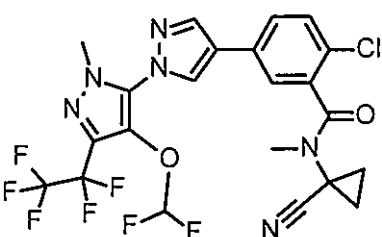
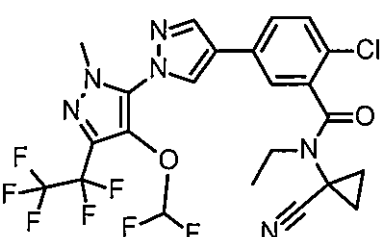
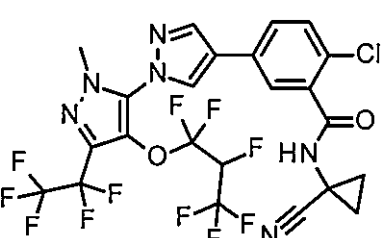
10

20

30

40

【表 1 - 6】

38	
39	
40	
41	
42	
43	

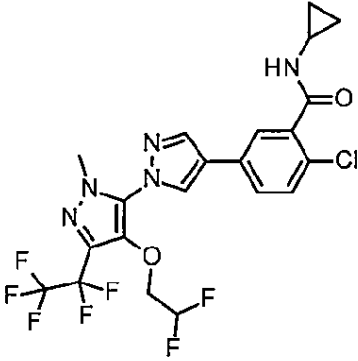
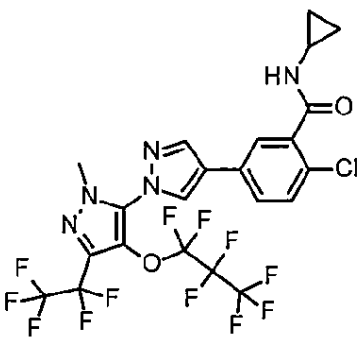
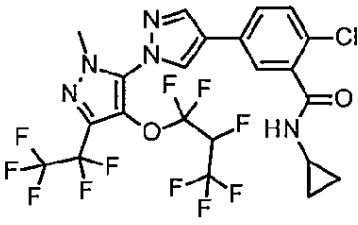
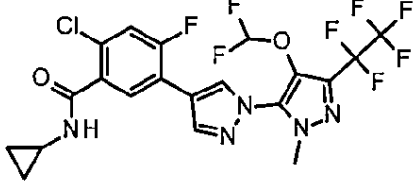
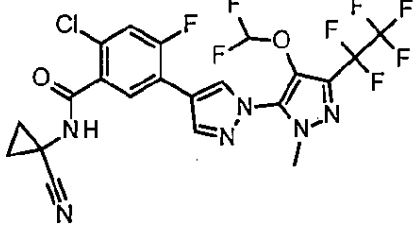
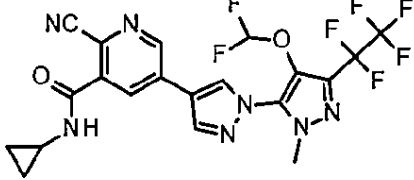
10

20

30

40

【表 1 - 7】

44	
45	
46	
47	
48	
49	

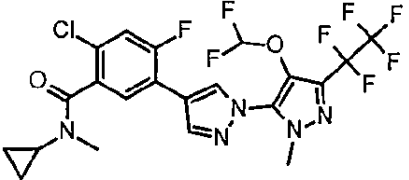
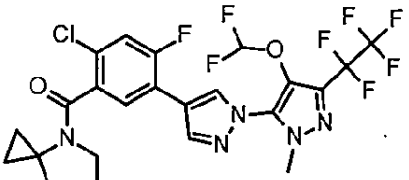
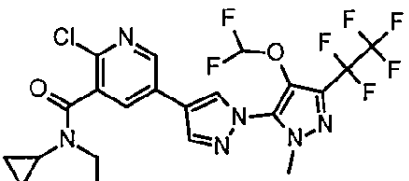
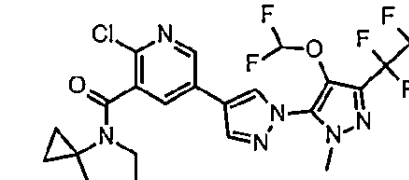
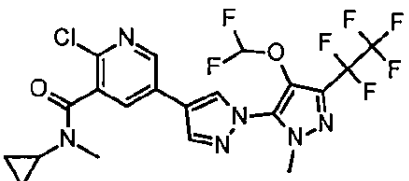
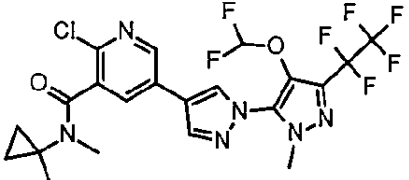
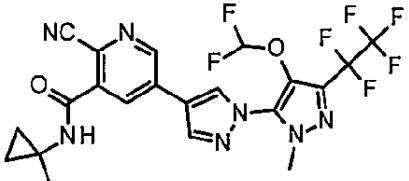
10

20

30

40

【表 1 - 8】

50	
51	
52	
53	
54	
55	
56	

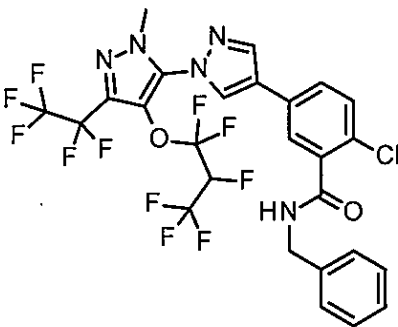
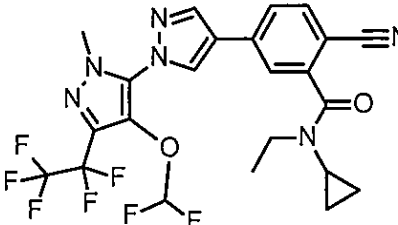
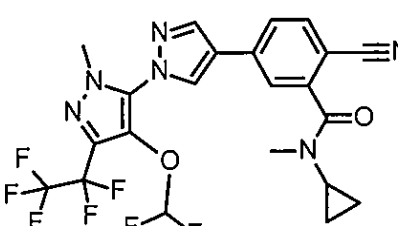
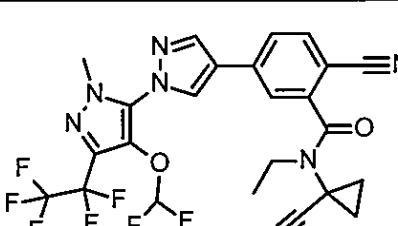
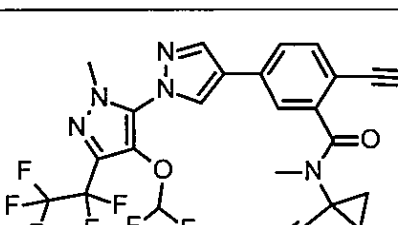
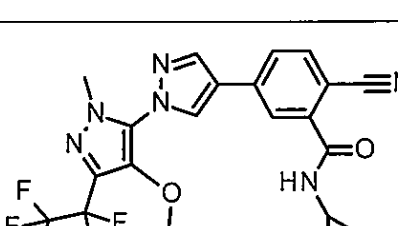
10

20

30

40

【表 1 - 9】

57	
58	
59	
60	
61	
62	

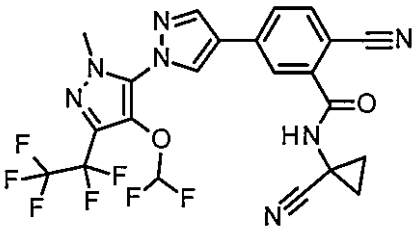
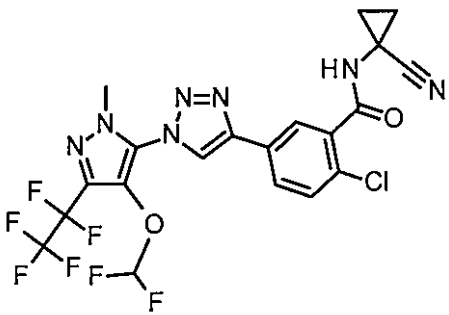
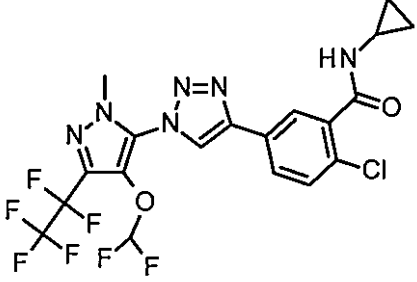
10

20

30

40

【表 1 - 1 0】

63	
64	
65	

10

20

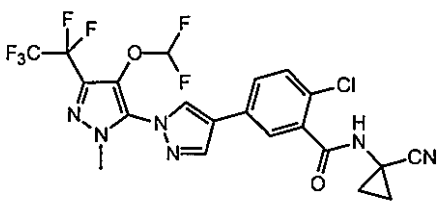
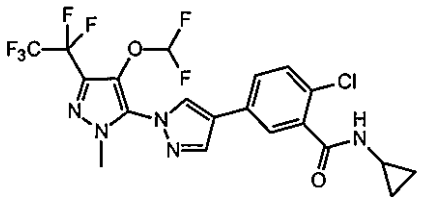
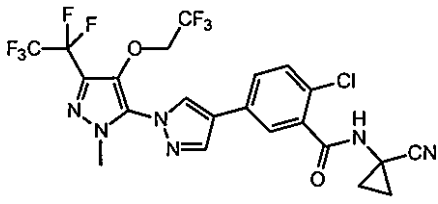
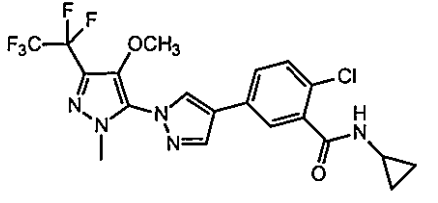
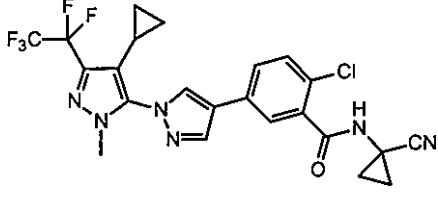
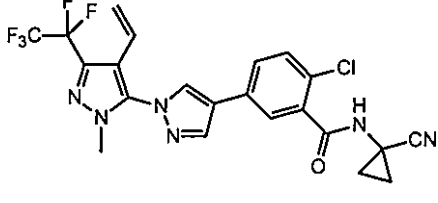
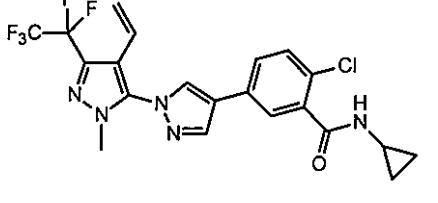
【 0 0 3 8 】

実施形態 2 5 . 2 : 以下から選択される、実施形態 1 に係る化合物または塩である。

30

【 0 0 3 9 】

【表 2 - 1】

1	
2	
3	
6	
9	
15	
16	

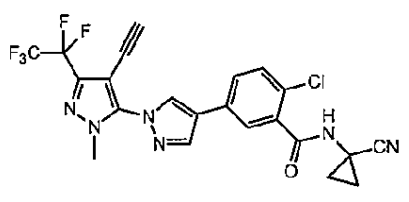
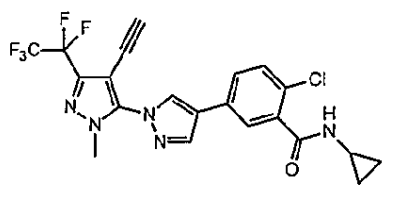
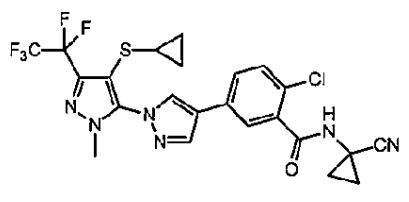
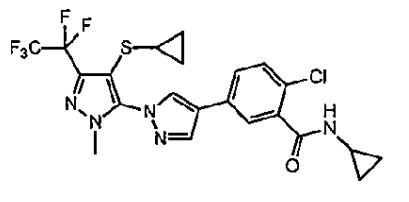
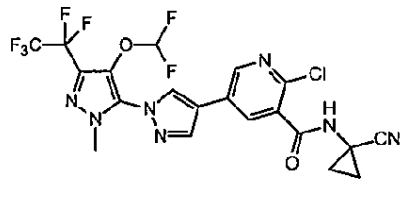
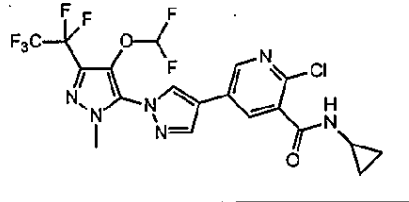
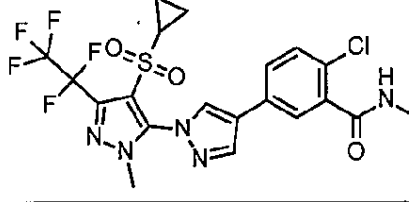
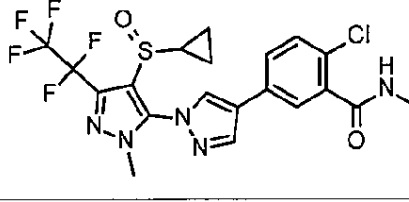
10

20

30

40

【表 2 - 2】

17	
18	
19	
20	
21	
22	
33	
34	

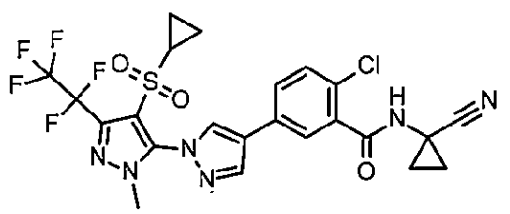
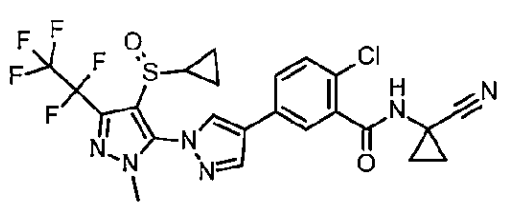
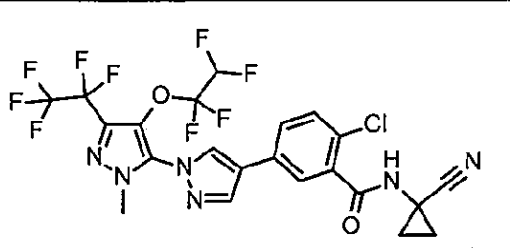
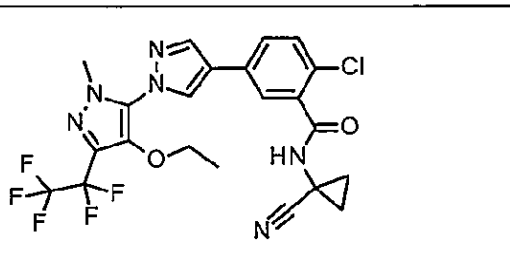
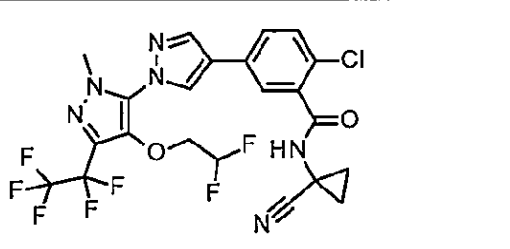
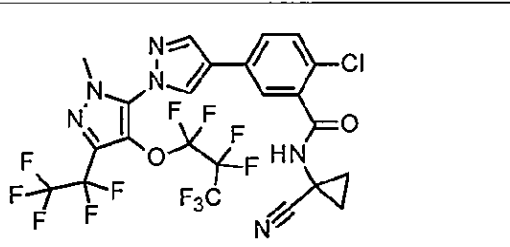
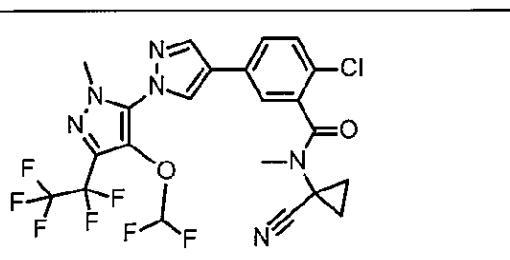
10

20

30

40

【表 2 - 3】

35	
36	
37	
38	
39	
40	
41	

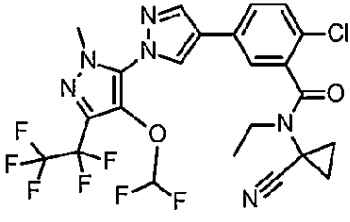
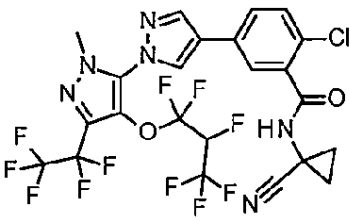
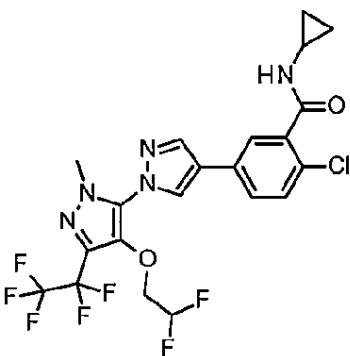
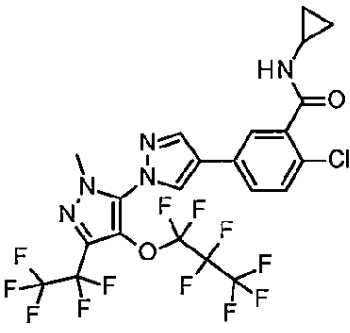
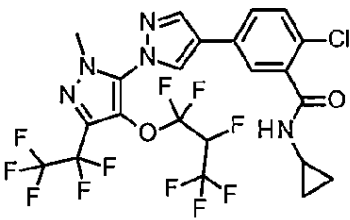
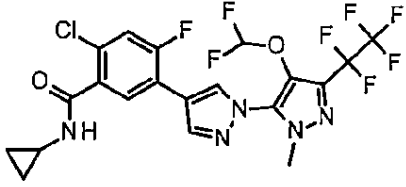
10

20

30

40

【表 2 - 4】

42	
43	
44	
45	
46	
47	

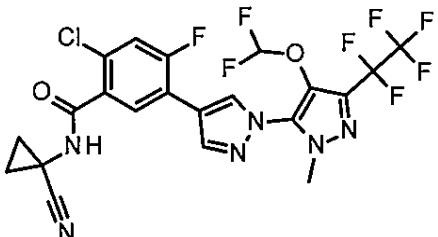
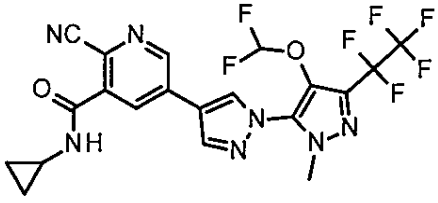
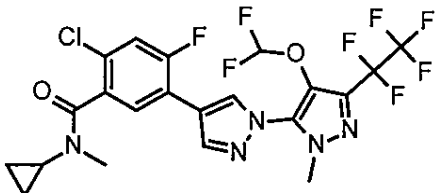
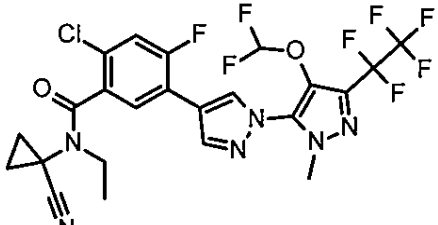
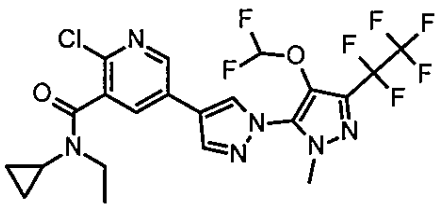
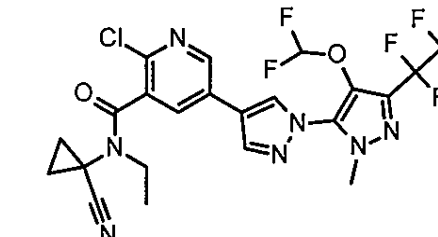
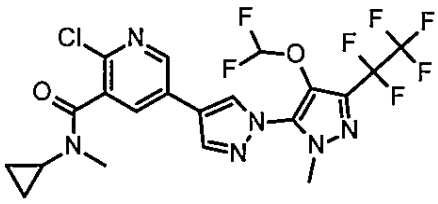
10

20

30

40

【表 2 - 5】

48	
49	
50	
51	
52	
53	
54	

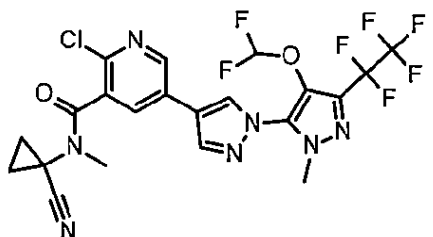
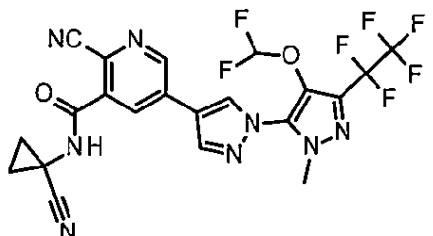
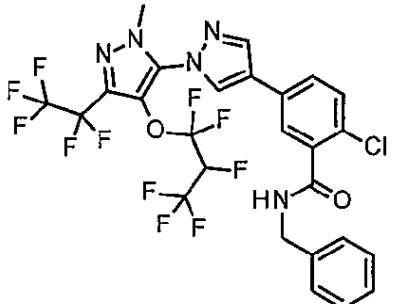
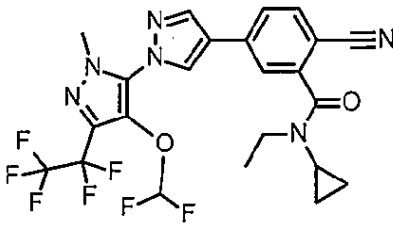
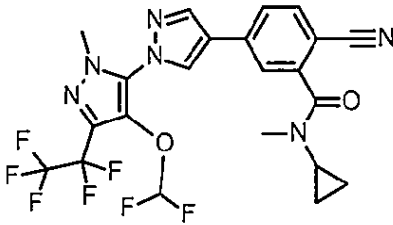
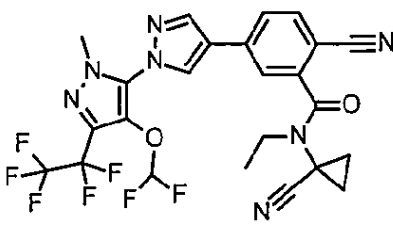
10

20

30

40

【表 2 - 6】

55	
56	
57	
58	
59	
60	

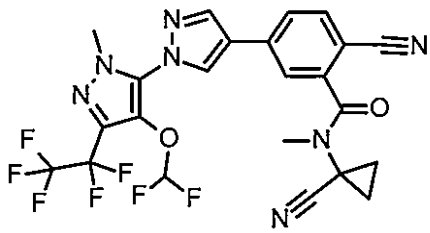
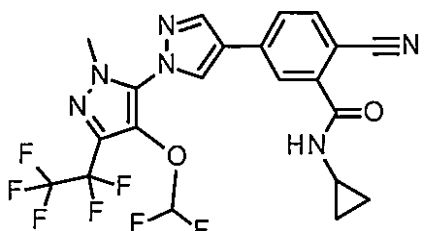
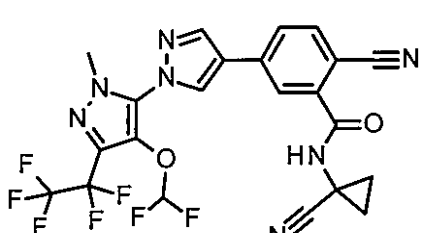
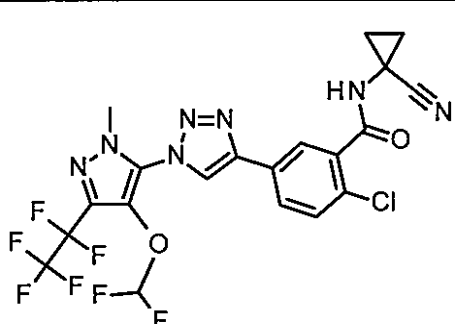
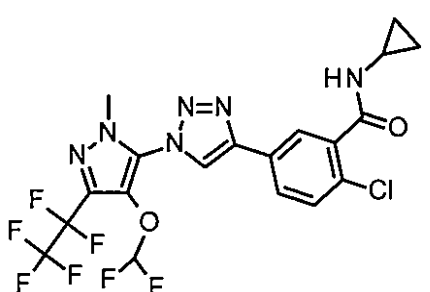
10

20

30

40

【表 2 - 7】

61	
62	
63	
64	
65	

10

20

30

40

【発明を実施するための形態】

【0040】

定義：

本明細書において用いられる場合、「アルキル」という用語は（単独でまたは化学基の一部として）、好ましくは1～6個の炭素原子を有する直鎖または分岐炭化水素、例えばメチル、エチル、*n*-プロピル、イソプロピル、*n*-ブチル、イソブチル、*s*-ブチル、*t*-ブチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1，

50

2-ジメチルプロピル、1, 1-ジメチルプロピル、2, 2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1, 2-ジメチルプロピル、1, 3-ジメチルブチル、1, 4-ジメチルブチル、2, 3-ジメチルブチル、1, 1-ジメチルブチル、2, 2-ジメチルブチル、3, 3-ジメチルブチル、1, 1, 2-トリメチルプロピル、1, 2, 2-トリメチルプロピル、1-エチルブチルおよび2-エチルブチルを表す。例えばメチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、イソブチル、s-ブチルまたはt-ブチルといった1~4個の炭素原子を有するアルキル基が好ましい。

【0041】

「アルケニル」という用語は（単独でまたは化学基の一部として）、好ましくは2~6個の炭素原子および少なくとも1つの二重結合を有する直鎖または分岐炭化水素、例えばビニル、2-プロペニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1, 1-ジメチル-2-プロペニル、1, 2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1, 1-ジメチル-2-ブテニル、1, 1-ジメチル-3-ブテニル、1, 2-ジメチル-2-ブテニル、1, 2-ジメチル-3-ブテニル、1, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 2-ジメチル-3-ブテニル、2, 3-ジメチル-2-ブテニル、2, 3-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1, 1, 2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニルおよび1-エチル-2-メチル-2-プロペニルを表す。例えば2-プロペニル、2-ブテニルまたは1-メチル-2-プロペニルといった2~4個の炭素原子を有するアルケニル基が好ましい。

【0042】

「アルキニル」という用語は、単独でまたは化学基の一部として、好ましくは2~6個の炭素原子および少なくとも1つの三重結合を有する直鎖または分岐炭化水素を表し、例えば2-プロピニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-プロピニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1, 1-ジメチル-2-プロピニル、1-エチル-2-プロピニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1, 1-ジメチル-3-ブチニル、1, 2-ジメチル-3-ブチニル、2, 2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-プロピニルおよび2, 5-ヘキサジイニルである。2~4個の炭素原子を有するアルキニルが好ましく、例えばエチニル、2-プロピニルまたは2-ブチニル-2-プロペニルである。

【0043】

「シクロアルキル」という用語は（単独でまたは化学基の一部として）、好ましくは3~10個の炭素原子を有する飽和または部分飽和単環式、二環式または三環式炭化水素、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビスシクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスシクロ[2.2.2]オクチルまたはアダマンチルを表す。

例えばシクロプロピルまたはシクロブチルといった3、4、5、6または7個の炭素原

子を有するシクロアルキルが好ましい。

【0044】

「ヘテロシクロアルキル」という用語は（単独でまたは化学基の一部として）、好ましくは3～10個の炭素原子を有する飽和または部分飽和単環式、二環式または三環式炭化水素、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、ビスクロ〔2, 2, 1〕ヘプチル、ビスクロ〔2, 2, 2〕オクチルまたはアダマンチルを表し、ここで、1個または複数個の環原子、好ましくは1～4個、より好ましくは1、2または3個の環原子は、N、O、S、P、B、SiおよびSeから、より好ましくはN、OおよびSから独立して選択され、ここで、O原子は、相互に隣接して位置することはできない。

10

【0045】

「アルキルシクロアルキル」という用語は、好ましくは4～10個または4～7個の炭素原子を有する単環式、二環式または三環式アルキルシクロアルキル、例えばエチルシクロプロピル、イソプロピルシクロブチル、3-メチルシクロペンチルおよび4-メチルシクロヘキシルを表す。例えばエチルシクロプロピルまたは4-メチルシクロヘキシルといった4、5または7個の炭素原子を有するアルキルシクロアルキルが好ましい。

【0046】

「シクロアルキルアルキル」という用語は、好ましくは4～10個または4～7個の炭素原子を有する単環式、二環式または三環式シクロアルキルアルキル、例えばシクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチルおよびシクロペンチルエチルを表す。例えばシクロプロピルメチルまたはシクロブチルメチルといった4、5または7個の炭素原子を有するシクロアルキルアルキルが好ましい。

20

【0047】

「ハロゲン」または「ハロ」という用語は、フルオロ、クロロ、ブロモまたはヨード、特にフルオロ、クロロまたはブロモを表す。例えばハロアルキル、ハロシクロアルキル、ハロアルキルオキシ、ハロアルキルスルファニル、ハロアルキルスルフィニルまたはハロアルキルスルホニルといったハロゲンで置換された化学基は、1個または置換基の最大数以下のハロゲンで置換されている。「アルキル」、「アルケニル」または「アルキニル」がハロゲンで置換されている場合、ハロゲン原子は同一であることも異なっていることも可能であり、同一の炭素原子または異なる炭素原子に結合していることが可能である。

30

【0048】

「ハロシクロアルキル」という用語は、好ましくは3～10個の炭素原子を有する単環式、二環式または三環式ハロシクロアルキル、例えば1-フルオロシクロプロピル、2-フルオロシクロプロピルまたは1-フルオロシクロブチルを表す。3、5または7個の炭素原子を有するハロシクロアルキルが好ましい。

【0049】

「ハロアルキル」、「ハロアルケニル」または「ハロアルキニル」という用語は、ハロゲン、好ましくは同一または異なる1～9個のハロゲン原子で置換されたアルキル、アルケニルまたはアルキニルを表し、例えば $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CI}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 CHCICH_3 、 CHFCH_3 、 CH_2CI 、 CH_2F のようなモノハロアルキル（＝モノハロアルキル）； CCl_3 または CF_3 または CF_2CF_3 のようなパーハロアルキル； CHF_2 、 CH_2F 、 $\text{CH}_2\text{CHF}\text{CI}$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 CH_2CF_3 のようなポリハロアルキルである。ハロアルケニル、およびハロゲンによって置換されている他の基についても同様である。

40

【0050】

ハロアルコキシの例は、例えば OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 、 OCF_3 、 OCHF_2 、 OCH_2F 、 OCF_2CF_3 、 OCH_2CF_3 である。

【0051】

ハロアルキルのさらなる例は、トリクロロメチル、クロロジフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、2-クロロ-2,

50

2-ジフルオロエチル、ペンタフルオロエチルおよびペンタフルオロ-*t*-ブチルである。

【0052】

1～4個の炭素原子と、フルオロ、クロロまたはブロモから選択される1～9個、好ましくは1～5個の同一または異なるハロゲン原子とを有するハロアルキルが好ましい。

【0053】

1または2個の炭素原子と、フルオロまたはクロロから選択される1～5個の同一または異なるハロゲン原子を有するハロアルキル、例えばジフルオロメチル、トリフルオロメチルまたは2, 2-ジフルオロエチルが特に好ましい。

【0054】

「ヒドロキシアルキル」という用語は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルコール、例えばメタノール、エタノール、*n*-プロパノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、イソブタノール、*s*-ブタノールおよび*t*-ブタノールを表す。1～4個の炭素原子を有するヒドロキシアルキルが好ましい。

【0055】

「アルコキシ」という用語は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖O-アルキル、例えばメトキシ、エトキシ、*n*-プロポキシ、イソプロポキシ、*n*-ブトキシ、イソブトキシ、*s*-ブトキシおよび*t*-ブトキシを表す。1～4個の炭素原子を有するアルコキシが好ましい。

【0056】

「ハロアルコキシ」という用語は、好ましくは1～6個の炭素原子を有するハロゲンで置換された直鎖または分岐鎖O-アルキル、例えばジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2, 2-ジフルオロエトキシ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエトキシ、2, 2, 2-トリフルオロエトキシおよび2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエトキシを表す。

【0057】

1～4個の炭素原子を有するハロアルコキシが好ましい。

【0058】

「アルキルスルファニル」という用語は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖S-アルキル、例えばメチルチオ、エチルチオ、*n*-プロピルチオ、イソプロピルチオ、*n*-ブチルチオ、イソブチルチオ、*s*-ブチルチオおよび*t*-ブチルチオを表す。1～4個の炭素原子を有するアルキルスルファニルが好ましい。ハロアルキルスルファニル、すなわちハロゲン置換されたアルキルスルファニルの例は、例えばジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2, 2-ジフルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルチオ、2, 2, 2-トリフルオロエチルチオまたは2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルチオである。

【0059】

「アルキルスルフィニル」という用語は、好ましくは1～6個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキルスルフィニル、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、*n*-プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、*n*-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、*s*-ブチルスルフィニルおよび*t*-ブチルスルフィニルを表す。

【0060】

1～4個の炭素原子を有するアルキルスルフィニルが好ましい。

【0061】

ハロアルキルスルフィニル、すなわちハロゲン置換されたアルキルスルフィニルの例は、ジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、1-フルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2, 2-ジフルオロエチルスルフィニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルフィ

10

20

30

40

50

ニルおよび 2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルフィニルである。

【0062】

「アルキルスルホニル」という用語は、好ましくは 1～6 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキルスルホニル、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、s-ブチルスルホニルおよび t-ブチルスルホニルを表す。

【0063】

1～4 個の炭素原子を有するアルキルスルホニルが好ましい。

【0064】

ハロアルキルスルホニル、すなわちハロゲン置換されたアルキルスルホニルの例は、例えばジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、1-フルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2, 2-ジフルオロエチルスルホニル、1, 1, 2, 2-テトラフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2-トリフルオロエチルスルホニルおよび 2-クロロ-1, 1, 2-トリフルオロエチルスルホニルである。

【0065】

「アルキルカルボニル」という用語は、好ましくは 2～7 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキル-C(=O)、例えばメチルカルボニル、エチルカルボニル、n-プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、s-ブチルカルボニルおよび t-ブチルカルボニルを表す。

【0066】

1～4 個の炭素原子を有するアルキルカルボニルが好ましい。

【0067】

「シクロアルキルカルボニル」という用語は、シクロアルキル部分に好ましくは 3～10 個の炭素原子を有するシクロアルキル-カルボニル、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシル-カルボニル、シクロヘプチル-カルボニル、シクロオクチルカルボニル、ビスクロ[2, 2, 1]ヘプチル、ビスクロ[2, 2, 2]オクチルカルボニルおよびアダマンチルカルボニルを表す。シクロアルキル部分に 3, 5 または 7 個の炭素原子を有するシクロアルキルカルボニルが好ましい。

【0068】

「アルコキシカルボニル」という用語は（単独でまたは化学基の一部として）、アルコキシ部分に好ましくは 1～6 個の炭素原子または 1～4 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルコキシカルボニル、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、s-ブトキシカルボニルおよび t-ブトキシカルボニルを表す。

【0069】

「アルキルアミノカルボニル」という用語は、アルキル部分に好ましくは 1～6 個の炭素原子または 1～4 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖アルキルアミノカルボニル、例えばメチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、n-プロピルアミノカルボニル、イソプロピル-アミノカルボニル、s-ブチルアミノカルボニルおよび t-ブチルアミノカルボニルを表す。

【0070】

「N, N-ジアルキルアミノ-カルボニル」という用語は、アルキル部分に好ましくは 1～6 個の炭素原子または 1～4 個の炭素原子を有する直鎖または分岐鎖 N, N-ジアルキルアミノカルボニル、例えば N, N-ジメチルアミノ-カルボニル、N, N-ジエチルアミノ-カルボニル、N, N-ジ(n-プロピルアミノ)-カルボニル、N, N-ジ-(イソプロピルアミノ)-カルボニルおよび N, N-ジ-(s-ブチルアミノ)-カルボニルを表す。

【0071】

10

20

30

40

50

「アリール」という用語は、好ましくは6～14個、より好ましくは6～10個の環炭素原子を有する単環式、二環式または三環式芳香族系、例えばフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニル、好ましくはフェニルを表す。「アリール」はまた、多環式系、例えばテトラヒドロナフチル、インデニル、インダニル、フルオレニル、ビフェニルを表す。アリールアルキルが置換アリールの例であり、これは、アリールまたはアルキル部分の両方において同一または異なる置換基でさらに置換されていてもよい。ベンジルおよび1-フェニルエチルがこのようなアリールアルキルの例である。

【0072】

「ヘテロシクリル」、「複素環」または「複素環系」という用語は少なくとも1つの環を有する炭素環系を表し、この環において、少なくとも1個の炭素原子は、好ましくはN、O、S、P、B、Si、Seから選択されるヘテロ原子によって置換されており、ならびにこの環は飽和、不飽和または部分飽和であり、ならびにこの環は無置換であるか、または置換基Zで置換されており、ここで、結合するための結合は環原子に位置している。別段の定義がある場合を除き、複素環は、好ましくはN、OおよびSから選択される、好ましくは3～9個の環原子、好ましくは3～6個の環原子、ならびに1個または複数個、好ましくは1～4個、より好ましくは1、2または3個のヘテロ原子を複素環中に有し、ここで、O原子は相互に隣接して位置することはできない。複素環は通常、5個以上の窒素、および／または3個以上の酸素原子および／または3個以上の硫黄原子を含有しない。複素環式置換基または複素環がさらに置換されている場合は、他の複素環とさらに環化され得る。

【0073】

「複素環式」という用語はまた、例えば8-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタニルまたは1-アザ-ビシクロ[2.2.1]ヘプチルといった多環式系を含む。

【0074】

「複素環式」という用語はまた、例えば1-オキサ-5-アザスピロ[2.3]ヘキシルといったスピロ環式系を含む。

【0075】

ヘテロシクリルの例は、例えばピペリジニル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、ジオキサニル、ピロリニル、ピロリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、チアゾリジニル、オキサゾリジニル、ジオキサニル、ジオキサリル、ピラゾリジニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、オキセタニル、オキシラニル、アゼチジニル、アジリジニル、オキサゼチジニル、オキサジリジニル、オキサゼパニル、オキサジナニル、アゼパニル、オキソピロリジニル、ジオキソピロリジニル、オキソモルホリニル、オキソピペラジニルおよびオキセパニルである。

【0076】

ヘテロアリール、すなわち芳香族複素環式系が特に重要である。

【0077】

「ヘテロアリール」という用語は、ヘテロ芳香族基、すなわち、上記のヘテロ環の定義に定める完全不飽和芳香族複素環基を表す。「ヘテロアリール」は、N、OおよびSから選択される1～3個、好ましくは1または2個の同一または異なるヘテロ原子を有する5～7員環を有する。「ヘテロアリール」の例は、フリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、1,2,3-および1,2,4-トリアゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、1,2,3-、1,3,4-、1,2,4-および1,2,5-オキサジアゾリル、アゼピニル、ピロリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、1,3,5-、1,2,4-および1,2,3-トリアジニル、1,2,4-、1,3,2-、1,3,6-および1,2,6-オキサジニル、オキセピニル、チエピニル、1,2,4-トリアゾロニルおよび1,2,4-ジアゼピニルである。

【0078】

ハロゲン、一般にフッ素、塩素、臭素またはヨウ素である。これはまた、ハロアルキ

ルまたはハロフェニルなどの他の意味との組合せにおけるハロゲンにも対応して適用される。

【0079】

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

【0080】

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t-ブトキシ、ならびに異性体ペンチルオキシおよびヘキシルオキシラジカルである。

【0081】

アルコシアルキル基は、1～6個の炭素原子の鎖長を有することが好ましい。

【0082】

アルコシアルキルは、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、n-プロポキシメチル、n-プロポキシエチル、イソプロポキシメチルまたはイソプロポキシエチルである。

【0083】

アルコシカルボニルは、例えばメトシカルボニル(C₁アルコシカルボニルである)、エトシカルボニル、プロポシカルボニル、イソプロポシカルボニル、n-ブトシカルボニル、t-ブトシカルボニル、n-ペンタオキシカルボニルまたはヘキソキシカルボニルである。

【0084】

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。

【0085】

少なくとも1つの塩基性中心(basic centre)を有する実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物は、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、亜硝酸、リン酸またはハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるかまたは例えばハロゲンで置換される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実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩またはマグネシウム塩、またはアンモニアまたは有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-またはトリ-低級アルキルアミン、例えばエチルー、ジエチルー、トリエチルー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ー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。

【0086】

実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物はまた、塩形成の最中に形成され得る水和物も含む。

【0087】

実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物は、当業者に周知である多様な方法ま

10

20

30

40

50

たはスキーム 1～4 に示されている方法によって形成され得る。調製に関するさらなる説明は、国際公開第 2015/067646 号、国際公開第 2015/150442 号、国際公開第 2015/193218 号、国際公開第 2014/122083 号および国際公開第 2012/107434 号に見出すことが可能である。

【0088】

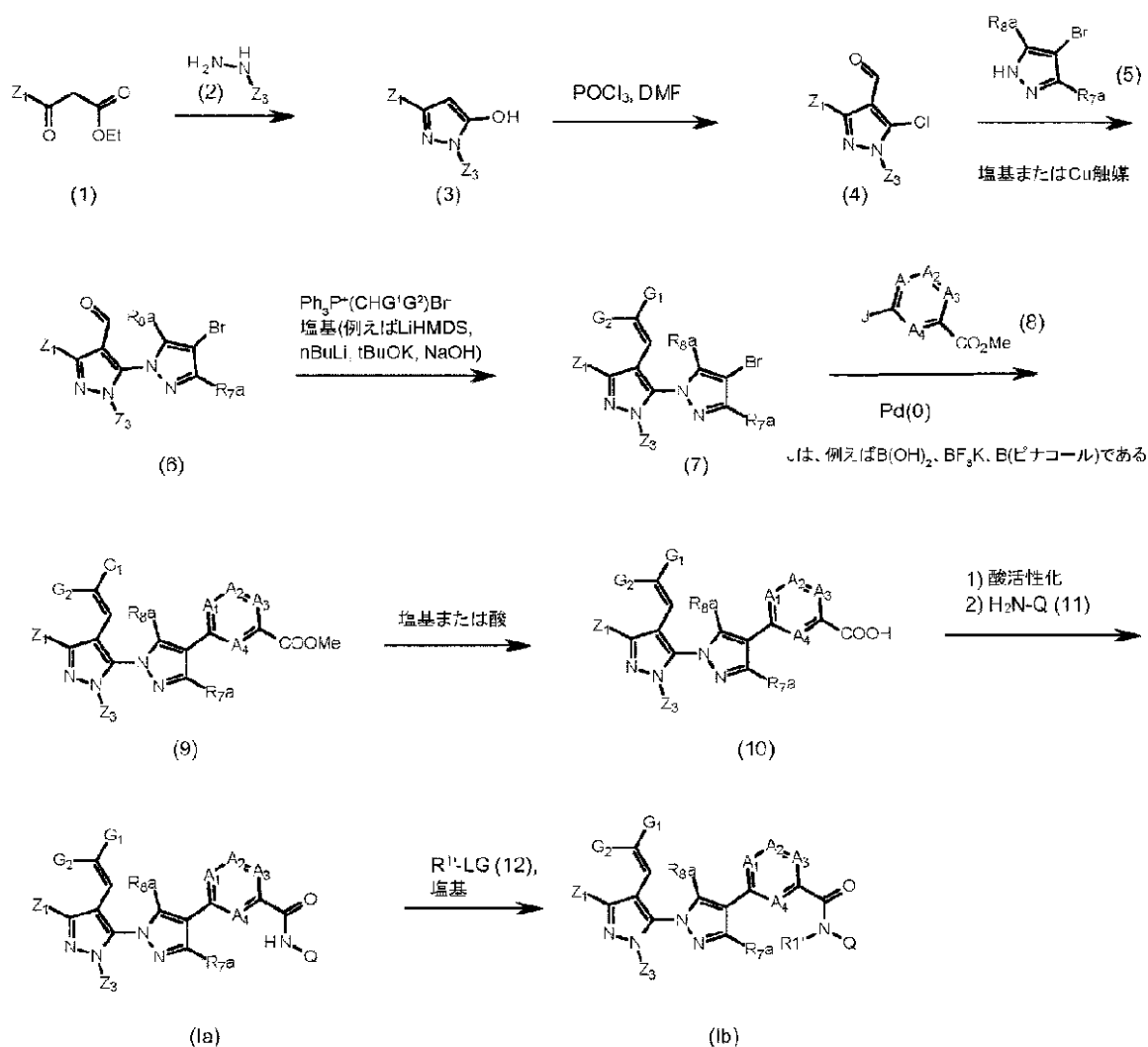
実施形態のいずれか 1 つに係る化合物は、当業者に公知の多様な方法またはスキーム 1～4 に示される方法によって形成され得る。

【0089】

例えば、式 (I a) または (I b) の化合物は、スキーム 1 に従って調製可能である。

【化 12】

スキーム 1:



式中、 R^1 、 Q 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 Z^1 および Z^3 は、実施形態 1～25 のいずれか 1 つにおいて定義されているとおりであり、 G^1 および G^2 は、 H 、ハロゲン、 C_{1-2} -アルキルまたは C_{1-2} -ハロアルキルから独立して選択され、 $\text{R}^{1'}$ は、 R^1 と同様であるが、 H ではない。式 (1)、(2)、(5)、(8)、(11) の化合物または $\text{Ph}_3\text{P}^+(\text{CHG}^1\text{G}^2)\text{Br}$ は、市販されているか、または化学文献から公知である。式 (3) の化合物は、例えば米国特許第 5536701 号明細書に記載のプロセスに従って調製可能である。式 (4) の化合物は、*Synth. Commun.* 2004, 34, 1541 (ビルスマイヤー反応) に従って調製可能である。式 (7) の化合物は、*Org. Lett.* 2014, 16, 6120 または国際公開第 2012/069948 号 (ウィッ

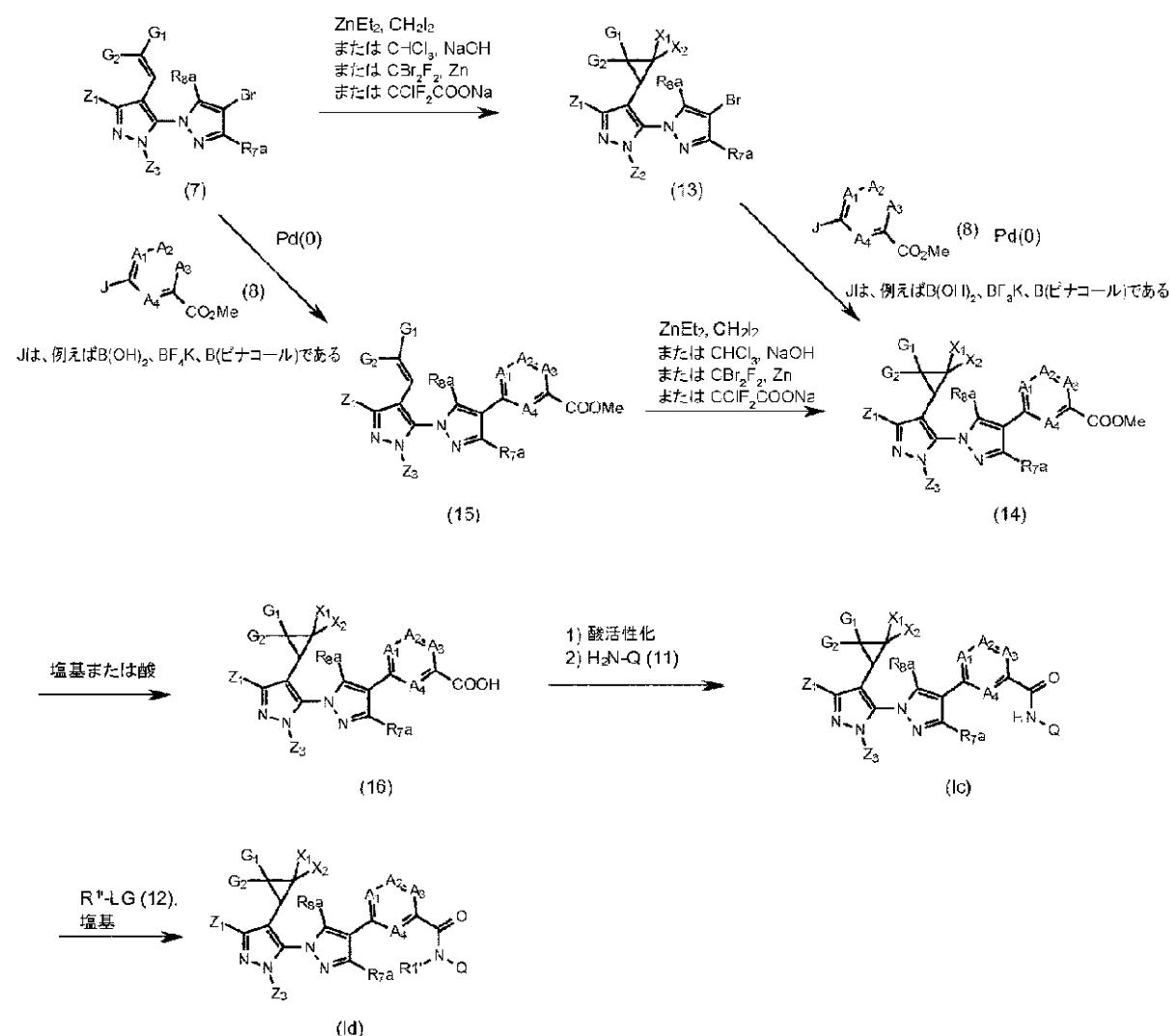
ティヒオレフィン化)に従って調製可能である。式(9)の化合物は、N. Miyaura, A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483またはG. A. Molander, L. Jean-Gerard, Org. React. 2013, 79, 1-316に記載されているとおり、式(7)の化合物とボロン酸、エステル(例えばピナコールエステル)または式(8)のトリフルオロボレートとの古典的なスズキカップリングにより入手可能である。

【0090】

式(Ic)または(I d)の化合物は、スキーム2に従って調製可能である。

【化13】

スキーム2:



式中、 R^1 、 Q 、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 R_{7a} 、 R_{8a} 、 Z^1 および Z^3 は、実施形態のいずれか1つにおいて定義されているとおりであり、 G^1 および G^2 は、H、ハロゲン、 C_{1-2} -アルキルまたは C_{1-2} -ハロアルキルから独立して選択され、 X^1 および X^2 は、H、Cl、FまたはBrから独立して選択され、 $R^{1'}$ は、 R^1 と同様であるが、Hではない。式(7)の化合物の調製は、スキーム1に記載されている。式(13)または(14)の化合物は、式(7)または(15)の化合物から、例えば国際公開第03097637号、Synthesis 2015, 47, 1593 ($ZnEt_2$ 、 CH_2I_2 、シモンズスミス反応)、国際公開第09024614号、Organometallics, 2009, 28, 2646 ($CHCl_3$ 、 $NaOH$ 、TBAB)、国際公開第06082001号、

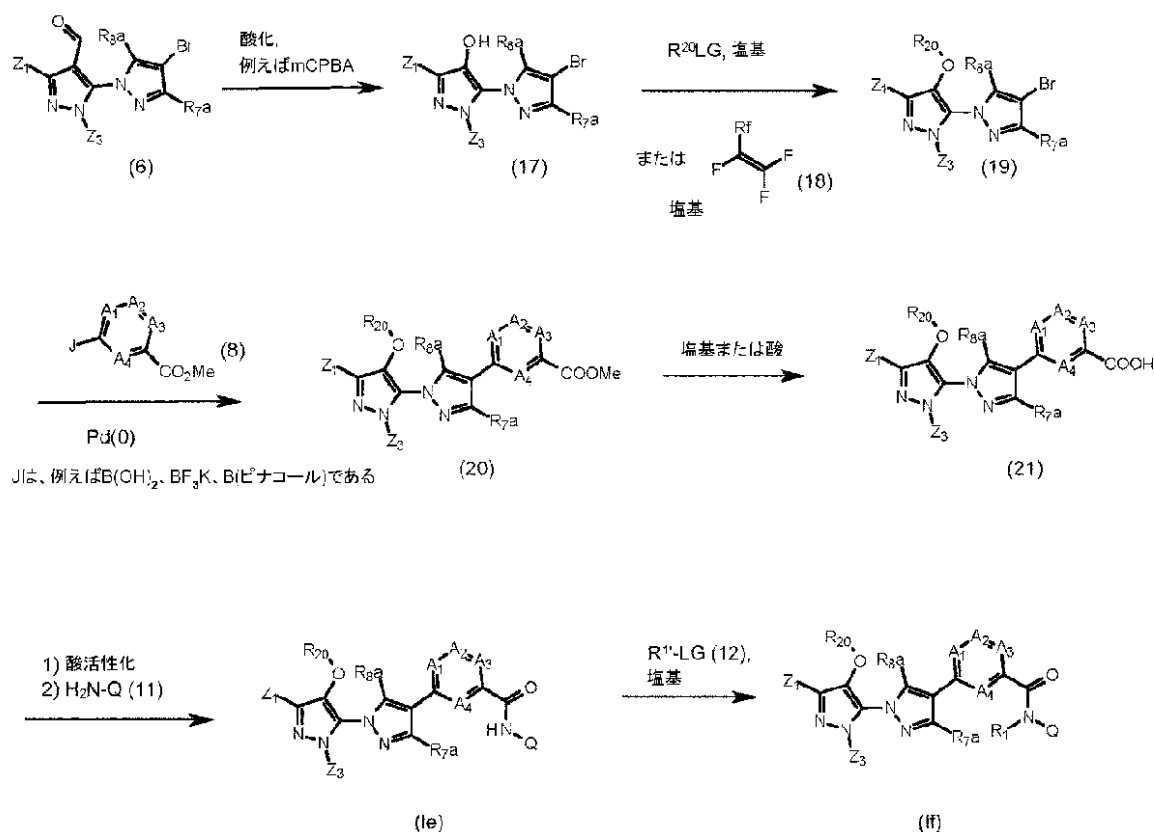
J. Fluorine Chem. 2002, 115, 79 (CBr₂F₂, Zn) または国際公開第04042845号 (CClF₂COONa) に記載されている公知のプロセスに従って調製可能である。式(14)または(15)の化合物は、N. Miyaura, A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483 または G. A. Molander, L. Jean-Gerard, Org. React. 2013, 79, 1-316 に記載されているとおり、式(13)または(7)の化合物と、ボロン酸、エステル(例えばピナコールエステル)または式(8)のトリフルオロボレートとの古典的なスズカップリングにより入手可能である。

【0091】

式(Ie)または(I f)の化合物は、スキーム3に従って調製可能である。

【化14】

スキーム3:



式中、R¹、Q、A¹、A²、A³、A⁴、R^{7a}、R^{8a}、Z¹およびZ³は、実施形態1~25のいずれか1つにおいて定義されているとおりであり、R^{1'}は、R¹と同様であるが、Hではない。R²⁰は、C₁₋₃-アルキル、C₁₋₃-ハロアルキル、C₃₋₅-シクロアルキル、C₃₋₅-ハロシクロアルキルである。R^fは、Fまたはフッ素化C₁₋₃-アルキルであり、LGは、例えばハロゲン、OMs(メシレート)、OTs(トシレート)、OTf(トリフレート)といった脱離基である。

【0092】

式(6)の化合物の調製は、スキーム1に記載されている。式(17)の化合物は、例えば国際公開第07060525号に記載のプロセス(バイエルービリガー酸化)に従って調製可能である。式(19)の化合物は、式(17)の化合物とR²⁰LGまたは式(18)の化合物とを、NaH、NaHCO₃、Na₂CO₃、DBUなどの塩基の存在下でTHF、CH₃CN、DMF、DMAなどの溶剤中において反応させることにより入手可能である。LGは、例えばハロゲン、OMs、OTs、OTfといった脱離基である。式(

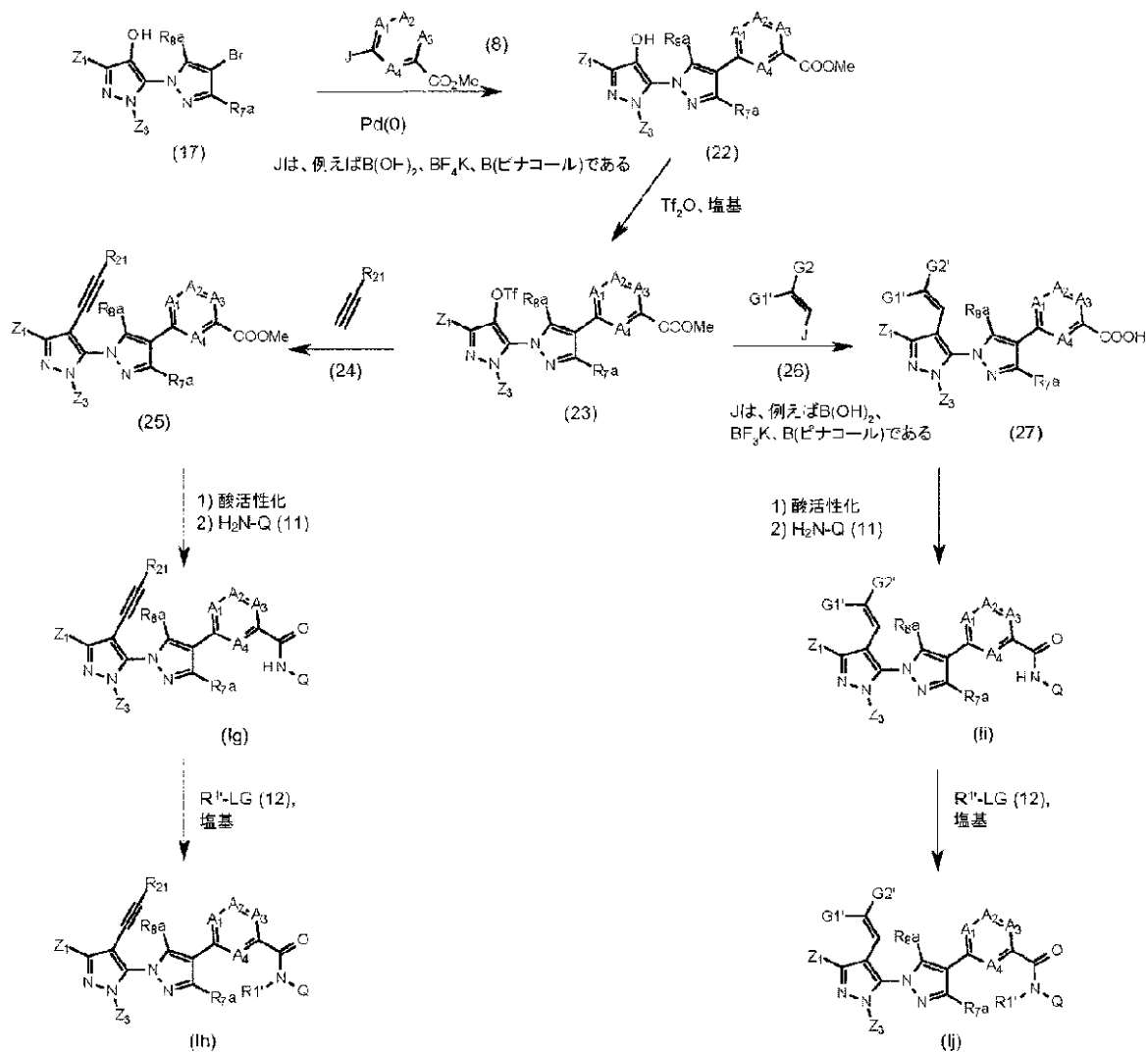
20) の化合物は、N. Miyaura, A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483 または G. A. Molander, L. Jean-Gerard, Org. React. 2013, 79, 1-316 に記載されているとおり、式(19)の化合物と、ボロン酸、エステル(例えばピナコールエステル)または式(8)のトリフルオロボレートとの古典的なスズキカップリングにより入手可能である。

【0093】

式(Ig)、(Ih)、(Ii)または(Ij)の化合物は、スキーム4に従って調製可能である。

【化15】

スキーム4:



式中、R¹、Q、A¹、A²、A³、A⁴、R^{7a}、R^{8a}、Z¹およびZ³は、実施形態のいずれか1つにおいて定義されているとおりであり、G^{1'}およびG^{2'}は、独立して、HまたはC₁₋₂-アルキルであり、R²¹は、HまたはCH₃であり；R^{1'}は、R¹と同様であるが、Hではない。

【0094】

式(17)の化合物の調製は、スキーム3に記載されている。式(22)の化合物は、N. Miyaura, A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457-2483 または G. A. Molander, L. Jean-Gerard, Org. React. 2013, 79, 1-316 に記載されているとおり、式(17)の化合物と、ボロン酸、エステルまたは式(8)のトリフルオロボレートとの古典的なスズキカップ

リングにより入手可能である。式(25)の化合物は、式(23)の化合物および式(24)の化合物のクロスカップリングによって入手可能である(例えばChem. Rev. 2007, 107, 874-922、菌頭反応)。式(27)の化合物は、式(26)の化合物の式(26)の化合物によるクロスカップリング(スズキカップリング)によって入手可能である。

【0095】

25に記載の化合物は、実施形態1~25のいずれか1つに記載の出発化合物の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、実施形態1~25のいずれか1つに記載の別の化合物へとそれ自体公知の方法で転化され得る。

【0096】

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。

【0097】

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。従って、例えば、実施形態1~25のいずれか1つに記載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。

【0098】

実施形態1~25のいずれか1つに記載の化合物の塩は、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。

【0099】

実施形態1~25のいずれか1つに記載の化合物の塩は、例えば塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従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、実施形態1~25のいずれか1つに記載の化合物の他の塩、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。

【0100】

手順または反応条件に応じて、塩形成特性を有する実施形態1~25のいずれか1つに記載の化合物が、遊離形態または塩の形態で得られる。

【0101】

実施形態1~25のいずれか1つに記載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立体異性体の形態で、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立体異性体混合物として、可能な異性体の1つの形態でまたはこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な立体異性体に関し、可能な全ての立体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。

【0102】

実施形態1~25のいずれか1つに記載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。

【0103】

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

10

20

30

40

50

、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、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（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。

10

【0104】

純粋なジアステレオマーまたは鏡像異性体は、本発明に従って、好適な立体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。

【0105】

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、実施形態1～25のいずれか1つに記載の式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., 32(12), 2561-73, 1989または国際公開第00/15615号といった文献から公知である。

20

【0106】

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立体異性体、例えば鏡像異性体またはジアステレオマー、または立体異性体混合物、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。

【0107】

実施形態1～25のいずれか1つに記載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。

30

【0108】

以下の実施例は本発明を例示するものであり、限定するものではない。

【0109】

本発明の化合物は、低施用量で効力が高いことにより公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例においてアウトラインされている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppmまたは0.8 ppmといった低施用量を用いて当業者により検証可能である。

【0110】

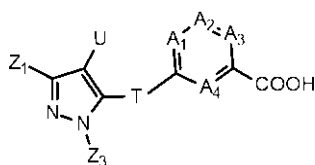
本発明はまた、実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物の調製に有用な中間体を提供する。一定の中間体は新規であり、従って本発明のさらなる態様を構成する。

40

【0111】

新規中間体の一群は、式(I I)

【化 1 6】



(II)

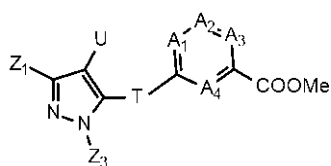
の化合物であり、式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 T 、 U 、 Z^1 および Z^3 は、実施形態 1～25 のいずれか 1 つにおいて定義されているとおりである。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 Z^1 および Z^3 について好ましいものは、実施形態 1～25 のいずれか 1 つに係る化合物の対応する置換基について規定されている好ましいものと同じである。

10

【0 1 1 2】

新規中間体の他の群は、式 (I I I)

【化 1 7】



(III)

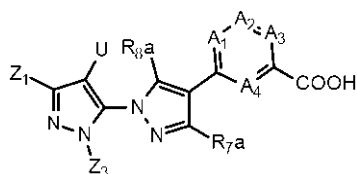
の化合物であり、式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 Z^1 および Z^3 は、実施形態 1～25 のいずれか 1 つにおいて定義されているとおりである。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 Z^1 および Z^3 について好ましいものは、実施形態 1～25 のいずれか 1 つに係る化合物の対応する置換基について規定されている好ましいものと同じである。

20

【0 1 1 3】

新規中間体の一群は、式 (I V)

【化 1 8】



(IV)

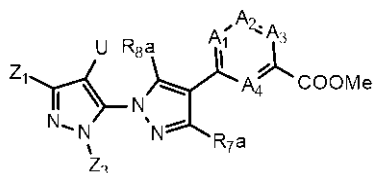
の化合物であり、式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 Z^1 および Z^3 は、実施形態 1～25 のいずれか 1 つにおいて定義されているとおりである。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 Z^1 および Z^3 について好ましいものは、実施形態 1～25 のいずれか 1 つに係る化合物の対応する置換基について規定されている好ましいものと同じである。

40

【0 1 1 4】

新規な中間体の他の群は、式 (V)

【化 19】



(V)

の化合物であり、式中、 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 Z^1 および Z^3 は、実施形態 1～25 のいずれか 1 つに定義されているとおりである。 A^1 、 A^2 、 A^3 、 A^4 、 U 、 R^{7a} 、 R^{8a} 、 Z^1 および Z^3 について好ましいものは、実施形態 1～25 のいずれか 1 つに記載の化合物の対応する置換基について好ましいと記載されたものと同じである。

【0115】

実施形態 1～25 のいずれか 1 つに記載の化合物は、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发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。

【0116】

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 (*Revipalpus* spp.)、ブリオビア属 (*Bryobia* spp)、カリピトリメルス属 (*Calipitrimerus* spp.)、ショクヒゼンダニ属 (*Chorionptes* 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*)、パノニクス属 (*Panonychus* spp.)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptura 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.)；

シラミ目 (*Anoplura*) から、例えば、ブタジラミ属 (*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属 (*Linognathus* spp.)、ペディクルス

属 (*Pediculus* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus* spp.) およびフィロキセラ属 (*Phylloxera* spp.) ;

鞘翅目 (*Coleoptera*) から、例えば、アグリオテス属 (*Agriotes* spp.)、アンフィマロン・マジャレ (*Amphimallon majale*)、セマダラコガネ (*Anomala orientalis*)、アントノムス属 (*Anthonomus* spp.)、マグソコガネ属 (*Aphodius* spp.)、アスチラス・アトロマクラタス (*Astylus atromaculatus*)、アテナウス属 (*Ataenius* spp.)、アトマリア・リネアリス (*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス (*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属 (*Cerotoma* spp.)、コノデルス属 (*Conoderus* spp.) 10、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 (*Hypot henemus hampei*)、ラグリア・フィロサ (*Lagria villosa*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソル 20、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*)、メガセルス属 (*Megascelis* spp.)、メリゲテス・アエネウス (*Melighetes aeneus*)、メロロ 30、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*)、リゾペルタ属 (*Rhizopertha* spp.)、コガネムシ科 (*Scarab 30 eidae*)、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 40、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 50、チチス属 (*Ceratitis* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、クテレブラ属 (*Cuterebra* spp.)、ダクス属 (*Dacus* spp.)、デリア属 (*Delia* spp.)、キイロショウジョウバエ (*Drosophila melanogaster*)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ガストロフィラス属 (*Gastrophilus* spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza tripunctata*)、ツェツェバエ属 (*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 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.) ;

半翅目 (Hemiptera) から、例えば、アカントコリス・スカブラトル (*Acanthocoris scabrador*)、アクロステルナム属 (*Acrosternum* spp.)、ウススジカシカメムシ (*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*)、レプトコリスア属 (*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.)、タバコカシカメムシ (*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*) ;

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.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロックス (*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・アトキンソン (*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.)、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.)、セロプラスタ属 (Ceroplaster sp
 p.)、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
 rina citri)、ジウラフィス・ノキシア (Diuraphis noxia) 10
 、ジサフィス属 (Dysaphis spp)、エンポアスカ属 (Empoasca s
 pp.)、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 s
 pp.)、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
 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 (20
 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・プルイノサ (Metcalfa pruinosa)、ムギ
 ウスイロアブラムシ (Metopolophium dirhodum)、ミンズス・ク
 ルズス (Myndus crudus)、ミズス属 (Myzus spp.)、ネオトキ
 ソプテラ属 (Neotoxoptera 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
 ドリオオアブラムシ (Nippolachnus piri Mats)、オドナスピス
 ・ルタエ (Odonaspis ruthae)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (Or 30
 egma lanigera Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (Parabem
 isia myricae)、パラトリオザ・コッケレリ (Paratrioza co
 ckerelli)、バルラトリア属 (Parlatoria spp.)、ペムフィグ
 ス属 (Pemphigus spp.)、トウモロコシウンカ (Peregrinus
 maidis)、ベルキンシエラ属 (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.)、シュードウラ
 カスピス属 (Pseudaulacaspis spp.)、シュードコッカス属 (Ps
 eudococcus spp.)、ワタノミハムシ (Pseudatomosceli
 s seriatus)、プシラ属 (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.)、シトビオン属 (Sitobion spp.)、セジロウ
 ンカ (Sogatella furcifera)、スピシスチルス・フェスチヌス (S
 pissistilus festinus)、タロファガス・プロセルピナ (Taro
 phagus Proserpina)、トキソプテラ属 (Toxoptera spp
)、トリアレウロデス属 (Trialeurodes spp)、トリジスカス・スポロ 40
 50

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 (*Zyginiidia 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.)、スレノプシス・インビクタ (*Slenopsis invicta*)、ソレノプシス属 (*Solenopsis* spp.) およびベスパ属 (*Vespa* spp.) ;

等翅目 (*Isoptera*) から、例えば、コプトテルメス属 (*Coptotermes* spp.)、コルニテルネス・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、インシシテルメス属 (*Incisitermes* spp.)、マクロテルメス属 (*Macrotermes* spp.)、マストテルメス属 (*Mastotermes* spp.)、ミクロテルメス属 (*Microtermes* spp.)、ヤマトシロアリ属 (*Reticulitermes* spp.) ; ソレノプシス・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・ペルスベクタリス (*Cydalima perspectalis*)、シジア属 (*Cydia* spp.)、ジアファニア・ペルスベクタリス (*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属 (*Diatraea* spp.)、ジバロプシス・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 (*Epinotia* spp.)、エスチグメネ・アクレア (*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ (*Etiella zinckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma* spp.)、ブドウホ

10

20

30

40

50

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 (*Helulla 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・リコベルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ (*Asmopalpus 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・ビフィダリス (*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属 (*Lymantria* spp.)、リオネチア属 (*Lyonetia* spp.)、マラコソマ属 (*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属 (*Mythimna* spp.)、ノクツア属 (*Noctua* spp.)、オペロフテラ属 (*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene* spp.)、パンデミス属 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ (*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*)、プレイス属 (*Prays* spp.)、シュードブルシア属 (*Pseudoplusia* spp.)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*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 (*Damalinea* spp.) およびケモノハジラミ属 (*Trichodectes* spp.) ;

直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、ゴキブリ属 (*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属 (*Blattella* spp.)、ケラ属 (*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、リボセリス属 (*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.) およびケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) ;

総翅目 (*Thysanoptera*) から、例えば、カリオトリプス・ファセオリ (*C*

alliothrips 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 (*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*)。

【0117】

10

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。

【0118】

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、ラテックス植物および観賞植物である。

20

【0119】

30

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)、コドリガ (*Cydia pomonella*) (好ましくは、リンゴ中)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは、野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくは、ジャガイモ中) およびニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくは、イネ中) を防除するのに特に好適である。

40

【0120】

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*) および他のグロボデラ属 (*Globodera*) 種；ムギシストセンチュウ (*Heterodera av*

50

enae)、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 (*Hirschmanniella*) 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 curvatus*)、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; ならびにスバングイナ属 (*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。

【0121】

実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物は、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、スクミリングガイ科（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（Deroceras）（D. アグレスチス（D. agrestis）、D. エムピリコルム（D. empiricorum）、D. ラエヴェ（D. laeve）、D. レチクラツム（D. reticulatum））；ディスクス属（Discus）（D. ロツンダツス（D. rotundatus））；ユーオムファリア属（Euomphalia）；ガルバ属（Galba）（G. トルンクラタ（G. trunculata））；ヘリセリア属（Helicelia）（H. イタラ（H. itala）、H. オブヴィア（H. obvia））；マイマイ科（Helicidae）ヘリシゴナ・アルブストルム（Helicigona arbustorum））；ヘリコディスクス属（Helicodiscus）；ヘリクス属（Helix）（H. アペルタ（H. aperta））；リマックス属（Limax）（L. シネレオニゲル（L. cinereoniger）、キイロナメクジ（L. flavus）、チャコウラナメクジ（L. marginatus）、マダラコウラナメクジ（L. maximus）、L. テネルス（L. tenellus））；モノアライガイ属（Lymnaea）；ミラックス属（Milax）（ニワコウラナメクジ（M. gagates）、M. マルギナツス（M. marginatus）、M. ソウェルビイ（M. sowerbyi））；オペアス属（Opeas）；リングガイ属（Pomacea）（スクミリングガイ（P. canaticulata））；ミジンマイマイ属（Vallonia）およびザニトイデス属（Zanitoides）が挙げられる。

【0122】

「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。

【0123】

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 δ -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. またはキセノラブダス属（Xenorhabdus spp.）の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素および他の昆虫に特有の神経毒素などの、動物によって産生される毒素；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、パバ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-RIP、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（RIP）；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-UDP-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、HMG-CoA-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、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。

【0124】

本発明に関して、 δ -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）。

【0125】

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。

【0126】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。CryI型のデオキシリボ核酸およびそれらの調製が、例えば、国際公開第95/34656号、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。

【0127】

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。

【0128】

殺虫剤耐性（insecticidal resistance）をコードし、1つまたは複数の毒素を発現する1つまたは複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、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-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）；NuCOTN 33B（登録商標）（Cry1Ac毒素を発現するワタ品種）；Bollgard

10

20

30

40

50

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。

【0129】

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。

【0130】

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。

【0131】

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、カテプシンー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。

【0132】

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。

【0133】

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。

【0134】

6. Pioneer Overseas Corporation（Avenue Tescos, 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コシ。

【0135】

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 となる。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す、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

【0136】

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。

【0137】

「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

【0138】

作物はまた、真菌 (例えば、フザリウム属 (*Fusarium*)、炭疽病菌 (*Anthraxnose*) またはフィトフトラ属 (*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、ジャガイモ葉巻き病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス) 病原体に対する増強された耐性のために修飾され得る。

30

【0139】

作物はまた、ダイズシスト線虫などの線虫に対する増強された耐性を有するものを含む。

【0140】

無生物的なストレスに対して許容性である作物は、例えばNF-YBまたは技術分野において公知である他のタンパク質の発現を介して、干ばつ、高度の塩、高温、低温、霜あるいは光放射に対する増強された許容性を有するものを含む。

40

【0141】

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。

50

【0142】

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。

【0143】

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。

10

【0144】

別の実施形態において、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。

20

【0145】

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。

30

【0146】

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。

【0147】

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。

40

【0148】

【表 3】

表 A. 経済的に重要な外来ウッドボローラーの例。

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

10

20

【 0 1 4 9 】

【表 4 - 1】

表 B. 経済的に重要な自生ウッドボーラーの例。

科	種	寄生される宿主または作物
タ マ ム シ 科 (Buprestidae)	アグリルスアンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>)	カバノキ
	アグリルスポリツス (<i>Agrilus politus</i>)	ヤナギ、カエデ
	アグリルスサイ(<i>Agrilus sayi</i>)	ヤマモモ、オシダ
	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、ナナカマドの実、サンザシ
	クリソボトリスフェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコ バカエデ、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、ローワン、オ ーク、ベカン、セイヨウナシ、モ モ、カキ、セイヨウスモモ、ポプ ラ、マルメロ、アメリカハナズオ ウ、ナナカマドの実、スズカケノ キ、クルミ、ヤナギ
	テキサニアカンペストリス (<i>Texania campestris</i>)	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、 スズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエスプルベルレンツス (<i>Goes pulverulentus</i>)	ブナ、ニレ、ナッタール(Nuttall)、 ヤナギ、ブラックオーク(black oak)、アメリカキレハガシワ (Cherrybark oak)、ミズナラ、ス ズカケノキ
	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 ビーン(Eastern hophornbeam)、 ハナミズキ、カキ、アメリカハナ ズオウ、セイヨウヒイラギ、エノ キ、黒色イナゴ、アメリカサイカ チ、ユリノキ、クリ、オーセージ オレンジ、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、サクランボ、セイヨ ウスモモ、モモ、リンゴ、ニレ、

10

20

30

40

【表 4 - 2】

	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、ネタリーフハックベリー (Netleaf hackberry)	
オベレアオセラータ (<i>Oberea ocellata</i>)	ヌルデ、リンゴ、モモ、セイヨウスモモ、セイヨウナシ、スグリ、セイヨウヤブイチゴ	10
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 (<i>Viburnum</i>)、ニレ、サワーウッド、ブルーベリー、ツツジ属 (<i>Rhododendron</i>)、アザレア、月桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ	
オンシデレスシングラータ (<i>Oncideres cingulata</i>)	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワーウッド、シナノキ、アメリカサイカチ、ハナミズキ、ユーカリ属、オーク、エノキ、カエデ、果樹	20
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	
コルチルスコロンビアンス (<i>Corthylus columbianus</i>)	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ	30
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	40
フロエオトリブスリミナリス (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	モモ、サクランボ、セイヨウスモモ、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ローワン	
シュードピチオフトルスブルイ ノ ス ス (<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>)	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チックソープラム (Chickasaw plum)、クリ、カエデ、ヒッコリー、クマシデ、アサダ	

キクイムシ科
(Scolytidae)

【表 4 - 3】

スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネシムランス オーク、アメリカグリ (<i>Paranthrene simulans</i>)	
	サンニナウロセリフォルミス カキ (<i>Sannina uroceriformis</i>)	
	シナンテドンエキシチオサ (<i>Synanthedon exitiosa</i>)	モモ、セイヨウスモモ、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 10
	シナンテドンピクチペス (<i>Synanthedon pictipes</i>)	モモ、セイヨウスモモ、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、ローワン、ガマズミ属(<i>Viburnum</i>)、ヤナギ、リンゴ、ビワ、フィソカルプス、ヤマモモ 20
	ビタセアポリスチフォルミス ブドウ (<i>Vitacea polistiformis</i>)	

【0150】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (hard tick)、ヒメダニ (soft tick)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエおよび舐性 (licking) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミおよびノミなどの外部寄生生物に対して有効である。 30

【0151】

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

シラミ目 (Anoplurida) のうち：ブタジラミ属 (*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 (*Phtirus* spp.)、ソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.)。

【0152】

ハジラミ目 (Mallophagida) のうち：トリメノボン属 (*Trimenopon* spp.)、タンカクハジラミ属 (*Menopon* spp.)、トリノトン属 (*Trinoton* spp.)、ボビコラ属 (*Bovicola* spp.)、ウェルネッキエラ属 (*Werneckiella* spp.)、レピケントロン属 (*Lepikeptron* spp.)、ダマリナ属 (*Damalina* spp.)、トリコデクテス属 (*Trichodectes* spp.) およびフェリコラ属 (*Felicola* spp.)。 40

【0153】

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 (*E* 50

usimulium spp.)、サシチョウバエ属 (Phlebotomus spp.)、ルツォミヤ属 (Lutzomyia spp.)、キュリコイデス属 (Culicoides spp.)、メクラアブ属 (Chrysops spp.)、ヒボミトラ属 (Hybomitra spp.)、キイロアブ属 (Atylotus spp.)、アブ属 (Tabanus spp.)、ゴマフアブ属 (Haematopota spp.)、フィリポミア属 (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.)、ツェツェバエ属 (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.)。

10

【0154】

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

20

【0155】

異翅目 (Heteroptera) 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.)。

【0156】

ゴキブリ目 (Blattellidae) のうち、例えば、トウヨウゴキブリ (Blattella orientalis)、ワモンゴキブリ (Periplaneta americana)、チャバネゴキブリ (Blattella germanica) およびスぺラ属 (Supella spp.)。

30

【0157】

ダニ亜綱 (Acaria (Acarida)) ならびにマダニ亜目 (Metastigmata) および中気門亜目 (Mesostigmata) のうち、例えば、ナガヒメダニ属 (Argas spp.)、カズキダニ属 (Ornithodoros spp.)、オトビウス属 (Otobius spp.)、タネガタマダニ属 (Ixodes spp.)、キララマダニ属 (Amblyomma spp.)、ウシマダニ属 (Boophilus spp.)、カクマダニ属 (Dermacentor spp.)、チマダニ属 (Haemophysalis spp.)、イボマダニ属 (Hyalomma spp.)、コイタマダニ属 (Rhipicephalus spp.)、デルマニスス属 (Dermanyssus spp.)、ライリエチア属 (Raillietia spp.)、ニューモニスス属 (Pneumonyssus spp.)、ステルノストマ属 (Sternostoma spp.) およびバロア属 (Varroa spp.)。

40

【0158】

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 (Trom

50

bicula 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.)、クネミドコプテス属 (Knemidocoptes spp.)、シトジテス属 (Cytodites spp.) およびラミノシオプテス属 (Laminosioptes spp.)。

10

【0159】

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

【0160】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ (Hylotrupes bajulus)、クロロホルス・ピロシス (Chlorophorus 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 (Ptilinuspecticor 20 nis)、デンドロビウム・ベルチネクス (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・プベセンス (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 30 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.) およびチビタケナガシンクイムシ (Dinoderus minutus) などの甲虫、ならびにさらにコルリキバチ (Sirex juvenculus)、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 (Cryptoterme brevis)、ヘテロテルメス・インディコラ (Heteroterme indicola)、キアシシ 40 ロアリ (Reticuliterme flavipes)、レティクリテルメス・サントネンシス (Reticuliterme santonensis)、レティキュリテルメス・ルシフグス (Reticuliterme lucifugus)、ムカシシロアリ (Mastoterme darwiniensis)、ネバダオオシロアリ (Zootermopsis nevadensis) およびイエシロアリ (Coptoterme formosanus) などのシロアリ、ならびにセイヨウシミ (Leptisma saccharina) などのシミ。

【0161】

一態様において、従って、本発明はまた、乳剤、懸濁濃縮物、マイクロエマルジョン、油分散性の、直接噴霧可能または希釈可能な液剤、延展可能なペースト、希釈乳剤、可溶 50

性粉剤、分散性粉剤、水和剤、ダスト剤（d u s t）、粒剤またはポリマー物質中への封入物などの殺有害生物組成物にも関し、殺有害生物組成物は、実施形態1～25のいずれか1つに記載の活性成分の — 少なくとも — 1つを含み、意図される目的および一般的な状況に合わせて選択されるべきである。これらの組成物において、活性成分は、純粋な形態、例えば特定の粒度の固体活性成分として、または好ましくは、増量剤、例えば、溶媒または固体担体など、または表面活性化合物（界面活性剤）などの、製剤化の技術分野で通常使用される補助剤の — 少なくとも — 1つと一緒に用いられる。

【0162】

好適な溶媒の例は、非水素化または部分的に水素化された芳香族炭化水素、好ましくは、キシレン混合物、アルキル化ナフタレンまたはテトラヒドロナフタレンなどのアルキルベンゼンのC₈～C₁₂留分、パラフィンまたはシクロヘキサンなどの脂肪族または脂環式炭化水素、エタノール、プロパノールまたはブタノール、グリコールなどのアルコールならびにプロピレングリコール、ジプロピレングリコールエーテル、エチレングリコールまたはエチレングリコールモノメチルエーテルまたはエチレングリコールモノエチルエーテルなどの、それらのエーテルおよびエステル、シクロヘキサノン、イソホロンまたはジアセトンアルコールなどのケトン、N-メチルピロリド-2-オン、ジメチルスルホキシドまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの強い極性の溶媒、水、非エポキシ化またはエポキシ化ナタネ油、ヒマシ油、ヤシ油またはダイズ油、およびシリコン油などのエポキシ化またはエポキシ化植物油である。

【0163】

例えば、ダスト剤および分散性粉剤に使用される固体担体は、一般に、方解石、タルク、カオリン、モンモリロナイトまたはアタパルジャイトなどの粉碎された天然鉱物である。物理的特性を向上させるために、高度に分散したシリカまたは高度に分散した吸収性ポリマーを加えることも可能である。粒剤のための好適な粒子状吸着性担体は、軽石、レンガ砂（b r i c k g r i t）、海泡石またはベントナイトなどの多孔質型であり、好適な非吸収性担体材料は、方解石または砂である。さらに、多くの無機性または有機性の粒状材料、特にドロマイトまたは粉碎した植物残渣が使用され得る。

【0164】

好適な表面活性化合物は、製剤化される活性成分のタイプに応じて、良好な乳化、分散および湿潤特性を有する非イオン性、カチオン性および／またはアニオン界面活性剤あるいは界面活性剤混合物である。後述される界面活性剤は、例としてみなされるに過ぎず；製剤化の技術分野において通常使用され、および本発明に従って好適な多くのさらなる界面活性剤が、関連文献に記載されている。

【0165】

好適な非イオン性界面活性剤は、特に脂肪族または脂環式アルコールのポリグリコールエーテル誘導体、飽和または不飽和脂肪酸のポリグリコールエーテル誘導体、またはアルキルフェノールのポリグリコールエーテル誘導体であり、これは、約3～約30個のグリコールエーテル基および約8～約20個の炭素原子を（環状）脂肪族炭化水素基に含有し得、または約6～約18個の炭素原子をアルキルフェノールのアルキル部分に含有し得る。アルキル鎖中の1～約10個の炭素原子および約20～約250個のエチレングリコールエーテル基および約10～約100個のプロピレングリコールエーテル基を有する、ポリプロピレングリコール、エチレンジアミノポリプロピレングリコールまたはアルキルポリプロピレングリコールとの水溶性ポリエチレンオキシド付加物も好適である。通常、上記の化合物は、1つのプロピレングリコール単位につき1～約5つのエチレングリコール単位を含む。挙げられる例は、ノニルフェノキシポリエトキシエタノール、ヒマシ油ポリグリコールエーテル、ポリプロピレングリコール／ポリエチレンオキシド付加物、トリブチルフェノキシポリエトキシエタノール、ポリエチレングリコールまたはオクチルフェノキシポリエトキシエタノールである。ポリオキシエチレンソルビタントリオレートなどのポリオキシエチレンソルビタンの脂肪酸エステルも好適である。

【0166】

カチオン性界面活性剤は、特に置換基として約 8 ～ 約 22 個の C 原子を有する少なくとも 1 つのアルキル基およびさらなる置換基として（非ハロゲン化またはハロゲン化）低級アルキルまたはヒドロキシアルキルまたはベンジル基を一般に有する第四級アンモニウム塩である。塩は、好ましくは、ハロゲン化物、メチル硫酸塩またはエチル硫酸塩の形態である。例は、塩化ステアリルトリメチルアンモニウムおよび臭化ベンジルビス（2-クロロエチル）エチルアンモニウムである。

【0167】

好適なアニオン界面活性剤の例は、水溶性の石けんまたは水溶性の合成表面活性化合物である。好適な石けんの例は、オレイン酸またはステアリン酸の、または例えば、ヤシ油またはトール油から得られる天然脂肪酸混合物のナトリウム塩またはカリウム塩などの、約 10 ～ 約 22 個の C 原子を有する脂肪酸のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩または（非置換または置換）アンモニウム塩であり；脂肪酸メチルタウレートも挙げられるべきである。しかしながら、合成界面活性剤、特に脂肪酸スルホネート、脂肪酸サルフェート、スルホン酸化ベンズイミダゾール誘導体またはアルキルアリールスルホネートがより高い頻度で使用される。一般に、脂肪酸スルホネートおよび脂肪酸サルフェートは、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩または（置換または非置換）アンモニウム塩として存在し、一般に、約 8 ～ 約 22 個の C 原子のアルキル基を有し、アルキルはまた、アシル基のアルキル部分を含むものと理解されるべきであり；その挙げられる例は、リグノスルホン酸の、ドデシル硫酸エステルまたは天然の脂肪酸から調製される脂肪酸アルコールサルフェート混合物のナトリウム塩またはカルシウム塩である。この基は、脂肪酸アルコール／エチレンオキシド付加物の硫酸エステルおよびスルホン酸の塩も含む。スルホン酸化ベンズイミダゾール誘導体は、好ましくは、2 つのスルホニル基および約 8 ～ 約 22 個の C 原子の脂肪酸基を含む。アルキルアリールスルホネートの例は、デシルベンゼンスルホン酸の、ジブチルナフタレンスルホン酸のまたはナフタレンスルホン酸／ホルムアルデヒド縮合物のナトリウム塩、カルシウム塩またはトリエタノールアンモニウム塩である。さらに、p-ノニルフェノール／（4-14）エチレンオキシド付加物のリン酸エステル、またはリン脂質の塩などの好適なホスフェートも可能である。

【0168】

一般に、組成物は、0.1 ～ 99 %、特に 0.1 ～ 95 % の活性成分および 1 ～ 99.9 %、特に 5 ～ 99.9 % の少なくとも 1 つの固体または液体補助剤を含み、組成物のうちの、一般に、0 ～ 25 %、特に 0.1 ～ 20 % が、界面活性剤であることが可能である（% はそれぞれ重量パーセントを意味する）。濃縮された組成物が、商品として好まれる傾向があるが、最終消費者は、一般に、かなり低い濃度の活性成分を有する希釈組成物を使用する。

【0169】

典型的に、葉面施用のためのプレミックス製剤は、0.1 ～ 99.9 %、特に 1 ～ 95 % の所望の成分、および 99.9 ～ 0.1 %、特に 99 ～ 5 % の固体または液体補助剤（例えば、水などの溶媒を含む）を含み、助剤は、プレミックス製剤を基準にして、0 ～ 50 %、特に 0.5 ～ 40 % の量の界面活性剤であり得る。

【0170】

通常、種子処理施用のためのタンクミックス製剤は、0.25 ～ 80 %、特に 1 ～ 75 % の所望の成分、および 99.75 ～ 20 %、特に 99 ～ 25 % の固体または液体助剤（例えば、水などの溶媒を含む）を含み、助剤は、タンクミックス製剤を基準にして、0 ～ 40 %、特に 0.5 ～ 30 % の量の界面活性剤であり得る。

【0171】

典型的に、種子処理施用のためのプレミックス製剤は、0.5 ～ 99.9 %、特に 1 ～ 95 % の所望の成分、および 99.5 ～ 0.1 %、特に 99 ～ 5 % の固体または液体補助剤（例えば、水などの溶媒を含む）を含み、助剤は、プレミックス製剤を基準にして、0 ～ 50 %、特に 0.5 ～ 40 % の量の界面活性剤であり得る。

【0172】

市販の製品は、好ましくは、濃縮物（例えば、プレミックス組成物（製剤））として製剤化されるであろうが、最終使用者は、通常、希釈製剤（例えば、タンクミックス組成物）を用いるであろう。

【0173】

好ましい種子処理プレミックス製剤は、水性懸濁濃縮物である。この製剤は、流動床技術、ローラーミル法、ロトスタティック種子処理機（rotostatic seed t re a t e r）、およびドラムコータ（d r u m c o a t e r s）などの、従来の処理技術および機械を用いて種子に施用され得る。噴流床などの他の方法も有用であり得る。種子は、塗布の前に予め分級され得る。塗布の後、種子は、典型的に、乾燥され、次に分級のために分級機に移される。このような手順は、当該技術分野において公知である。

10

【0174】

一般に、本発明のプレミックス組成物は、0.5～99.9、特に1～95、有利には、1～50質量%の所望の成分、および99.5～0.1、特に99～5質量%の固体または液体補助剤（例えば、水などの溶媒を含む）を含有し、助剤（または補助剤）は、プレミックス製剤の質量を基準にして、0～50、特に0.5～40質量%の量の界面活性剤であり得る。

【0175】

プレミックス組成物用の茎葉製剤タイプの例は、以下のとおりである：

GR：粒剤

WP：水和剤

WG：水和性顆粒（粉剤）

SG：水溶性粒剤

SL：可溶濃縮剤

EC：乳化性濃縮物

EW：水中油乳剤

ME：マイクロエマルジョン

SC：水性懸濁濃縮物

CS：水性カプセル懸濁剤

OD：油系懸濁濃縮物、および

SE：水性サスポエマルジョン（s u s p o - e m u l s i o n）。

20

30

【0176】

一方、プレミックス組成物用の種子処理製剤タイプの例は、以下のとおりである：

WS：種子処理スラリー用の水和剤

LS：種子処理用の液剤

ES：種子処理用の乳剤

FS：種子処理用の懸濁濃縮物

WG：水和性顆粒、および

CS：水性カプセル懸濁剤。

【0177】

タンクミックス（t a n k - m i x）組成物に好適な製剤タイプの例は、液剤、希釈乳剤、懸濁剤、またはそれらの混合物、およびダスト剤である。

40

【0178】

好ましい組成物は、特に以下のように構成される（％＝重量パーセント）。

乳剤：

活性成分：1～95％、好ましくは、5～20％

界面活性剤：1～30％、好ましくは、10～20％

溶媒：5～98％、好ましくは、70～85％

【0179】

ダスト剤：

活性成分：0.1～10％、好ましくは、0.1～1％

50

固体担体：99.9～90%、好ましくは、99.9～99%

【0180】

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%

界面活性剤：1～40%、好ましくは、2～30%

【0181】

水和剤：

活性成分：0.5～90%、好ましくは、1～80%

界面活性剤：0.5～20%、好ましくは、1～15%

固体担体：5～99%、好ましくは、15～98%

【0182】

粒剤：

活性成分：0.5～30%、好ましくは、3～15%

固体担体：99.5～70%、好ましくは、97～85%

【実施例】

【0183】

実施形態1に係る以下の化合物は、本明細書に記載の方法または公知の方法に従って調製され得る。

【0184】

実験

以下の実施例は本発明の例示を意図しており、限定的であると解釈されるべきではない。

【0185】

「Mp」は融点(°C)を意味する。¹H NMR測定をBrucker 400MHz分光計で記録し、化学シフトを、TMS標準を基準としてppmで示す。示されるようにスペクトルを重溶媒中で測定した。

【0186】

LC MS法A：標準：

エレクトロスプレーソース（極性：陽イオンまたは陰イオン、キャピラリ：3.00kV、コーン範囲：30～60V、抽出器：2.00V、ソース温度：150°C、脱溶剤温度：350°C、コーンガス流：0L/Hr、脱溶剤ガス流：650L/Hr、質量範囲：100～900Da）およびWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出器を備えたWaters製の質量分光計（SQDまたはZQシングル四重極型質量分析計）でスペクトルを記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、1.8μm、30×2.1mm、温度：60°C、DAD波長範囲（nm）：210～500、溶剤勾配：A＝水＋5% MeOH＋0.05% HCOOH、B＝アセトニトリル＋0.05% HCOOH：勾配：勾配：0分間0%のB、100%のA；1.2～1.5分間100%のB；流量（ml/min）0.85。

【0187】

LC MS法B：標準長：

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：3.00kV、コーン範囲：30～60V、抽出装置：2.00V、イオン源温度：150°C、脱溶媒和温度：350°C、コーンガス流：0L/時、脱溶媒和ガス流：650L/時、質量範囲：100～900Da）を備えたWaters製の質量分析計（SQD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

10

20

30

40

50

ダイオードアレイ検出装置。カラム：Waters UPLC HSS T3、 $1.8\mu\text{m}$ 、 $30\times 2.1\text{mm}$ 、温度： 60°C 、DAD波長範囲（nm）： $210\sim 500$ 、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：勾配：0分間0％のB、100％のA；1.2～1.5分間100％のB；流量（ml/min）0.85。

【0188】

LC MS法C：非偏極：

エレクトロスプレーソース（極性：陽イオンまたは陰イオン、キャピラリ： 3.00kV 、コーン範囲： $30\sim 60\text{V}$ 、抽出器： 2.00V 、ソース温度： 150°C 、脱溶剤温度： 350°C 、コーンガス流： $0\text{L}/\text{Hr}$ 、脱溶剤ガス流： $650\text{L}/\text{Hr}$ 、質量範囲： $100\sim 900\text{Da}$ ）およびWaters製のAcquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出器を備えたWaters製の質量分光計（SQDまたはZQシングル四重極型質量分析計）でスペクトルを記録した。溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出器。カラム：Waters UPLC HSS T3、 $1.8\mu\text{m}$ 、 $30\times 2.1\text{mm}$ 、温度： 60°C 、DAD波長範囲（nm）： $210\sim 500$ 、溶剤勾配：A＝水＋5％ MeOH＋0.05％ HCOOH、B＝アセトニトリル＋0.05％ HCOOH；勾配：勾配：0分間40％のB、60％のA；1.2～1.5分間100％のB；流量（ml/min）0.85。

10

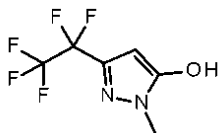
20

【0189】

実施例1：2-クロロ-N-（1-シアノシクロプロピル）-5-〔1-〔4-（ジフルオロメトキシ）-2-メチル-5-（1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル）ピラゾール-3-イル〕ピラゾール-4-イル〕ベンズアミド。

a) 2-メチル-5-（1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル）ピラゾール-3-オール

【化20】



30

エチル4,4,5,5,5-ペンタフルオロ-3-オキソ-ペンタノエート（30g、 128mmol ）およびメチルヒドラジン（6.2g、 135mmol ）の 120ml のエタノール中の溶液を室温で一晩にわたりアルゴン雰囲気下で攪拌し、次いで反応混合物を 60°C に24時間かけて加熱して完全な転換を行った。溶剤を減圧下で蒸発させ、残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、2-メチル-5-（1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル）ピラゾール-3-オールをベージュ色の固体として得た。

^1H NMR（ 400MHz ， $\text{DMSO}-d_6$ ） δ ppm 3.60（s，3H）5.71（s，1H）11.70（s，1H）。

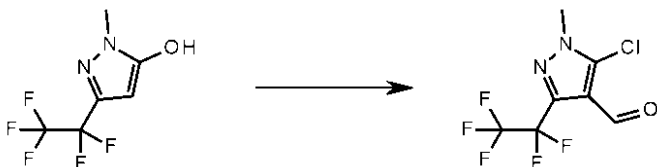
LC-MS（方法B）： $t_R=1.03\text{min}$ ， $m/z=215$ [M-1]， 217 [M+1]。

40

【0190】

b) 5-クロロ-1-メチル-3-（1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル）ピラゾール-4-カルバルデヒドの調製

【化21】



アルゴン雰囲気下および 0°C で POCl_3 （ 16.3ml 、 175mmol ）を2.5

50

ml の N, N-ジメチルホルムアミドに慎重に滴下した。この反応混合物に 2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-オール (5 g、23.1 mmol) を添加し、次いで混合物を 100 °C で 18 時間加熱した。次いで、反応混合物を室温に冷却し、炭酸水素ナトリウムの水溶液にゆっくりと注ぎ入れ、この溶液を酢酸エチルで 3 回抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させた。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-クロロ-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒドを黄色の油として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 4.00 (s, 3H) 10.00 (s, 1H)

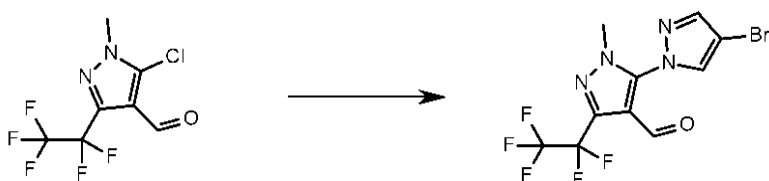
10

LC-MS (方法 B) : $t_R = 1.37 \text{ min}$, $m/z = 263$ [M+1].

【0191】

c) 5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒドの調製

【化22】



20

アルゴン雰囲気下で 5-クロロ-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒド (12.85 g、48.9 mmol) をアセトニトリル (500 ml) 中に溶解し、次いで炭酸セシウム (31.89 g、97.8 mmol) を添加した。この混合物に 4-ブロモ-1H-ピラゾール (7.9 g、53.8 mmol) を添加し、混合物を室温で 18 時間撹拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、水および塩水で洗浄し、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させた。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒドを白色の固体として得た。

30

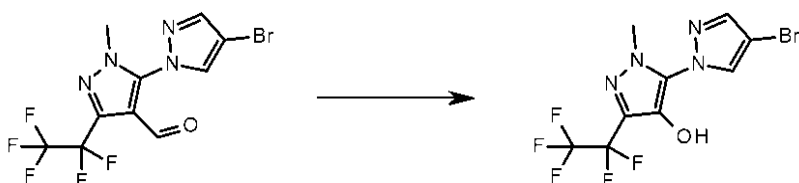
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 3.98 (s, 3H) 7.83 (s, 1H) 8.09 (s, 1H) 9.97 (s, 1H).

LC-MS (方法 B) : $t_R = 1.63 \text{ min}$, $m/z = 371$ [M-1], 373 [M+1].

【0192】

d) 5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-オール調製の調製

【化23】



40

5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒド (500 mg、1.34 mmol) のジクロロメタン (5 ml) 中の溶液にメタクロロ過安息香酸 (642 mg、2.68 mmol) を添加した。混合物を室温で 5 日間撹拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、水、ならびに炭酸水素ナトリウムおよびチオ硫酸ナトリウムの水溶液で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で減量させた。残渣をフラッシュクロマトグラ

50

フィにより精製して、5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-オールを白色の固体として得た。

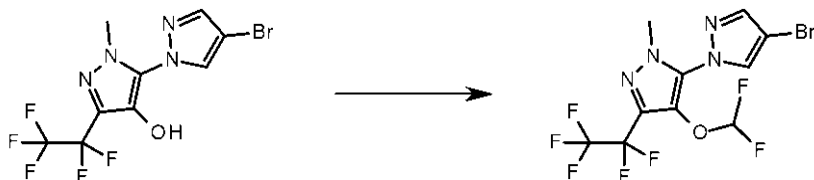
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 3.79 (s, 3H) 6.35 (s, 1H) 7.66 (s, 1H) 7.75 (s, 1H)

LC-MS (方法B): $t_R = 1.39$ min, $m/z = 361$ [M-1], 363 [M+1].

【0193】

e) 5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾールの調製

【化24】



4 ml のアセトニトリル/水 (1:1) の混合物中の 5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-オール (466 mg、1.29 mmol) および水酸化カリウム (1.44 g、25.81 mmol) の溶液に -78℃ で 1-[[[プロモ(ジフルオロ)メチル]-エトキシー]ホスホリル]オキシエタン (689 mg、2.58 mmol) を添加した。混合物を室温に温め、密閉容器中で 3 時間攪拌した。反応を完了させるために、1-[[[プロモ(ジフルオロ)メチル]-エトキシー]ホスホリル]オキシエタン (172 mg、0.645 mmol) を -78℃ で添加し、反応を室温でさらに 1 時間攪拌した。反応混合物をエーテルで希釈し、塩水および水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、減圧下で減量させた。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾールを無色の油として得た。

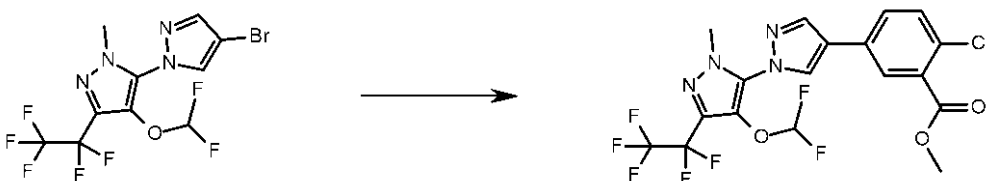
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 3.87 (s, 3H) 6.08-6.52 (m, 1H) 7.78 (s, 1H) 7.81 (s, 1H).

LC-MS (方法B): $t_R = 1.79$ min, $m/z = 409$ [M-1], 411 [M+1].

【0194】

f) 2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸メチルの調製

【化25】



マイクロ波チューブ中において、5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール (50 mg、0.121 mmol)、5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール (56 mg、0.182 mmol) およびフッ化セシウム (37 mg、0.243 mmol) を 4 ml のジオキサン/水 (3/1) 中に溶解した。混合物

をアルゴンで5分間パージした。Pd (dppf) Cl₂ (4.8 mg、0.006 mmol) を添加し、混合物に対してマイクロ波オーブン中において160℃で30分間照射を行った。混合物を蒸発させ、酢酸エチルで希釈し、25 mlの水で失活させ、酢酸エチルで3回抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。黒色～茶色の樹脂をシリカゲルで精製して、2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸メチルを無色の油として得た。

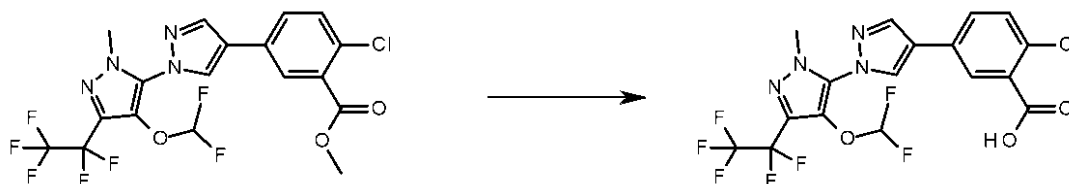
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.93 (s, 3H) 3.98 (s, 3H) 6.11–6.51 (m, 1H) 7.49–7.54 (m, 1H) 7.49–7.54 (m, 1H) 7.55–7.60 (m, 1H) 7.97–8.04 (m, 2H) 8.13 (s, 1H)

LC-MS (方法B) : t_R = 1.98 min, m/z = 499 [M-1], 501 [M+1].

【0195】

g) 2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸の調製

【化26】



2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸メチル (192 mg、0.38 mmol) を5 mlのテトラヒドロフラン/水 (4:1) 中に溶解した。LiOH-水和物 (46 mg、1.9 mmol) を一度に添加し、反応混合物を50℃で3時間温めた。混合物を蒸発させ、酢酸エチルおよび25 mlの水で希釈した。水性相をpH4に酸性化し、3×30 ml酢酸エチルで抽出し、有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸を無色の油として得た。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.94 (s, 3H) 6.13–6.51 (m, 1H) 7.54–7.58 (m, 1H) 7.61–7.66 (m, 1H) 8.04 (s, 1H) 8.13–8.18 (m, 2H).

LC-MS (方法B) : t_R = 1.73 min, m/z = 485 [M-1], 487 [M+1].

【0196】

h) 2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドの調製

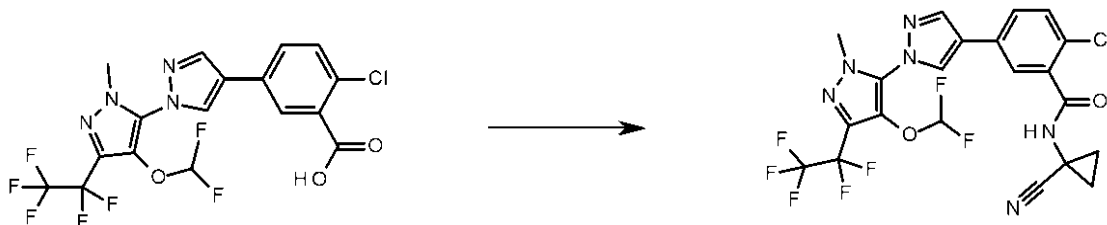
10

20

30

40

【化 27】



3 ml の DMF 中の 2-クロロ-5-[[1-[[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸 (45 mg、0.092 mmol)、1-アミノ-1-シアノシクロプロパンヒドロクロリド (33.5 mg、0.277 mmol)、EDCI (22.61 mg、0.115 mmol)、HOAT (16.39 mg、0.115 mmol) およびトリエチルアミン (42.1 mg、0.416 mmol) の混合物を室温で 2 時間撹拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、水で失活させ、有機相を順次に水、および塩水で一回洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗生成物をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[[1-[[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドを白色の固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1.41–1.46 (m, 2H) 1.67–1.72 (m, 2H) 3.93 (s, 3H) 6.12–6.51 (m, 1H) 7.46 (d, $J=8.07$ Hz, 1H) 7.57 (dd, $J=8.25, 2.38$ Hz, 1H) 7.96 (d, $J=2.20$ Hz, 1H) 8.03 (s, 1H) 8.12 (s, 1H).

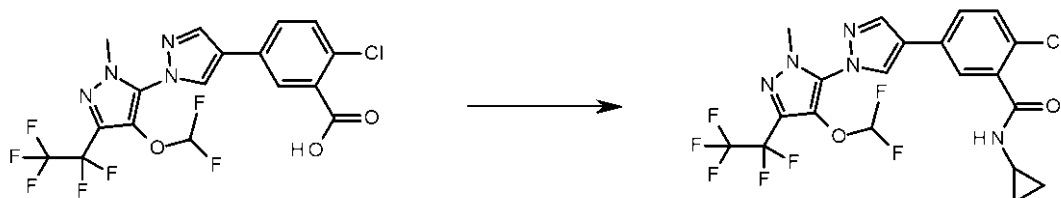
LC-MS (方法 B): $t_R=1.74$ min, $m/z=549$ [M-1], 551 [M+1].

Mp: 138 °–139 °C

【0197】

実施例 2: 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[[1-[[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミド

【化 28】



3 ml の DMF 中の 2-クロロ-5-[[1-[[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸 (45 mg、0.092 mmol)、シクロピロピルアミン (15.84 mg、0.28 mmol)、EDCI (22.61 mg、0.115 mmol)、HOAT (16.39 mg、0.115 mmol) およびトリエチルアミン (32.75 mg、0.323 mmol) の混合物を室温で 2 時間撹拌した。混合物を酢酸エチルおよび水で希釈し、有機相を順次に水および塩水で一回洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗生成物をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[[1-[[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドを白色の固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 0.56–0.63 (m, 2H) 0.81–0.87 (m, 2H) 2.88 (tq, $J=7.08$, 3.71 Hz, 1H) 3.85 (s, 3H) 6.02–6.46 (m, 2H) 7.33–7.48 (m, 2H) 7.75–7.96 (m, 2H) 7.98–8.07 (m, 1H).

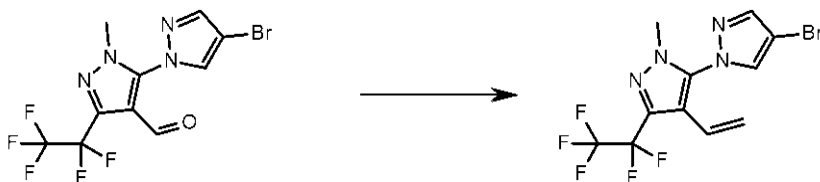
LC-MS (方法B): $t_R=1.77$ min, $m/z=524$ [M-1], 526 [M+1].

【0198】

実施例15: 2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[1-[2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミド

a) 5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾールの調製

【化29】



乾燥THF (100 ml)中の臭化メチル(トリフェニル)ホスホニウム(7.3 g、20 mmol)の攪拌混合物にアルゴン雰囲気下において -78°C でヘキサン(13 ml、20 mmol)中の $n\text{-BuLi}$ (1.6 mol/L)を滴下した。得られた混合物を -78°C で30分間攪拌した。この黄色の混合物に5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒド(5.0 g、13 mmol)のTHF中の溶液を添加した。混合物を室温に温めた。反応混合物を水性塩化アンモニウムで失活させ、次いで酢酸エチルで希釈し、有機相を水および塩水で洗浄し、マグネシウムで乾燥させ、減圧下で蒸発させた。粗生成物をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾールを白色の固体として得た。

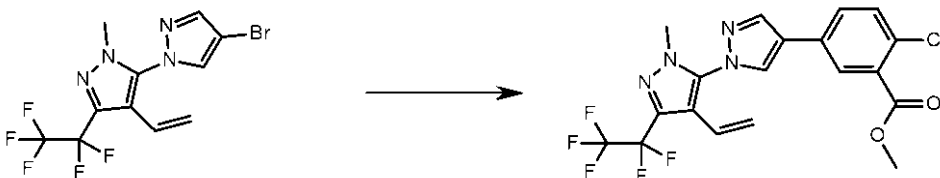
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 3.73–3.76 (m, 3H) 4.91 (d, $J=17.97$ Hz, 1H) 5.20–5.28 (m, 1H) 6.44–6.53 (m, 1H) 7.66 (s, 1H) 7.85 (s, 1H).

LC-MS (方法B): $t_R=1.89$ min, $m/z=369$ [M-1].

【0199】

b) 2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸メチルの調製

【化30】



5-(4-ブロモピラゾール-1-イル)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール(1.2 g、3.2 mmol)、2-クロロ-5-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)安息香酸メチル(1.2 g、3.9 mmol)および炭酸ナトリウム(1.7 g、16 mmol)を10 mlの1, 2-ジメトキシエタンおよび2 mlの水中に溶解した。混

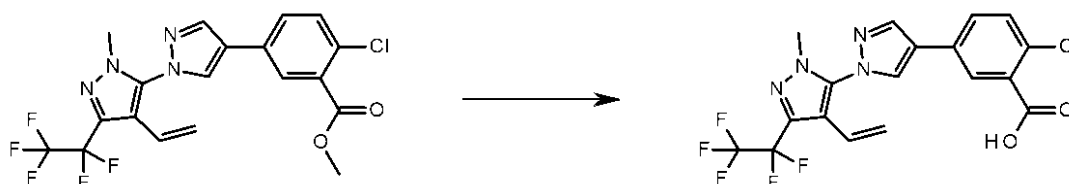
合物をアルゴンで5分間パージした。次いで、Pd(PPh₃)₄(560mg、0.49mmol)を添加し、混合物に対してマイクロ波オーブン中において100℃で40分間照射を行った。反応が完了しておらず、0.05当量のPd(PPh₃)₄を添加し、混合物に対してマイクロ波オーブン中において120℃で20分間照射をさらに行った。混合物をセライトでろ過し、乾燥するまで蒸発させ、粗混合物をシリカゲルで分離して、2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸塩を黄色の油として得た。

¹H NMR(400MHz, CDCl₃) δ ppm 3.81(s, 3H) 3.99(s, 3H) 4.95(d, J=17.97Hz, 1H) 5.20-5.25(m, 1H) 6.52(dd, J=17.97, 11.74Hz, 1H) 7.52-7.55(m, 1H) 7.58-7.62(m, 1H) 7.91(d, J=0.73Hz, 1H) 8.01(d, J=2.20Hz, 1H) 8.17(d, J=0.73Hz, 1H).

LC-MS(方法B): t_R=2.09min, m/z=459[M-1], 461[M+1].

【0200】

c) 2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸の調製【化31】



2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸メチル(450mg、0.976mmol)をTHFおよび水の混合物(5ml、4:1)中に溶解した。LiOH-水和物(233mg、9.76mmol)を一度に添加し、反応混合物を室温で一晩攪拌した。混合物を蒸発させ、酢酸エチルで希釈し、25mlの水で失活させ、pH4に酸性化した。水性相を酢酸エチルで3回抽出し、組み合わせた有機相を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗生成物をシリカゲルで精製して、2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸を白色の固体として得た。

¹H NMR(400MHz, CDCl₃) δ ppm 3.82(s, 3H) 4.96(d, J=17.97Hz, 1H) 5.23(dd, J=11.74, 1.10Hz, 1H) 6.52(dd, J=17.97, 11.74Hz, 1H) 7.56-7.59(m, 1H) 7.64-7.68(m, 1H) 7.93(d, J=0.73Hz, 1H) 8.19(dd, J=3.30, 1.47Hz, 2H).

LC-MS(方法B): t_R=1.8min, m/z=445[M-1], 447[M+1].

【0201】

d) 2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニル-ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドの調製

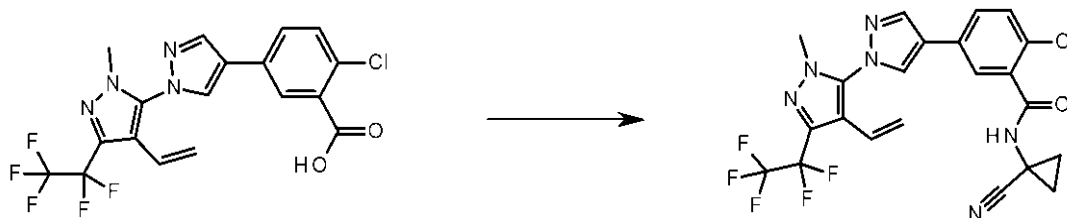
10

20

30

40

【化 3 2】



5 ml の DMF 中の 2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニルピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸 (158 mg、0.353 mmol)、1-アミノ-1-シアノシクロプロパンヒドロクロリド (128 mg、1.06 mmol)、EDCI (86.47 mg、0.44 mmol)、HOAT (62 mg、0.44 mmol) およびトリエチルアミン (161 mg、1.6 mmol) の混合物を室温で 16 時間攪拌した。混合物を酢酸エチルおよび水で希釈した。有機相を順次に水および塩水で一回、かつ塩酸溶液 (1 N) で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させた。粗生成物をクロマトグラフィにより精製して、2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニルピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドを白色の固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 1.41–1.44 (m, 2H) 1.68–1.72 (m, 2H) 3.79 (s, 3H) 4.92 (d, $J=17.97$ Hz, 1H) 5.17–5.23 (m, 1H) 6.49 (dd, $J=17.79, 11.55$ Hz, 1H) 6.90 (s, 1H) 7.45 (d, $J=8.07$ Hz, 1H) 7.57 (dd, $J=8.44, 2.20$ Hz, 1H) 7.90 (s, 1H) 7.96 (d, $J=2.20$ Hz, 1H) 8.14 (d, $J=0.73$ Hz, 1H).

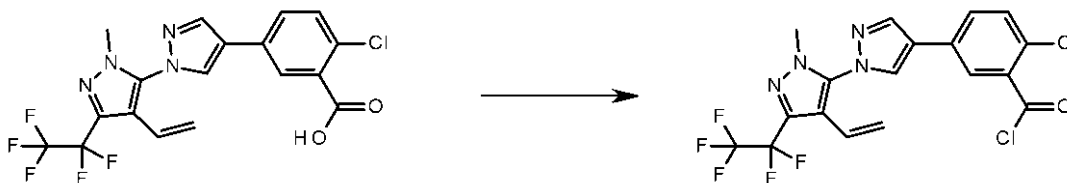
LC-MS (方法 B): $t_R=1.77$ min, $m/z=509$ [M-1], 511 [M+1].

【0202】

実施例 16: 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニルピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドの調製

a) 2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニルピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]塩化ベンゾイルの調製

【化 3 3】

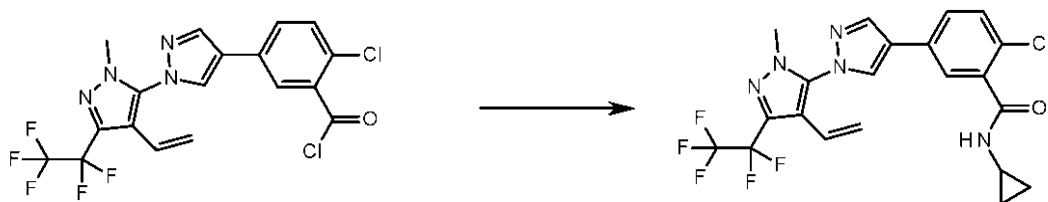


2-クロロ-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニルピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]安息香酸 (実施例 3、ステップ c; 50 mg、0.111 mmol) の 5 ml の乾燥ジクロロメタン中の懸濁液にアルゴン雰囲気中において二塩化オキサリル (2 ml) および 1 滴の DMF を順次に添加した。ガスの発生が停止するまで反応混合物を攪拌した。乾燥するまで減圧下で溶剤を除去し、粗生成物を次のステップに直接用いた。

【0203】

b) 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)-4-ビニルピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ベンズアミドの調製

10

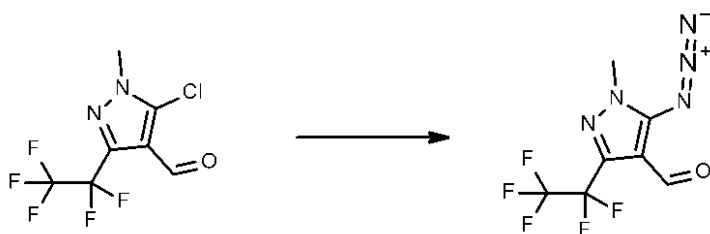


20

30

40

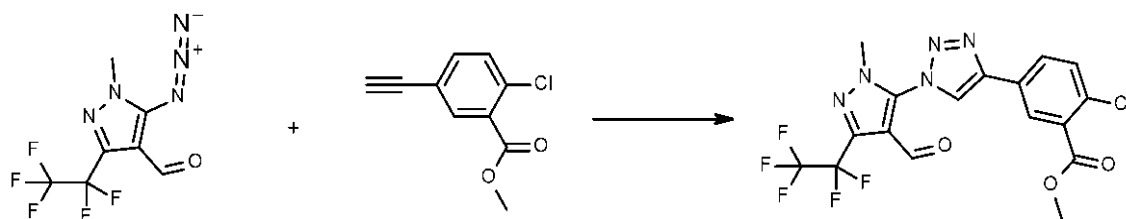
50



b) 2-クロロ-5-[1-[4-ホルミル-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]安息香酸メチ

ルの調製

【化 3 6】



t-ブタノール (4 ml) および水 (2 ml) の混合物中の 5-アジド-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-4-カルバルデヒド (1. 0 g、3. 7 mmol) の溶液に 2-クロロ-5-エチニル-安息香酸メチル (0. 60 g、3. 1 mmol)、L-アスコルビン酸ナトリウム塩 (0. 062 g、0. 31 mmol) および硫酸銅 (II) 五水和物 (0. 0049 g、0. 031 mmol) を添加した。混合物を室温で一晩攪拌した (18 時間)。混合物を酢酸エチルで希釈し、水および塩水で洗浄し、有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗生成物をフラッシュクロマトグラフィ (シリカ、0~25% のシクロヘキサン/酢酸エチル勾配) により精製して、黄色の固体を得た。

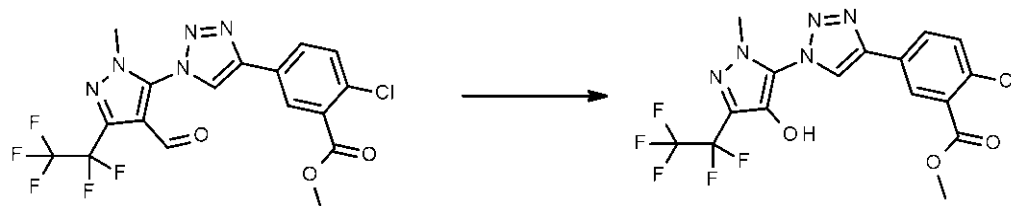
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 3. 99 (s, 3H), 4. 08 (s, 3H), 7. 61 (d, $J=8. 4$ Hz, 1H), 8. 02 (dd, $J=8. 4, 2. 2$ Hz, 1H), 8. 38 (d, $J=2. 2$ Hz, 1H), 8. 50 (s, 1H), 10. 03 (s, 1H).

LC-MS (方法 A): $t_R=1. 12$ min, $m/z=464$ [$M+1$].

【0206】

c) 2-クロロ-5-[1-[4-ヒドロキシ-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]安息香酸メチルの調製

【化 3 7】



2-クロロ-5-[1-[4-ホルミル-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]安息香酸メチル (1. 5 g、3. 2 mmol) のトリフルオロ酢酸 (4. 2 ml) 中の攪拌溶液に尿素過酸化水素 (0. 63 g、6. 5 mmol) を、5 回に分けて 25 分間の時間をかけ、室温においてアルゴン雰囲気下で添加した。反応混合物を室温で 2 時間攪拌し、次いで 40℃ で 1 時間攪拌した。混合物を酢酸エチルで希釈し、続いて水、炭酸水素ナトリウムの水溶液および飽和メタ重亜硫酸ナトリウム溶液で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。残渣をフラッシュクロマトグラフィにより精製して、表題の化合物を黄色の固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 3. 99 (2x 重複 s, 6H), 5. 35 (br. s, 1H), 7. 59 (d, $J=8. 4$ Hz, 1H), 7. 97 (dd, $J=8. 4, 2. 2$ Hz, 1H), 8. 22 (s, 1H), 8. 31 (d, $J=2. 2$ Hz, 1H).

LC-MS (方法 A): $t_R=1. 04$ min, $m/z=450$ [$M-1$], 452 [$M+1$].

【0207】

10

20

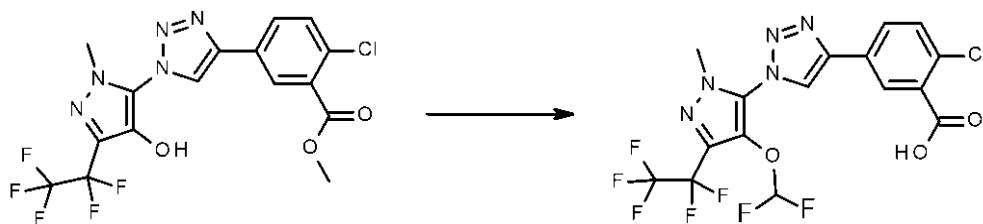
30

40

50

d) 2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]安息香酸の調製

【化38】



10

−78℃に冷却したアセトニトリル／水＝1：1混合物（10.6ml）中の2-クロロ-5-[1-[4-ヒドロキシ-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]安息香酸塩（0.24g、0.53mmol）および水酸化カリウム（0.6g、1.1mmol）の攪拌溶液にジエチル（プロモジフルオロメチル）ホスホネート（0.29g、1.1mmol）を添加した。反応混合物を室温に温め、次いでこの温度で週末にかけて攪拌した。GCMSおよびUPLCにより転換を監視した。反応混合物を酢酸エチルで希釈し、次いで続いて1N HCl、水および塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させて表題の化合物を得、これを次のステップにおいてさらに精製することなく用いた。

20

¹H NMR（400MHz, CDCl₃）δ ppm 3.98（s, 3H）, 6.37（t, J=72.6Hz, 1H）, 7.64（d, J=8.4Hz, 1H）, 8.08（dd, J=8.4, 2.2Hz, 1H）, 8.22（s, 1H）, 8.47（d, J=2.2Hz, 1H）.

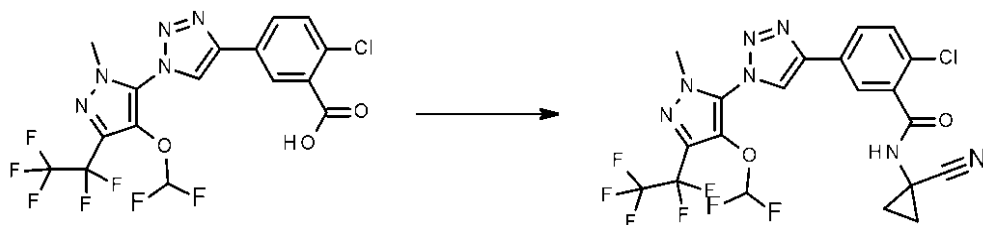
LC-MS（方法A）：t_R=1.04min, m/z=486 [M-1], 488 [M+1].

【0208】

e) 2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]ベンズアミドの調製

30

【化39】



塩化オキサリル（0.07g、0.53mmol）を乾燥ジクロロメタン（2.7ml）中に溶解し、続いて1滴のジメチルホルムアミドおよび2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]トリアゾール-4-イル]安息香酸（0.13g、0.27mmol）を添加した。反応混合物を室温で30分間攪拌し、次いで35℃で10分間攪拌した。その後、混合物を乾燥するまで蒸発させた。残った酸塩化物を乾燥ピリジン（1.3ml）中に溶解し、1-アミノ-1-シアノシクロプロパンヒドロクロリド（0.047g、0.40mmol）を0℃で添加した。反応混合物を室温で1時間攪拌した。生成物をフラッシュクロマトグラフィにより単離した。

40

¹H NMR（400MHz, CDCl₃）δ ppm 1.44（m, 2H）, 1.72（m, 2H）, 3.99（s, 3H）, 6.37（t, J=72.4Hz, 1H）, 6.9

50

0 (b r s, 1 H), 7. 5 6 (d, J = 8. 4 H z, 1 H), 8. 0 8 (d d, J = 8. 4, 2. 2 H z, 1 H), 8. 2 1 (d, J = 2. 2 H z, 1 H), 8. 2 2 (s, 1 H), 8. 4 7 (d, J = 2. 2 H z, 1 H).

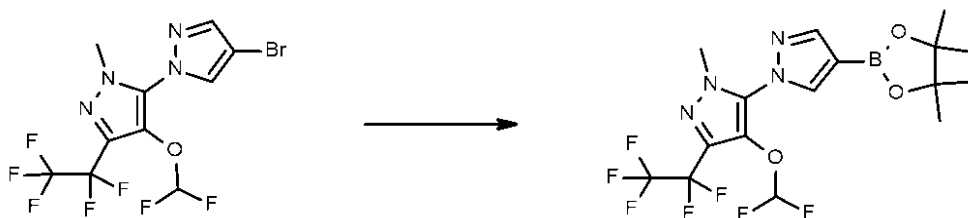
LC-MS (方法A) : $t_R = 1. 0 5 \text{ min}$, $m/z = 5 5 0 [M-1]$, $5 5 2 [M+1]$.

【0209】

実施例54 : 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]-N-メチル-ピリジン-3-カルボキサミドの調製

a) 4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-5-[4-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)ピラゾール-1-イル]ピラゾールの調製

【化40】



マイクロ波チューブに5-(4-ブromoピラゾール-1-イル)-4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール (8. 0 g、1 8 mmol)、4, 4, 5, 5-テトラメチル-2-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)-1, 3, 2-ジオキサボロラン (5. 6 g、2 2 mmol)、酢酸カリウム (5. 4 g、5 5 mmol) およびジオキサン (3 7 ml) を仕込んだ。アルゴンでパージした後、Pd (PPh₃)₄ (1. 1 g、0. 9 1 mmol) を添加した。チューブをシールし、マイクロ波反応器中において4 5 分間かけて1 4 0 °C に加熱した。反応混合物を酢酸エチル中に採り、水および塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させて粗生成物を得、これを次のステップにおいて直接用いた。

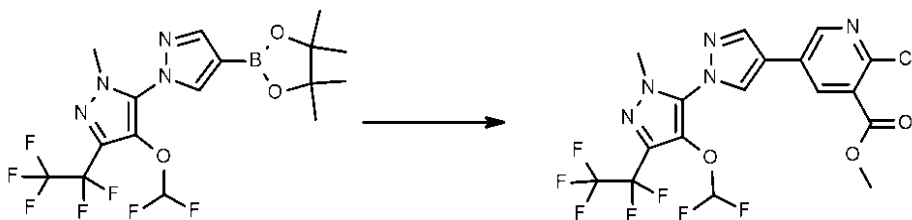
¹H NMR (4 0 0 MHz, CDCl₃) δ ppm 1. 3 6 (s, 1 2 H), 3. 8 5 (s, 3 H), 6. 2 8 (t, J = 7 2. 8 H z, 1 H), 8. 0 1 (s, 1 H), 8. 0 7 (s, 1 H).

LC-MS (方法A) : $t_R = 1. 1 8 \text{ min}$, $m/z = 4 5 7 [M-1]$, $4 5 9 [M+1]$.

【0210】

b) メチル2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボキシレートの調製

【化41】



マイクロ波チューブに4-(ジフルオロメトキシ)-1-メチル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)-5-[4-(4, 4, 5, 5-テトラメチル-1, 3, 2-ジオキサボロラン-2-イル)ピラゾール-1-イル]ピラゾール (3. 1 g、4

． 4 mmol)、メチル 5-ブロモ-2-クロロピリジン-3-カルボキシレート (1.0 g、4.0 mmol)、テトラヒドロフラン (53 ml)、水 (5.9 ml) および炭酸水素カリウム (1.2 g、12 mmol) を仕込んだ。アルゴンでパージした後、Pd(dppf)₂Cl₂ (0.17 g、0.20 mmol、0.050) を添加した。チューブをシールし、マイクロ波反応器中において 45 分間かけて 120 °C に加熱した。反応混合物を酢酸エチル中に採り、セライトパッドでろ過した。ろ液を水および塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗生成物をフラッシュクロマトグラフィ (シリカ、0~30% のシクロヘキサン/酢酸エチル勾配) により精製した。

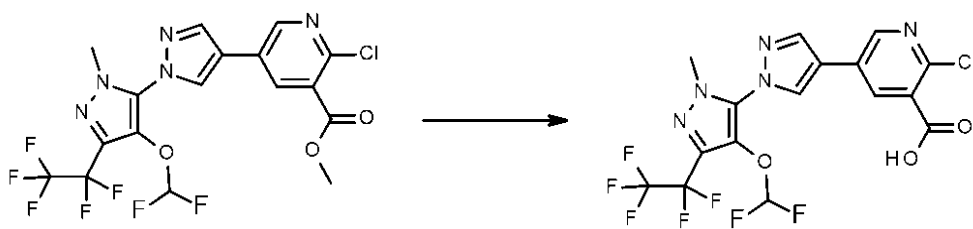
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.95 (s, 3H), 4.02 (s, 3H), 6.33 (t, J = 73.0 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.30 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.6 Hz, 1H).

LC-MS (方法 A): t_R = 1.12 min, m/z = 502 [M+1].

【0211】

c) 2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボン酸の調製

【化42】



メチル 2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボキシレート (1.4 g、2.8 mmol) をテトラヒドロフラン (14 mL) 中に溶解した。水 (3 mL) および水酸化リチウム一水和物 (0.29 g、7.0 mmol、2.5) を順次に添加し、混合物を室温で 1 時間攪拌した。テトラヒドロフランのほとんどをロータリーエバポレータにより除去した。水性残渣を 0 °C で 32% HCl により酸性化し、生成物を酢酸エチルで抽出した。抽出物を水および塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、蒸発させて黄色の固体を得、これを次のステップにおいてそのまま用いた。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.96 (s, 3H), 6.34 (t, J = 73.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.44 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 8.77 (d, J = 2.6 Hz, 1H).

LC-MS (方法 A): t_R = 1.00 min, m/z = 486 [M-1], 488 [M+1].

【0212】

d) 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミドの調製

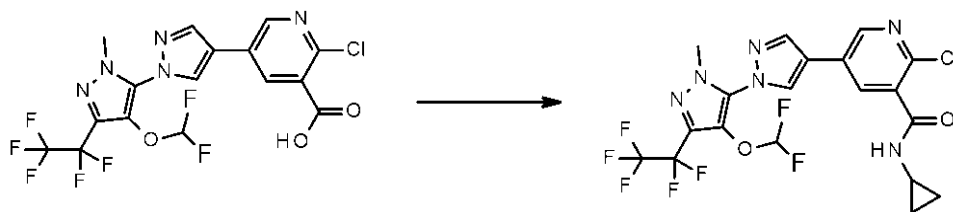
10

20

30

40

【化 4 3】



塩化オキサリル (0.30 g、2.3 mmol) を乾燥ジクロロメタン (11 ml) 中に溶解し、続いて1滴のジメチルホルムアミドおよび2-クロロ-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボン酸 (0.55 g、1.1 mmol) を添加した。反応混合物を室温で30分間攪拌し、次いで35℃で10分間攪拌した。その後、混合物を乾燥するまで蒸発させた。残った酸塩化物を乾燥ピリジン (6 ml) 中に溶解し、シクロピロピルアミン (0.13 g、2.3 mmol) を0℃で添加した。反応混合物を室温で1時間攪拌した。生成物をフラッシュクロマトグラフィにより単離した。

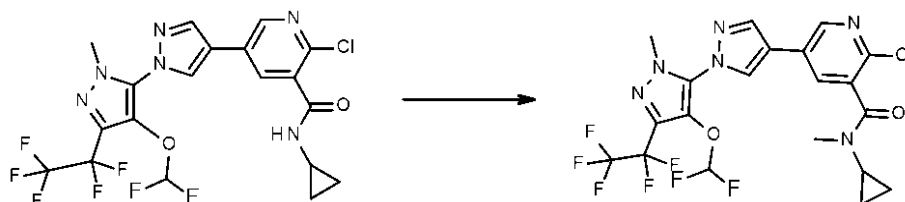
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm 0.71 (m, 2H), 0.95 (m, 2H), 2.98 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 6.33 (t, $J=7.2$ Hz, 1H), 6.69 (br s, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.29 (d, $J=2.6$ Hz, 1H), 8.64 (d, $J=2.6$ Hz, 1H).

LC-MS (方法A): $t_R=1.02$ min, $m/z=525$ [M-1], 527 [M+1].

【0213】

e) 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]-N-メチル-ピリジン-3-カルボキサミドの調製

【化 4 4】



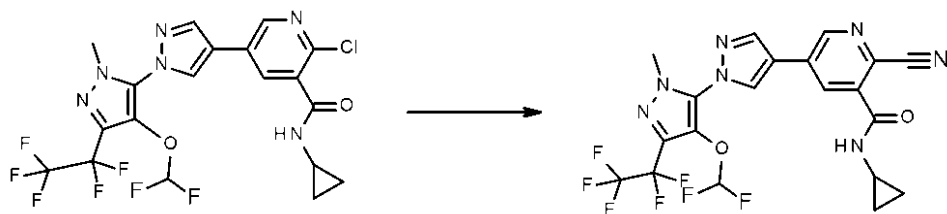
2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド (0.15 g、0.28 mmol) のN,N-ジメチルホルムアミド中の溶液に水素化ナトリウム (0.014 g、0.36 mmol、鉱油中の60%分散体) を室温で添加した。反応混合物を室温で30分間攪拌し、続いてヨードメタン (0.081 g、0.57 mmol) を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。生成物をフラッシュクロマトグラフィにより単離した。

LC-MS (方法A): $t_R=1.08$ min, $m/z=541$ [M+1].

【0214】

実施例 49: 2-シアノ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミドの調製

【化 4 5】



マイクロ波チューブに2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[1-[4-(ジフルオロメトキシ)-2-メチル-5-(1,1,2,2,2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-3-イル]ピラゾール-4-イル]ピリジン-3-カルボキサミド(0.05、0.095mmol)、シアン化亜鉛(0.011g、0.095mmol)、亜鉛粉末(1mg、0.011mmol)、1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン(2.1mg、0.0038mmol)、トリス(ジベンジリデンアセトン)ジパラジウム(0)(1.8mg、0.0019mmol)および乾燥N,N-ジメチルアセタミド(2.0mL)を仕込んだ。混合物をアルゴンでパージし、チューブをシールし、マイクロ波反応器中において1時間かけて140℃に加熱した。粗反応混合物をシリカによるフラッシュクロマトグラフィに供した。シリカで分解した生成物は同一の分子量を有する生成物をもたらした。

^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ ppm 1.05–1.15 (m, 4H), 2.82 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 6.35 (t, $J=72.8\text{Hz}$, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.25 (d, $J=1.8\text{Hz}$, 1H), 8.26 (s, 1H), 9.14 (d, $J=2.2\text{Hz}$, 1H).

LC-MS (方法A): $t_R=1.02\text{min}$, $m/z=516$ [M-1], 518 [M+1].

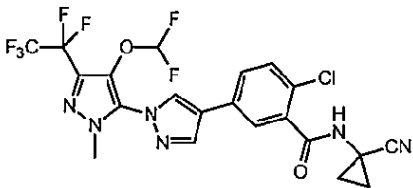
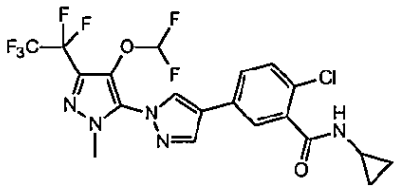
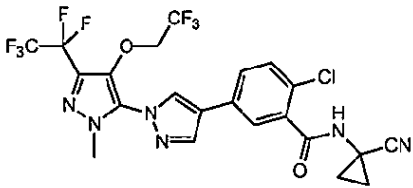
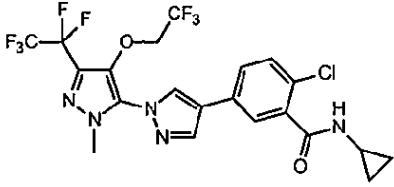
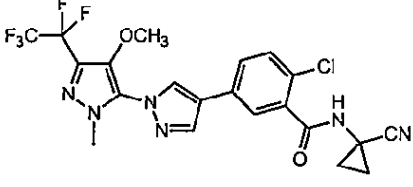
【0215】

特徴付けられた以下の化合物は、実施例1、2、15、16、49、54および64と同様に調製した。

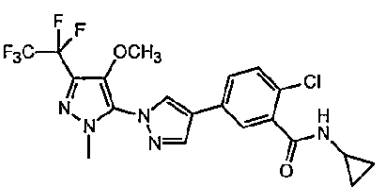
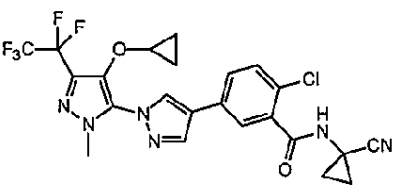
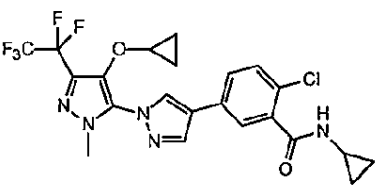
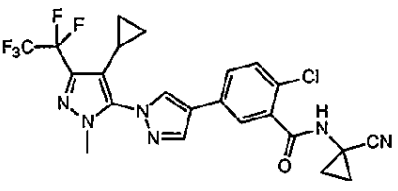
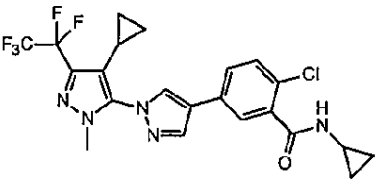
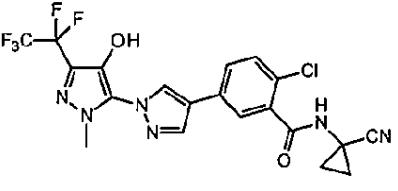
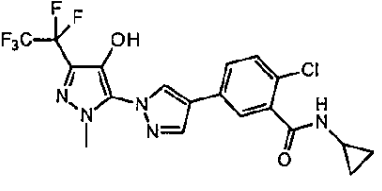
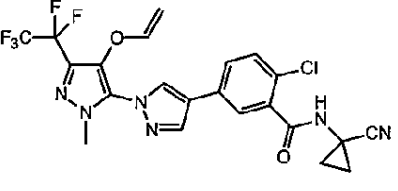
【0216】

【表 5 - 1】

表 1: 式(I)の化合物の例:

	構造	¹ H-NMR (400 MHz) LC MS (方法)	Mp [°C]
1		(CDCl ₃) δ ppm: 1.41 - 1.46 (m, 2 H) 1.67 - 1.72 (m, 2 H) 3.93 (s, 3 H) 6.12 - 6.51 (m, 1 H) 7.46 (d, <i>J</i> =8.07 Hz, 1 H) 7.57 (dd, <i>J</i> =8.25, 2.38 Hz, 1 H) 7.96 (d, <i>J</i> =2.20 Hz, 1 H) 8.03 (s, 1 H) 8.12 (s, 1 H)	138-139
2		(CDCl ₃) δ ppm 0.56 - 0.63 (m, 2 H) 0.81 - 0.87 (m, 2 H) 2.88 (tq, <i>J</i> =7.08, 3.71 Hz, 1 H) 3.85 (s, 3 H) 6.02 - 6.46 (m, 2 H) 7.33 - 7.48 (m, 2 H) 7.75 - 7.96 (m, 2 H) 7.98 - 8.07 (m, 1 H).	
3		LC-MS (A): <i>t</i> _R = 1.09 min, <i>m/z</i> = 583/5 [M+1] ⁺	
4			
5			

【表 5 - 2】

6		LC-MS (B): $t_R = 1.69$ min, $m/z = 490/2 [M+1]^+$	
7			
8			
9		LC-MS (B): $t_R = 1.79$ min, $m/z = 525/7 [M+1]^+$	
10			
11			
12			
13			

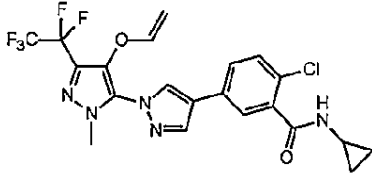
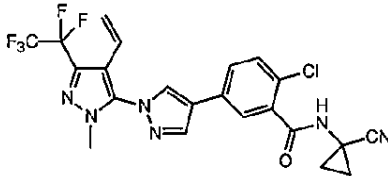
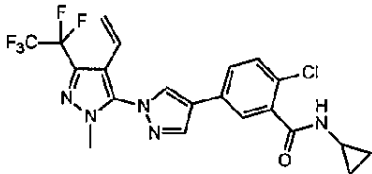
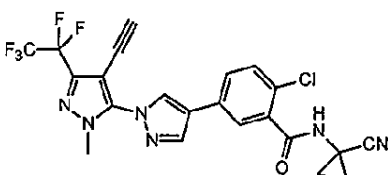
10

20

30

40

【表 5 - 3】

14			
15		(CDCl ₃) δ ppm 1.41 - 1.44 (m, 2 H) 1.68 - 1.72 (m, 2 H) 3.79 (s, 3 H) 4.92 (d, J=17.97 Hz, 1 H) 5.17 - 5.23 (m, 1 H) 6.49 (dd, J=17.79, 11.55 Hz, 1 H) 6.90 (s, 1 H) 7.45 (d, J=8.07 Hz, 1 H) 7.57 (dd, J=8.44, 2.20 Hz, 1 H) 7.90 (s, 1 H) 7.96 (d, J=2.20 Hz, 1 H) 8.14 (d, J=0.73 Hz, 1 H).	
16		(CDCl ₃) δ ppm 0.66 - 0.70 (m, 2 H) 0.89 - 0.94 (m, 2 H) 2.91 - 2.97 (m, 1 H) 3.78 (s, 3 H) 4.88 - 4.95 (m, 1 H) 5.19 (dd, J=11.55, 0.92 Hz, 1 H) 6.40 (br. s., 1 H) 6.49 (dd, J=17.97, 11.37 Hz, 1 H) 7.41 - 7.45 (m, 1 H) 7.49 - 7.53 (m, 1 H) 7.87 (d, J=0.73 Hz, 2 H) 8.13 (d, J=0.73 Hz, 1 H).	
17		LC-MS (B): t _R = 1.75 min, m/z = 509/11 [M+1] ⁺	

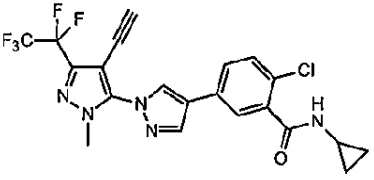
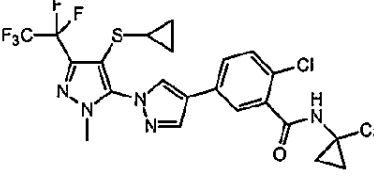
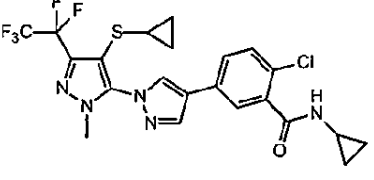
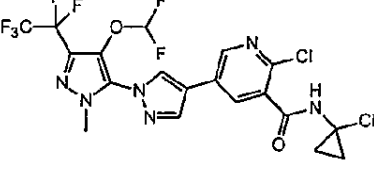
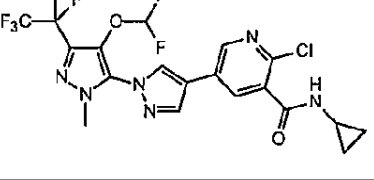
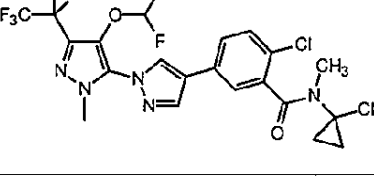
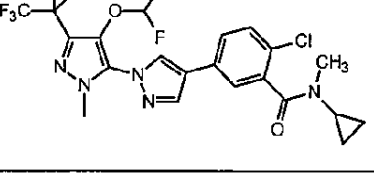
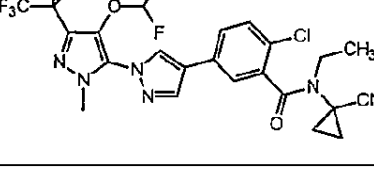
10

20

30

40

【表 5 - 4】

18		LC-MS (B): $t_R = 1.77$ min, $m/z = 484/6 [M+1]^+$	
19			72-4
20			69-71
21		LC-MS (B): $t_R = 1.64$ min, $m/z = 552/4 [M+1]^+$	
22		LC-MS (B): $t_R = 1.64$ min, $m/z = 527/9 [M+1]^+$	
23			
24			
25			

10

20

30

40

【表 5 - 5】

26			
27			
28			
29			
30			
31			
32			

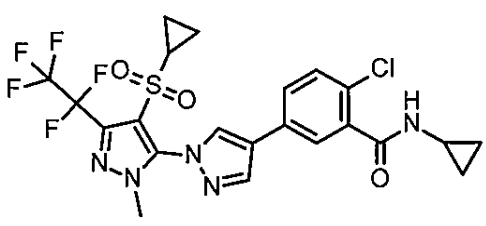
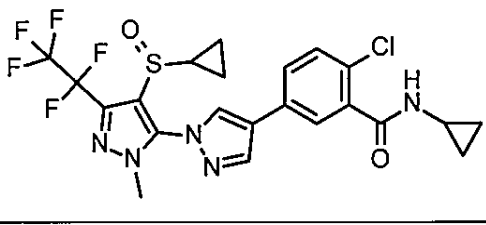
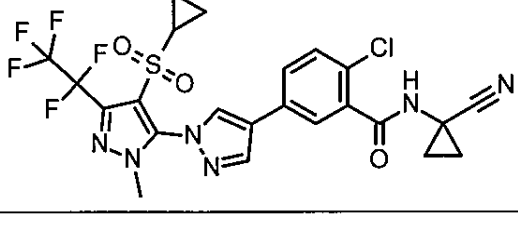
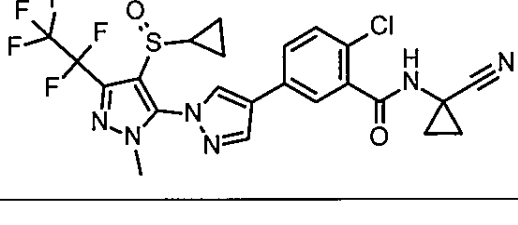
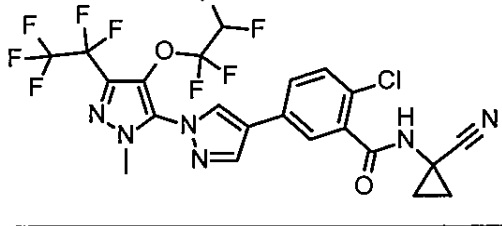
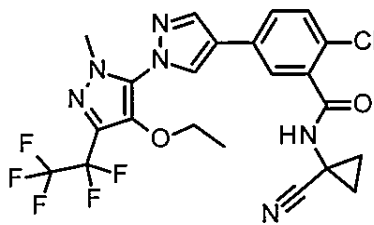
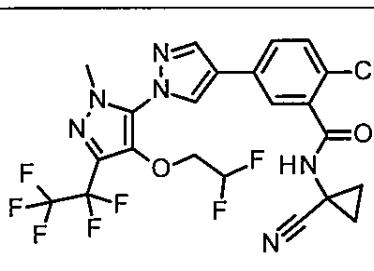
10

20

30

40

【表 5 - 6】

33			95-7
34			72-4
35			102-4
36			104-6
37		LC-MS (B): $t_R = 1.80$ min, $m/z = 601/03 [M+1]^+$	
38		LC-MS (B): $t_R = 1.77$ min, $m/z = 529/31 [M+1]^+$	169-70
39		LC-MS (B): $t_R = 1.75$ min, $m/z = 565/7 [M+1]^+$	

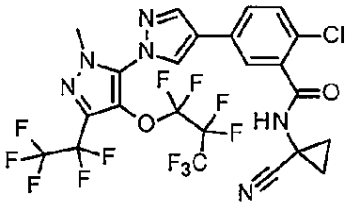
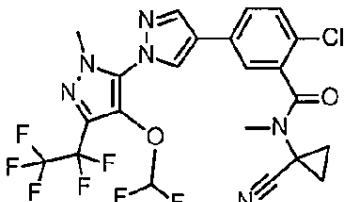
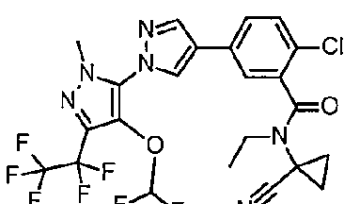
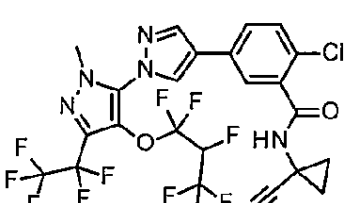
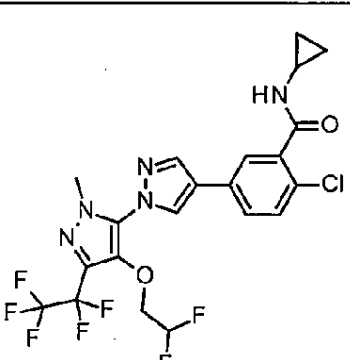
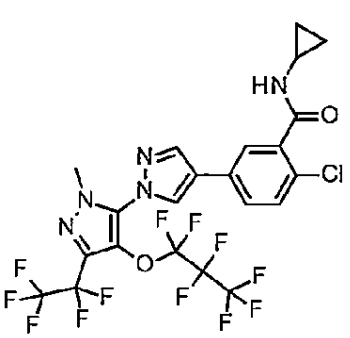
10

20

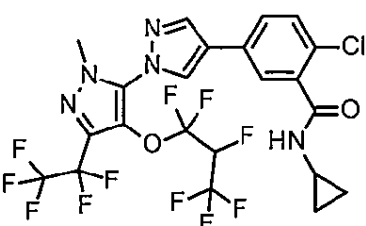
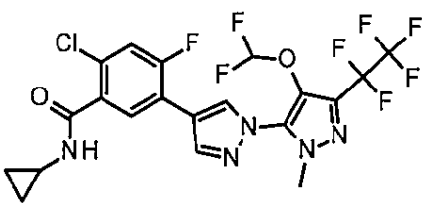
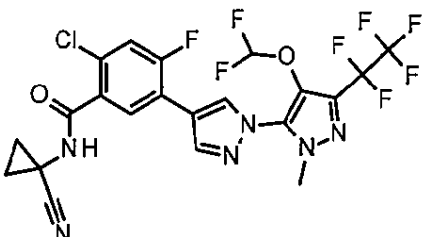
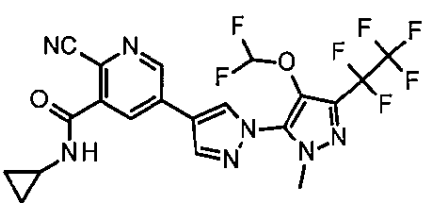
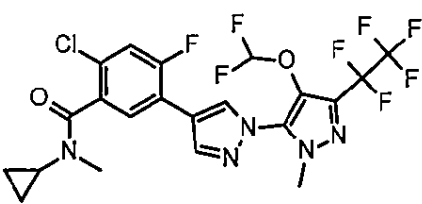
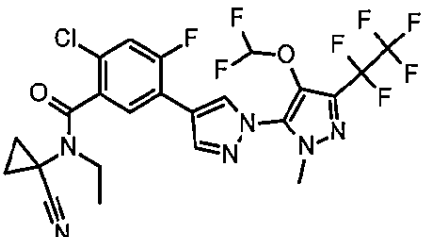
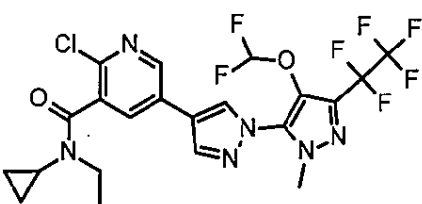
30

40

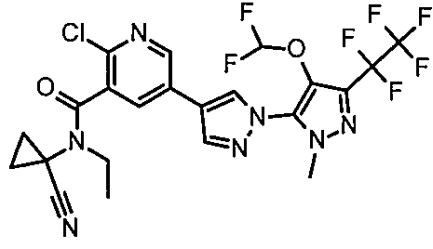
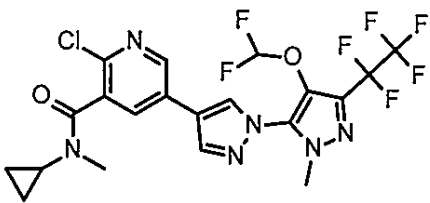
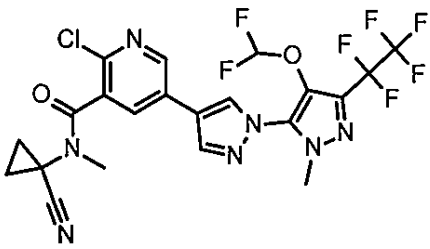
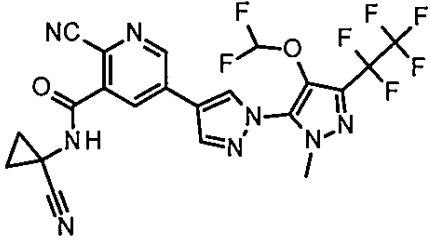
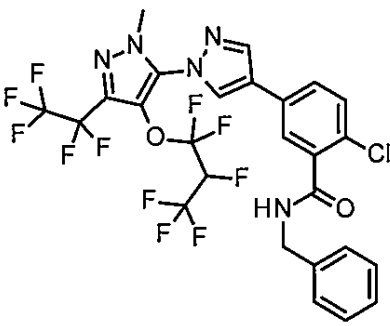
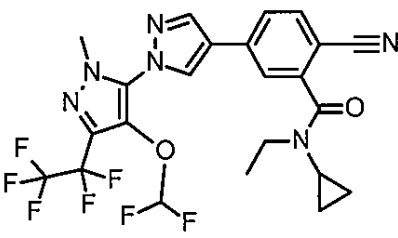
【表 5 - 7】

40		LC-MS (B): $t_R = 2.07$ min, $m/z = 669/71 [M+1]^+$	
41		LC-MS (B): $t_R = 1.86$ min, $m/z = 565/7 [M+1]^+$	10
42		LC-MS (B): $t_R = 1.92$ min, $m/z = 579/81 [M+1]^+$	20
43		LC-MS (B): $t_R = 1.92$ min, $m/z = 651/3 [M+1]^+$	
44		LC-MS (B): $t_R = 1.76$ min, $m/z = 540/2 [M+1]^+$	30
45		LC-MS (B): $t_R = 2.11$ min, $m/z = 644/6 [M+1]^+$	40

【表 5 - 8】

46		LC-MS (B): $t_R = 1.94$ min, $m/z = 626/8$ $[M+1]^+$	
47		LC-MS (A): $t_R = 1.13$ min, $m/z = 544$ $[M+1]^+$, 542 $[M-1]^-$	10
48		LC-MS (A): $t_R = 1.11$ min, $m/z = 569$ $[M+1]^+$, 567 $[M-1]^-$	20
49		LC-MS (A): $t_R = 1.01$ min, $m/z = 518$ $[M+1]^+$, 516 $[M-1]^-$	
50		LC-MS (A): $t_R = 1.17$ min, $m/z = 558$ $[M+1]^+$	30
51		LC-MS (A): $t_R = 1.17$ min, $m/z = 597$ $[M+1]^+$	40
52		LC-MS (A): $t_R = 1.07$ min, $m/z = 566$ $[M+1]^+$	

【表 5 - 9】

53		LC-MS (A): $t_R = 1.09$ min, $m/z = 580 [M+1]^+$	
54		LC-MS (A): $t_R = 1.08$ min, $m/z = 541 [M+1]^+$	
55		LC-MS (A): $t_R = 1.12$ min, $m/z = 555 [M+1]^+$, $553 [M-1]^-$	
56		LC-MS (A): $t_R = 1.03$ min, $m/z = 543 [M+1]^+$, $541 [M-1]^-$	
57		LC-MS (B): $t_R = 2.09$ min, $m/z = 676/8 [M+1]^+$	
58		LC-MS (A): $t_R = 1.12$ min, $m/z = 545 [M+1]^+$	

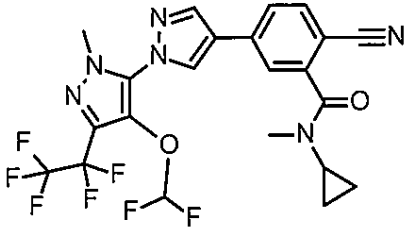
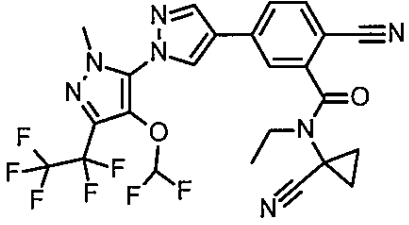
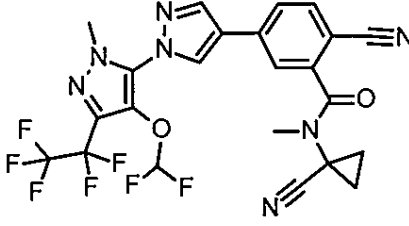
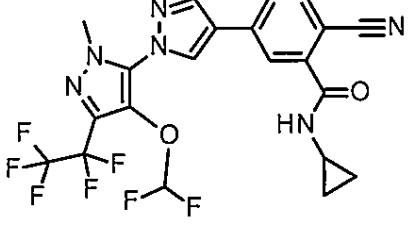
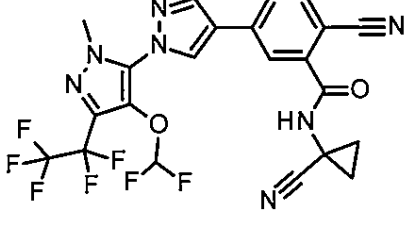
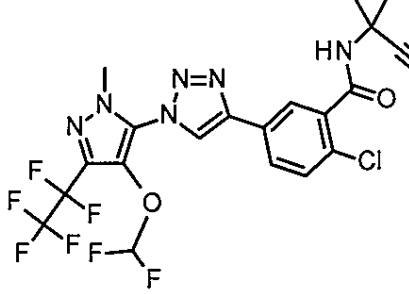
10

20

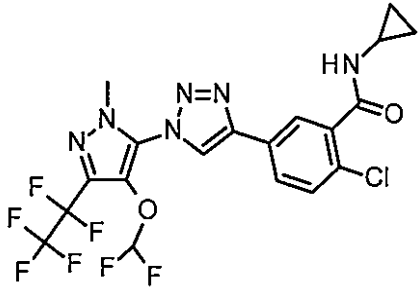
30

40

【表 5 - 10】

59		LC-MS (A): $t_R = 1.08$ min, $m/z = 531 [M+1]^+$	
60		LC-MS (A): $t_R = 1.10$ min, $m/z = 570 [M+1]^+$	10
61		LC-MS (A): $t_R = 1.07$ min, $m/z = 556 [M+1]^+$	20
62		LC-MS (A): $t_R = 1.04$ min, $m/z = 517 [M+1]^+$, $516 [M-1]^-$	30
63		LC-MS (A): $t_R = 1.03$ min, $m/z = 542 [M+1]^+$, $540 [M-1]^-$	
64		LC-MS (A): $t_R = 1.05$ min, $m/z = 552 [M+1]^+$, $550 [M-1]^-$	40

【表 5 - 1 1】

65		LC-MS (A): $t_R = 1.06$ min, $m/z = 527 [M+1]$	
----	---	---	--

10

【 0 2 1 7 】

【表 6】

製剤化実施例(% = 重量パーセント)

実施例 F1: 乳剤濃縮物

	a)	b)	c)
活性成分	25%	40%	50%
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	5%	8%	6%
ヒマシ油ポリエチレングリコールエーテル(36 モルの EO)	5%	-	-
トリブチルフェノキシポリエチレングリコールエーテル(30 モルの EO)	-	12%	4%
シクロヘキサノン	15%	20%	-
キシレン混合物	65%	25%	20%

20

【 0 2 1 8 】

任意の所望の濃度の乳剤が、水による希釈によってこのような濃縮物から調製され得る。

30

【 0 2 1 9 】

【表 7】

実施例 F2: 液剤

	a)	b)	c)	d)
活性成分	80%	10%	5%	95%
エチレングリコールモノメチルエーテル	20%	-	-	-
ポリエチレングリコール(分子量 400)	-	70%	-	-
N-メチルピロリド-2-オン	-	20%	-	-
エポキシ化ヤシ油	-	-	1%	5%
石油エーテル(沸点範囲: 160~190°)	-	-	94%	-

40

【 0 2 2 0 】

この液剤は、微液滴の形態で使用するのに好適である。

【 0 2 2 1 】

【表 8】

<u>実施例 F3: 粒剤</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分	5%	10%	8%	21%
カオリン	94%	-	79%	54%
高度に分散したシリカ	1%	-	13%	7%
アタパルジャイト	-	90%	-	18%

10

【0 2 2 2】

活性成分は、ジクロロメタンに溶解され、その溶液が、担体に噴霧され、その後、溶媒が、減圧下で蒸発される。

【0 2 2 3】

【表 9】

<u>実施例 F4: ダスト剤</u>	a)	b)
活性成分	2%	5%
高度に分散したシリカ	1%	5%
タルク	97%	-
カオリン	-	90%

20

【0 2 2 4】

即時使用可能なダスト剤が、担体および活性成分を均質混合することによって得られる。

【0 2 2 5】

【表 10】

<u>実施例 F5: 水和剤</u>	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%
オクチルフェノキシポリエチレングリコールエー	-	2%	-
テル(7~8 モルの EO)			
高度に分散したシリカ	5%	10%	10%
カオリン	62%	27%	-

30

40

【0 2 2 6】

活性成分は、添加剤と混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎される。これにより、水和剤が得られ、これは、水で希釈されて、任意の所望の濃度の懸濁液が得られる。

【0 2 2 7】

実施例 F 6 : 押出粒剤

50

活性成分：１０％

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：８７％

【０２２８】

活性成分は、添加剤と混合され、混合物は、粉碎され、水で濡らされ、押し出され、粒状にされ、空気流中で乾燥される。

【０２２９】

実施例 F 7：被覆粒剤

活性成分：３％

ポリエチレングリコール（分子量 200）：３％

カオリン：９４％

【０２３０】

ミキサー中において、微粉化された活性成分は、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。これにより、ほこりのない被覆された粒剤が得られる。

【０２３１】

実施例 F 8：懸濁濃縮物

活性成分：４０％

エチレングリコール：１０％

ノニルフェノキシポリエチレングリコールエーテル（１５モルの EO）：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％

３７％のホルムアルデヒド水溶液：０．２％

シリコーン油（７５％の水性乳剤）：０．８％

水：３２％

【０２３２】

微粉化された活性成分は、添加剤と均質混合される。任意の所望の濃度の懸濁液が、水による希釈により、このように得られた懸濁濃縮物から調製され得る。

【０２３３】

【表 1 1】

実施例 F9: 乾燥種子処理用粉末

	a)	b)	c)
活性処方成分	25%	50%	75%
軽質鉱油	5%	5%	5%
高分散ケイ酸	5%	5%	-
カオリン	65%	40%	-
タルカム	-	-	20%

【０２３４】

組合せを補助剤と完全に混合し、混合物を好適なミルで完全に粉碎して、種子処理に直接用いることが可能である粉末が得られる。

【０２３５】

実施例 F 10：乳化性濃縮物

活性処方成分：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：３％

（４～５mol のエチレンオキシド）

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（３５mol 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%

【0236】

植物の保護に用いることが可能であるいずれかの要求される希釈率のエマルジョンは、この濃縮物から水による希釈によって得ることが可能である。

【0237】

実施例 F11：種子処理用流動性濃縮物

活性処方成分：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 を伴う 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（20%水溶液の形態）：0.5%

モノアゾー顔料カルシウム塩：5%

シリコン油（75%水中エマルジョンの形態）：0.2%

水：45.3%

【0238】

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。

【0239】

本発明に係る組成物の活性は、他の殺虫的に、殺ダニ的に、および／または殺真菌的に活性な成分を加えることによってかなり範囲が拡大され、一般的な状況に適合され得る。実施形態 1～25 のいずれか 1 つに記載の化合物と、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。

【0240】

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。

【0241】

実施形態 1～25 のいずれか 1 つに記載の化合物と、活性成分との以下の混合物が好ましい（「TX」という略語は、「実施形態 1～25 のいずれか 1 つ、好ましくは表 1 からの 1 つの実施形態に記載の化合物から選択される 1 つの化合物を意味する）：

石油（代替名）（628）+ TX からなる物質の群から選択される補助剤、

1, 1-ビス（4-クロロフェニル）-2-エトキシエタノール（IUPAC 名）（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、 α -シペルメトリン（202）+ TX、アミジチオン（870）+ TX、アミドフルメト [CCN] + TX、アミドチオエート（872）+ TX、アミトン（875）+ TX、アミトンシュウ酸水素塩（875）

+TX、アミトラズ（24）+TX、アラマイト（881）+TX、三酸化ニヒ素（882）+TX、AVI 382（化合物コード）+TX、AZ 60541（化合物コード）+TX、アジンホスーエチル（44）+TX、アジンホスーメチル（45）+TX、アゾベンゼン（IUPAC名）（888）+TX、アゾシクロチン（46）+TX、アゾトエート（889）+TX、ベノミル（62）+TX、ベノキサホス（代替名）[CCN]+TX、ベンゾキシメート（71）+TX、安息香酸ベンジル（IUPAC名）[CCN]+TX、ビフェナゼート（74）+TX、ビフェントリン（76）+TX、ビナバクリル（907）+TX、プロフェンバレレート（代替名）+TX、プロモシクレン（918）+TX、プロモホス（920）+TX、プロモホスーエチル（921）+TX、プロモプロピレート（94）+TX、ブプロフェジン（99）+TX、ブトカルボキシム（103）+TX、ブトキシカルボキシム（104）+TX、ブチルピリダベン（代替名）+TX、多硫化カルシウム（IUPAC名）（111）+TX、カンフェクロル（941）+TX、カーボノレート（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、クロルフェンビンホス（131）+TX、クロロベンジレート（975）+TX、クロロメブホルム（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）+TX、クロルピリホスーメチル（146）+TX、クロルチオホス（994）+TX、シネリンI（696）+TX、シネリンII（696）+TX、シネリン（696）+TX、クロフェンテジン（158）+TX、クロサンテル（代替名）[CCN]+TX、クマホス（174）+TX、クロタミトン（代替名）[CCN]+TX、クロトキシホス（1010）+TX、クフラネブ（1013）+TX、シアントエート（1020）+TX、シフルメトフェン（CAS登録番号：400882-07-7）+TX、シハロトリン（196）+TX、シヘキサチン（199）+TX、シペルメトリン（201）+TX、DCPM（1032）+TX、DDT（219）+TX、デメフィオン（1037）+TX、デメフィオンーO（1037）+TX、デメフィオンーS（1037）+TX、デメトン（1038）+TX、デメトンーメチル（224）+TX、デメトンーO（1038）+TX、デメトンーOーメチル（224）+TX、デメトンーS（1038）+TX、デメトンーSーメチル（224）+TX、デメトンーSーメチルスルホン（1039）+TX、ジアフェンチウロン（226）+TX、ジアリホス（1042）+TX、ジアジノン（227）+TX、ジクロフルアニド（230）+TX、ジクロルボス（236）+TX、ジクリホス（代替名）+TX、ジコホル（242）+TX、ジクロトホス（243）+TX、ジエノクロル（1071）+TX、ジメホックス（1081）+TX、ジメトエート（262）+TX、ジナクチン（代替名）（653）+TX、ジネクス（1089）+TX、ジネクスージクレキシシン（1089）+TX、ジノブトン（269）+TX、ジノカップ（270）+TX、ジノカップー4 [CCN]+TX、ジノカップー6 [CCN]+TX、ジノクトン（1090）+TX、ジノペントン（1092）+TX、ジノスルホン（1097）+TX、ジノテルボン（1098）+TX、ジオキサチオン（1102）+TX、ジフェニルスルホン（IUPAC名）（1103）+TX、ジスルフィラム（代替名）[CCN]+TX、ジスルホトン（278）+TX、DNOC（282）+TX、ドフェナピン（1113）+TX、ドラメクチン（代替名）[CCN]+TX、エンドスルファン（294）+TX、エンドチオン（1121）+TX、EPN（297）+TX、エプリノメクチン（代替名）[CCN]+TX、エチオン（309）+TX、エトエートーメチル（1134）+TX、エトキサゾール（320）+TX、エトリムホス（1142）+TX、フェナザフロル（1147）+TX、フェナザキン（328）+TX、酸化フェンブタスズ（330）+TX、フェノチオカルブ（337）+TX、フェンプロバトリン（342）+TX、フェンピラド（代替名）+T

10

20

30

40

50

X、フェンピロキシメート（345）+TX、フェンソン（1157）+TX、フェント
 リファニル（1161）+TX、フェンバレート（349）+TX、フィプロニル（3
 54）+TX、フルアクリピリム（360）+TX、フルアズロン（1166）+TX、
 フルベンジミン（1167）+TX、フルシクロクスロン（366）+TX、フルシトリ
 ネート（367）+TX、フルエネチル（1169）+TX、フルフェノクスロン（37
 0）+TX、フルメトリン（372）+TX、フルオルベンシド（1174）+TX、フ
 ルバリネート（1184）+TX、FMC 1137（開発コード）（1185）+TX
 、ホルメタネート（405）+TX、塩酸ホルメタネート（405）+TX、ホルモチオ
 ン（1192）+TX、ホルムパラネート（1193）+TX、 γ -HCH（430）+
 TX、グリオジン（1205）+TX、ハルフェンプロックス（424）+TX、ヘプテ
 ノホス（432）+TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート（IUPAC/
 ケミカルアブストラクツ名）（1216）+TX、ヘキシチアゾクス（441）+TX、
 ヨードメタン（IUPAC名）（542）+TX、イソカルボホス（代替名）（473）
 +TX、イソプロピルO-（メトキシアミノチオホスホリル）サリチレート（IUPAC
 名）（473）+TX、イベルメクチン（代替名）[CCN]+TX、ジャスモリンI（
 696）+TX、ジャスモリンII（696）+TX、ヨードフェンホス（1248）+
 TX、リンダン（430）+TX、ルフェヌロン（490）+TX、マラチオン（492
 ）+TX、マロノベン（1254）+TX、メカルバム（502）+TX、メホスホラン
 （1261）+TX、メスルフェン（代替名）[CCN]+TX、メタクリホス（126
 6）+TX、メタミドホス（527）+TX、メチダチオン（529）+TX、メチオカル
 ブ（530）+TX、メトミル（531）+TX、臭化メチル（537）+TX、メト
 ルカルブ（550）+TX、メビンホス（556）+TX、メキサカルベート（1290
 ）+TX、ミルベメクチン（557）+TX、ミルベマイシンオキシム（代替名）[CC
 N]+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（代替名）[CCN]+TX、ナレド（5
 67）+TX、NC-184（化合物コード）+TX、NC-512（化合物コード）+
 TX、ニフルリジド（1309）+TX、ニコマイシン（代替名）[CCN]+TX、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）+T
 X、NNI-0101（化合物コード）+TX、NNI-0250（化合物コード）+T
 X、オメトエート（594）+TX、オキサミル（602）+TX、オキシデプロホス（
 1324）+TX、オキシジスルホトン（1325）+TX、pp'-DDT（219）
 +TX、パラチオン（615）+TX、ペルメトリン（626）+TX、石油（代替名）
 （628）+TX、フェンカプトン（1330）+TX、フェントエート（631）+T
 X、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（64
 2）+TX、ピリミホス-メチル（652）+TX、ポリクロロテルペン（慣用名）（1
 347）+TX、ポリナクチン（代替名）（653）+TX、プロクロノール（1350
 ）+TX、プロフェノホス（662）+TX、プロマシル（1354）+TX、プロパル
 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
 チオホス（quintiofos）（1381）+TX、R-1492（開発コード）
 （1382）+TX、RA-17（開発コード）（1383）+TX、ロテノン（722
 ）+TX、シュラーダン（1389）+TX、セブホス（代替名）+TX、セラメクチン
 （代替名）[CCN]+TX、SI-0009（化合物コード）+TX、ソファミド（1
 402）+TX、スピロジクロフェン（738）+TX、スピロメシフェン（739）+
 TX、SSI-121（開発コード）（1404）+TX、スルフィラム（代替名）[C
 CN]+TX、スルフラム（代替名）[CCN]+TX、スルホテップ（753）+TX、硫黄

10

20

30

40

50

(754) + TX、S Z I - 1 2 1 (開発コード) (757) + TX、ターフルバリネート (398) + TX、テブフェンピラド (763) + TX、TEPP (1417) + TX、テルバム (代替名) + TX、テトラクロルビンホス (777) + TX、テトラジホン (786) + TX、テトラナクチン (代替名) (653) + TX、テトラスル (1425) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオカルボキシム (1431) + TX、チオフアノックス (800) + TX、チオメトン (801) + TX、チオキノックス (1436) + TX、ツリングエンシン (代替名) [CCN] + TX、トリアミホス (1441) + TX、トリアラテン (1443) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、トリクロルホン (824) + TX、トリフェノホス (1455) + TX、トリナクチン (代替名) (653) + TX、バミドチオン (847) + TX、バニリプロール [CCN] および Y I - 5 3 0 2 (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、

10

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

20

クロラロース (127) + TX、エンドリン (1122) + TX、フェンチオン (346) + TX、ピリジン-4-アミン (IUPAC 名) (23) およびストリキニーネ (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 (代替名) [CCN] + TX、カスガマイシン (483) + TX、塩酸カスガマイシン水和物 (483) + 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、オキシリン酸 (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 (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺菌剤、

30

コカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV (代替名) (12) + TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) (代替名) (13) + TX、ムチカブリダニ属 (*Amblyseius* spp.) (代替名) (19) + TX、アナグラファ・ファルシフェラ (*Anagrapa falcifera*) NPV (代替名) (28) + TX、アナグルス・アトムス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アフエリヌス・アブドミナリ

40

50

ス (*Aphelinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、アフィ
 ジウス・コレマニ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、
 アフィドレテス・アフィジミザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代
 替名) (35) + TX、オートグラファ・カリフォルニカ (*Autographa ca
 lifornica*) NPV (代替名) (38) + TX、バチルス・フィルムス (*Bac
 illus firmus*) (代替名) (48) + TX、バチルス・スフェリクス・ネイ
 デ (*Bacillus sphaericus Neide*) (学名) (49) + TX、
 バチルス・チューリングゲンシス・ベルリナー (*Bacillus thuringien
 sis Berliner*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングゲンシス亜
 種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis subsp. aiza 10
 wai*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種イスラエンシス (
Bacillus thuringiensis subsp. israelensis
) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種ジャポネンシス (*Bac
 illus thuringiensis subsp. japonensis*) (学名
) (51) + TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種クルスターキ (*Bacillus
 thuringiensis subsp. kurstaki*) (学名) (51) + T
 X、バチルス・チューリングゲンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuri
 ngiensis subsp. tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ビ
 ューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) +
 TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniart 20
 ii*) (代替名) (54) + TX、クリソペラ・カルネア (*Chrysoperla c
 arnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptol
 aemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、コドリंगा (*C
 ydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ
 (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバ
 チ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバ
 チ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ
 (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカ
 タバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテ
 ロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacter 30
 iophora*) および H. メギディス (*H. megidis*) (代替名) (433) +
 TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (
 442) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピィ (*Leptomastix dac
 tylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリギノスス (*Macr
 olophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*M
 amestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィカ
 ス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + T
 X、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリズム (*Metarhizium aniso
 pliae 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. 40
 anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodipri
 on sertifer*) NPV および N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV
 (代替名) (575) + TX、オリウス属 (*Orius spp.*) (代替名) (596
) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumoso
 roseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulu
 s persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spo
 doptera exigua*) 多カブシド核多角体病ウイルス (学名) (741) + T
 X、スタイナーネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替
 名) (742) + TX、スタイナーネマ・カルボカプサエ (*Steinernema c
 arpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・フェルチアエ (50

Steinernema feltiae) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・グラッセリ (Steinernema glaseri) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (Steinernema riobrave) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・リオブラビス (Steinernema riobravis) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (Steinernema scapterisci) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマ属 (Steinernema spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラムマ属 (Trichogramma spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (Typhlodromus occidentalis) (代替名) (844) およびパーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、

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

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

(E) -デカ-5-エン-1-イルアセテートおよび (E) -デカ-5-エン-1-オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) -トリデカ-4-エン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) -6-メチルヘプタ-2-エン-4-オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) -テトラデカ-4, 10-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) -ドデカ-7-エン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) -ヘキサデカ-11-エナール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) -ヘキサデカ-11-エン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) -ヘキサデカ-13-エン-11-イン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) -イコサ-13-エン-10-オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) -テトラデカ-7-エン-1-アール (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) -テトラデカ-9-エン-1-オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) -テトラデカ-9-エン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) -ドデカ-7, 9-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) -テトラデカ-9, 11-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) -テトラデカ-9, 12-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14-メチルオクタデカ-1-エン (IUPAC 名) (545) + TX、4-メチルノナン-5-オールおよび 4-メチルノナン-5-オン (IUPAC 名) (544) + TX、 α -マルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、キュールア (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ-8-エン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ-9-エン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ-8 + TX、10-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア (代替名) [CCN] + TX、4-メチルオクタタン酸エチル (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシップルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (

10

20

30

40

50

421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジェノール (代替名) [CCN] + TX、イブセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャボニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ループルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ-2, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (588) + TX、オクタデカ-3, 13-ジエン-1-イルアセテート (IUPAC名) (589) + TX、オルフラルア (代替名) [CCN] + TX、オリクタルア (代替名) (317) + TX、オストラモン (代替名) [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン (代替名) (736) + TX、スルカトール (代替名) [CCN] + TX、テトラデカ-11-エン-1-イルアセテート (IUPAC名) (785) + TX、トリメドルア (839) + TX、トリメドルアA (代替名) (839) + TX、トリメドルアB₁ (代替名) (839) + TX、トリメドルアB₂ (代替名) (839) + TX、トリメドルアC (代替名) (839) およびトランクーコール (trunc-call) (代替名) [CCN] + TXからなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

10

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、ジメチルカルバート [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、

20

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-ジクロロプロペン (IUPAC名) (1063) + TX、1-プロモ-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) + 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 (プロパー-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-プロモ-1-クロロプロパー-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 (プロパー-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 (代替名) [CCN] + TX、アセトプロール [CCN] + TX、アクリナトリン (9) + TX、アクリロニトリル (IUP

30

40

50

AC名) (861) + TX、アラニカルブ (15) + TX、アルジカルブ (16) + TX、
 アルドキシカルブ (863) + TX、アルドリソ (864) + TX、アレソリン (17)
 + TX、アロサミジン (代替名) [CCN] + TX、アリキシカルブ (866) + TX、
 α-シペルメトリソ (202) + TX、α-エクジソソ (代替名) [CCN] + TX、
 リン化アルミニウム (640) + TX、アミジチオン (870) + TX、アミドチオエー
 ト (872) + TX、アミノカルブ (873) + TX、アミトソ (875) + TX、アミ
 トソシュウ酸水素塩 (875) + TX、アミトラズ (24) + TX、アナバシソ (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、アザジラクチソ (代替名) (41) + TX、ア
 ザメチホス (42) + TX、アジンホスーエチル (44) + TX、アジンホスーメチル (10
 45) + TX、アゾトエー (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ソ (代替名) (52) + TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム (代替名) [CCN]
 + TX、多硫化バリウム (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (892) + TX、バルトリソ [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、ベソスルタッ (66)
 + TX、β-シフルトリソ (194) + TX、β-シペルメトリソ (203) + TX、ビフェントリソ
 (76) + TX、ビオアレトリソ (78) + TX、ビオアレトリソS-シクロペンテニル異性体
 (代替名) (79) + TX、ビオエタノメトリソ [CCN] + TX、ビオペルメトリソ (908)
 + TX、ビオレスメトリソ (80) + TX、ビス (2-クロロエチル) エーテル (IUPAC名)
 (909) + TX、ビストリフルロソ (83) + TX、ホウ砂 (86) + TX、プロフェンバレエ
 ト (代替名) + TX、プロムフェンビンホス (914) + TX、プロモシクレソ (918) + TX、
 プロモ-DDT (代替名) [CCN] + TX、プロモホス (920) + TX、プロモホスーエチル
 (921) + TX、ブフェンカルブ (924) + TX、ブプロフェジソ (99) + TX、ブタカル
 ブ (926) + TX、ブタチオホス (927) + TX、ブトカルボキシソ (103) + TX、ブト
 ネット (932) + TX、ブトキシカルボキシソ (104) + TX、ブチルピリダベン (代替名)
 + TX、カズサホス (109) + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、シアソ化カルシウム
 (444) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC名) (111) + TX、カンフェクロル (941) + TX、
 カーバソレエ (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) + TX、カルボフェノチオン (947) + TX、カルボスルファン (119) + TX、カル
 タッ (123) + TX、カルタッ塩酸塩 (123) + TX、セバジソ (代替名) (725) + TX、
 クロルビシクレソ (960) + TX、クロルダン (128) + TX、クロルデコソ (963) + TX、
 クロルジメホルム (964) + TX、クロルジメホルム塩酸塩 (964) + TX、クロルエト
 キシホス (129) + TX、クロルフェナピル (130) + TX、クロルフェンビンホス
 (131) + TX、クロルフルアズロソ (132) + TX、クロルメホス (136) + TX、クロロ
 ホルム [CCN] + TX、クロロピクリソ (141) + TX、クロルホキシソ (989) + TX、
 クロルブラゾホス (990) + TX、クロルピリホス (145) + TX、クロルピリホスー
 メチル (146) + TX、クロルチオホス (994) + TX、クロマフェソジド (150) + TX、
 シネリソ I (696) + TX、シネリソ II (696) + TX、シネリソ (696) + TX、シス
 レスメトリソ (代替名) + TX、シスメトリソ (80) + TX、クロシトリソ (代替名)
 + TX、クロエトカルブ (999) + TX、クロサソテル (代替名) [CCN] + TX、クロチ
 アニジソ (165) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、ヒ酸銅 [CCN] + TX、
 オレイソ酸銅 [CCN] + TX、クマホス (174) + TX、クミトエー (1006) + TX、
 クロタミトソ (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1010) + TX、クルホ
 マー (1011) + TX、氷晶石 (代替名) (177) + TX、CS 708 (開発コード) (1012)
 + TX、シアソフェンホス (1019)

10

20

30

40

50

+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)+T
 X、シハロトリン(196)+TX、シペルメトリン(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(代替名)[CCN]
 +TX、d-リモネン(代替名)[CCN]+TX、d-テトラメトリン(代替名)(7
 88)+TX、DAEP(1031)+TX、ダゾメット(216)+TX、DDT(2
 19)+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、
 ジカプトン(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(代替名)+TX、ジクレシル(代替名)[CCN]+T
 X、ジクロトホス(243)+TX、ジシクラニル(244)+TX、ジェルドリン(1
 070)+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート(IUPAC名
)(1076)+TX、ジフルベンズロン(250)+TX、ジロール(代替名)[CC
 N]+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)+T
 X、ジメチルビンホス(265)+TX、ジメチラン(1086)+TX、ジネクス(1
 089)+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(2
 71)+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(代替名)[CCN]+TX、DSP(1115)+TX、エクジステロ
 ン(代替名)[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(1
 120)+TX、エンペントリン(292)+TX、エンドスルファン(294)+TX
 、エンドチオン(1121)+TX、エンドリン(1122)+TX、EPBP(112
 3)+TX、EPN(297)+TX、エポフェノナン(1124)+TX、エプリノメ
 クチン(代替名)[CCN]+TX、エスフェンバレート(302)+TX、エタホス
 (代替名)[CCN]+TX、エチオフエンカルブ(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、エチルー
 DDD(代替名)(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、エトフェンプロ
 ックス(319)+TX、エトリムホス(1142)+TX、EXD(1143)+TX
 、ファンファー(323)+TX、フェナミホス(326)+TX、フェナザフロル(1
 147)+TX、フェンクロルホス(1148)+TX、フェネタカルブ(1149)+
 TX、フェンフルトリン(1150)+TX、フェニトロチオン(335)+TX、フェ
 ノブカルブ(336)+TX、フェノキサクリム(1153)+TX、フェノキシカルブ
 (340)+TX、フェンピリトリン(1155)+TX、フェンプロパトリン(342
)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、フ
 ェンチオン(346)+TX、フェンチオン-エチル[CCN]+TX、フェンバレエ
 ト(349)+TX、フィプロニル(354)+TX、フロニカミド(358)+TX、
 フルベンジアミド(CAS. 登録番号: 272451-65-7)+TX、フルコフロン
 (1168)+TX、フルシクロクスロン(366)+TX、フルシトリネート(367
)+TX、フルエネチル(1169)+TX、フルフェネリム[CCN]+TX、フルフ

10

20

30

40

50

エノクスロン (370) + TX、フルフェンプロックス (1171) + TX、フルメトリ
 ン (372) + TX、フルバリネート (1184) + TX、FMC 1137 (開発コー
 ド) (1185) + TX、ホノホス (1191) + TX、ホルメタネート (405) + T
 X、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 (1194) + TX、ホスピレート (119
 5) + TX、ホスチアゼート (408) + TX、ホスチエタン (1196) + TX、フラ
 チオカルブ (412) + TX、フレトリン (1200) + TX、 γ -シハロトリン (19
 7) + TX、 γ -HCH (430) + TX、グアザチン (422) + TX、酢酸グアザチ
 ン (422) + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ハルフェンプロック
 ス (424) + TX、ハロフェノジド (425) + TX、HCH (430) + TX、HE
 OD (1070) + TX、ヘプタクロル (1211) + 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 (8
 64) + TX、ヒドラメチルノン (443) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ハ
 イドロプレン (445) + TX、ヒキンカルブ (1223) + TX、イミダクロブリド (4
 58) + TX、イミプロトリン (460) + TX、インドキサカルブ (465) + TX
 、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、IPSP (1229) + TX、イサ
 ゴホス (1231) + TX、イソベンザン (1232) + TX、イソカルボホス (代替名)
 (473) + TX、イソドリル (1235) + TX、イソフェンホス (1236) + T
 X、イソラン (1237) + TX、イソプロカルブ (472) + TX、イソプロピルオー
 (メトキシアミノチオホスホリル) サリチレート (IUPAC名) (473) + TX、イ
 ソプロチオラン (474) + TX、イソチオエート (1244) + TX、イソキサチオン
 (480) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ジャスモリン I (69
 6) + TX、ジャスモリン II (696) + TX、ヨードフェンホス (1248) + TX
 、幼若ホルモン I (代替名) [CCN] + TX、幼若ホルモン II (代替名) [CCN]
 + TX、幼若ホルモン III (代替名) [CCN] + TX、ケレバン (1249) + TX
 、キノプレン (484) + TX、 λ -シハロトリン (198) + TX、ヒ酸鉛 [CCN]
 + TX、レピメクチン (CCN) + TX、レプトホス (1250) + TX、リンダン (4
 30) + TX、リリムホス (1251) + TX、ルフエヌロン (490) + TX、リチダ
 チオン (1253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート (IUPAC名) (101
 4) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) + TX、マラチオン (49
 2) + 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、メスルフエンホス
 (1263) + TX、メタフルミゾン (CCN) + TX、メタム (519) + TX、メタ
 ム-カリウム (代替名) (519) + TX、メタム-ナトリウム (519) + TX、メタ
 クリホス (1266) + TX、メタミドホス (527) + TX、フッ化メタンスルホニル
 (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1268) + TX、メチダチオン (529
) + TX、メチオカルブ (530) + TX、メトクロトホス (1273) + TX、メトミ
 ル (531) + TX、メトプレン (532) + TX、メトキン-ブチル (1276) + T
 X、メトトリン (代替名) (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 (代替名) [CCN] + TX、塩化メチレン [C
 CN] + 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 (1
 290) + TX、ミルベメクチン (557) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名)
 [CCN] + TX、ミパホックス (1293) + TX、ミレックス (1294) + TX
 、モノクロトホス (561) + TX、モルホチオン (1300) + TX、モキシデクチン
 (代替名) [CCN] + TX、ナフタロホス (代替名) [CCN] + TX、ナレド (56
 7) + 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) + T

10

20

30

40

50

X、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チオエート（IUPAC名）（1057）+TX、O, O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート（IUPAC名）（1074）+TX、O, O-ジエチルO-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオエート（IUPAC名）（1075）+TX、O, O, O', O'-テトラプロピルジ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（代替名）[CCN]+TX、ペンタクロロフェノール（623）+TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル（IUPAC名）（623）+TX、ペルメトリン（626）+TX、石油（代替名）（628）+TX、PH 60-38（開発コード）（1328）+TX、フェンカプトン（1330）+TX、フェノトリン（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、プラレトリン（655）+TX、プレコセンI（代替名）[CCN]+TX、プレコセンII（代替名）[CCN]+TX、プレコセンIII（代替名）[CCN]+TX、プリミドホス（1349）+TX、プロフェノホス（662）+TX、プロフルトリン[CCN]+TX、プロマシル（1354）+TX、プロメカルブ（1355）+TX、プロパホス（1356）+TX、プロペタンホス（673）+TX、プロボクサー（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、プロトリフェンビュート[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（代替名）[CCN]+TX、キナルホス（711）+TX、キナルホス-メチル（1376）+TX、キノチオン（1380）+TX、キンチオホス（1381）+TX、R-1492（開発コード）（1382）+TX、ラフォキサニド（代替名）[CCN]+TX、レスメトリン（719）+TX、ロテノン（722）+TX、RU 15525（開発コード）（723）+TX、RU 25475（開発コード）（1386）+TX、リアニア（代替名）（1387）+TX、リアノジン（慣用名）（1387）+TX、サバジラ（代替名）（725）+TX、シュラーダン（1389）+TX、セブホス（代替名）+TX、セラメクチン（代替名）[CCN]+TX、SI-0009（化合物コード）+TX、SI-0205（化合物コード）+TX、SI-0404（化合物コード）+TX、SI-0405（化合物コード）+TX、シラフルオフエン（728）+TX、SN 72129（開発コード）（1397）+TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN]

10

20

30

40

50

+TX、シアン化ナトリウム (444)+TX、フッ化ナトリウム (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1399)+TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム (1400)+TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (623)+TX、セレン酸ナトリウム (IUPAC名) (1401)+TX、ナトリウムチオシアネート [CCN]+TX、ソファミド (1402)+TX、スピノサド (737)+TX、スピロメシフェン (739)+TX、スピロテトラマト (CCN)+TX、スルコフロン (746)+TX、スルコフロン-ナトリウム (746)+TX、スルフルアミド (750)+TX、スルホテップ (753)+TX、フッ化スルフル (756)+TX、スルプロオス (1408)+TX、タール油 (代替名) (758)+TX、 τ -フルバリネート (398)+TX、タジムカルブ (1412)+TX、TDE (1414)+TX、テブフェノジド (762)+TX、テブフェンピラド (763)+TX、テブピリムホス (764)+TX、テフルベンズロン (768)+TX、テフルトリン (769)+TX、テメホス (770)+TX、TEPP (1417)+TX、テラレトリン (1418)+TX、テルバム (代替名)+TX、テルブホス (773)+TX、テトラクロロエタン [CCN]+TX、テトラクロルピンホス (777)+TX、テトラメトリン (787)+TX、 θ -シペルメトリン (204)+TX、チアクロプリド (791)+TX、チアフェノックス (代替名)+TX、チアメトキサム (792)+TX、チクロホス (1428)+TX、チオカルボキシム (1431)+TX、チオシクラム (798)+TX、チオシクラムシュウ酸水素塩 (798)+TX、チोजカルブ (799)+TX、チオフアノックス (800)+TX、チオメトン (801)+TX、チオナジン (1434)+TX、チオスルタップ (803)+TX、チオスルタップ-ナトリウム (803)+TX、ツリンギエンシン (代替名) [CCN]+TX、トルフェンピラド (809)+TX、トラロメトリン (812)+TX、トランスフルトリン (813)+TX、トランスペルメトリン (1440)+TX、トリアミホス (1441)+TX、トリアザメート (818)+TX、トリアゾホス (820)+TX、トリアズロン (代替名)+TX、トリクロルホン (824)+TX、トリクロルメタホス-3 (代替名) [CCN]+TX、トリクロロナート (1452)+TX、トリフェノホス (1455)+TX、トリフルムロン (835)+TX、トリメタカルブ (840)+TX、トリブレン (1459)+TX、バミドチオン (847)+TX、バニリプロール [CCN]+TX、ベラトリジン (代替名) (725)+TX、ベラトリン (代替名) (725)+TX、XMC (853)+TX、キシリルカルブ (854)+TX、YI-5302 (化合物コード)+TX、 ζ -シペルメトリン (205)+TX、ゼタメトリン (zetamethrin) (代替名)+TX、リン化亜鉛 (640)+TX、ゾラプロホス (1469) および ZXI 8901 (開発コード) (858)+TX、シアントラニリプロール [736994-63-19]+TX、クロラントラニリプロール [500008-45-7]+TX、シエノピラフェン [560121-52-0]+TX、シフルメトフェン [400882-07-7]+TX、ピリフルキナゾン [337458-27-2]+TX、スピネトラム [187166-40-1+187166-15-0]+TX、スピロテトラマト [203313-25-1]+TX、スルホキサフロール [946578-00-3]+TX、フルフィプロール [704886-18-0]+TX、メベルフルトリン [915288-13-0]+TX、テトラメチルフルトリン [84937-88-2]+TX、トリフルメゾピリム (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、チोजカルブ (799)+TX、酸化トリブチルスズ (913)+TX、トリフェンモルフ (

10

20

30

40

50

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 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-ジブロモ-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-ジクロロプロパン (IUPAC名) (1063) + TX、1, 3-ジクロロプロパン (233) + TX、3, 4-ジクロロテトラヒドロチオフエン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 (代替名) (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 (代替名) + 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 (代替名) (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 (代替名) + TX、ジメトエート (262) + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、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 (代替名) + 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 (代替名) [CCN] + TX、GY-81 (開発コード) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、キネチン (代替名) (210) + TX、メカルフォン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタム-カリウム (代替名) (519) + TX、メタム-ナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC-184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフエン (IUPAC/ケミカルアブストラクツ名) (1422) + TX、チアフエノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノール [CCN] + TX、YI-5302 (化合物コード) およびゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [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 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、

10

20

30

40

50

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、 α -クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アンチュ (antu) (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 (代替名) (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、 γ -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、

10

20

30

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 (代替名) (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 (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、ジシクロペンタジェン (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 (代替名) [CCN] およびリバビリン (代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、

40

酸化第二水銀 (512) + TX、オクチリノン (590) およびチオファネート-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、ビテルタノール [70585-36-3] + TX、ブロムコナゾール [116255-48-2] + TX、シプロコナゾール [94361-06-5] + TX、ジフェノコナゾール [119446-68-3] + TX、ジニコナゾール [83657-24-3] + TX、エポキシコナゾール [106325-08-0] + TX、フェンブコナゾール [114369-43-6] + TX、フルキンコナゾール [136426-54-5] + TX、フルシラゾール [85509-19-9] + TX、フルトリアホール [76674-21-0] + TX、ヘキサコナゾール [79983-71-4] + TX、イマザリル [35554-44-0] + TX、イ

50

ミベンコナゾール [8 6 5 9 8-9 2-7] + TX、イブコナゾール [1 2 5 2 2 5-2
 8-7] + TX、メトコナゾール [1 2 5 1 1 6-2 3-6] + TX、ミクロブタニル [8
 8 6 7 1-8 9-0] + TX、ペフラゾエート [1 0 1 9 0 3-3 0-4] + TX、ペ
 ンコナゾール [6 6 2 4 6-8 8-6] + TX、プロチオコナゾール [1 7 8 9 2 8-7
 0-6] + TX、ピリフェノックス [8 8 2 8 3-4 1-4] + TX、プロクロラズ [6
 7 7 4 7-0 9-5] + TX、プロピコナゾール [6 0 2 0 7-9 0-1] + TX、シメ
 コナゾール [1 4 9 5 0 8-9 0-7] + TX、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4-9 6-
 3] + TX、テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1-7 7-3] + TX、トリアジメホン [4
 3 1 2 1-4 3-3] + TX、トリアジメノール [5 5 2 1 9-6 5-3] + TX、トリ
 フルミゾール [9 9 3 8 7-8 9-0] + TX、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3-7 2
 -7] + TX、アンシミドール [1 2 7 7 1-6 8-5] + TX、フェナリモル [6 0 1
 6 8-8 8-9] + TX、ヌアリモル [6 3 2 8 4-7 1-9] + TX、ブピリメート [4
 1 4 8 3-4 3-6] + TX、ジメチリモール [5 2 2 1-5 3-4] + TX、エチリ
 モル [2 3 9 4 7-6 0-6] + TX、ドデモルフ [1 5 9 3-7 7-7] + TX、フェ
 ンプロピジン [6 7 3 0 6-0 0-7] + TX、フェンプロピモルフ [6 7 5 6 4-9 1
 -4] + TX、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4-3 0-8] + TX、トリデモルフ [8 1
 4 1 2-4 3-3] + TX、シプロジニル [1 2 1 5 5 2-6 1-2] + TX、メパニピ
 リム [1 1 0 2 3 5-4 7-7] + TX、ピリメタニル [5 3 1 1 2-2 8-0] + TX
 、フェンピクロニル [7 4 7 3 8-1 7-3] + TX、フルジオキシソニル [1 3 1 3 4 1
 -8 6-1] + TX、ベナラキシル [7 1 6 2 6-1 1-4] + TX、フララキシル [5
 7 6 4 6-3 0-7] + TX、メタラキシル [5 7 8 3 7-1 9-1] + TX、R-メタ
 ラキシル [7 0 6 3 0-1 7-0] + TX、オフレース [5 8 8 1 0-4 8-3] + TX
 、オキサジキシル [7 7 7 3 2-0 9-3] + TX、ベノミル [1 7 8 0 4-3 5-2]
 + TX、カルベンダジム [1 0 6 0 5-2 1-7] + TX、デバカルブ [6 2 7 3 2-9
 1-6] + TX、フベリダゾール [3 8 7 8-1 9-1] + TX、チアベンダゾール [1
 4 8-7 9-8] + TX、クロゾリネート [8 4 3 3 2-8 6-5] + TX、ジクロゾリ
 ン [2 4 2 0 1-5 8-9] + TX、イプロジオン [3 6 7 3 4-1 9-7] + TX、マ
 イクロゾリン [5 4 8 6 4-6 1-8] + TX、プロシミドン [3 2 8 0 9-1 6-8]
 + TX、ピンクロゾリン [5 0 4 7 1-4 4-8] + TX、ボスカリド [1 8 8 4 2 5-
 8 5-6] + TX、カルボキシシン [5 2 3 4-6 8-4] + TX、フェンフラム [2 4 6
 9 1-8 0-3] + TX、フルトラニル [6 6 3 3 2-9 6-5] + TX、メプロニル [5
 5 8 1 4-4 1-0] + TX、オキシカルボキシシン [5 2 5 9-8 8-1] + TX、ペ
 ンチオピラド [1 8 3 6 7 5-8 2-3] + TX、チフルザミド [1 3 0 0 0 0-4 0-
 7] + TX、グアザチン [1 0 8 1 7 3-9 0-6] + TX、ドジン [2 4 3 9-1 0-
 3] [1 1 2-6 5-2] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [1 3 5 1 6-2 7-3]
 + TX、アゾキシストロビン [1 3 1 8 6 0-3 3-8] + TX、ジモキシストロビン
 [1 4 9 9 6 1-5 2-4] + TX、エネステロブリン {Proc. BCPC, Int.
 Congr., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX、フルオキサストロビン [3 6 1 3 7 7-2 9-9]
 + TX、クレソキシム-メチル [1 4 3 3 9 0-8 9-0] + TX、メトミノストロビン [1 3 3 4 0 8-5 0-1]
 + TX、トリフロキシストロビン [1 4 1 5 1 7-2 1-7] + TX、オリザストロビン [2 4 8 5 9 3-1 6-0]
 + TX、ピコキシストロビン [1 1 7 4 2 8-2 2-5] + TX、ピラクロストロビン [1 7
 5 0 1 3-1 8-0] + TX、フェルバム [1 4 4 8 4-6 4-1] + TX、マンコゼブ
 [8 0 1 8-0 1-7] + TX、マネブ [1 2 4 2 7-3 8-2] + TX、メチラム [9
 0 0 6-4 2-2] + TX、プロピネブ [1 2 0 7 1-8 3-9] + TX、チラム [1 3
 7-2 6-8] + TX、ジネブ [1 2 1 2 2-6 7-7] + TX、ジラム [1 3 7-3 0
 -4] + TX、カプタホール [2 4 2 5-0 6-1] + TX、カプタン [1 3 3-0 6-
 2] + TX、ジクロフルアニド [1 0 8 5-9 8-9] + TX、フルオロイミド [4 1 2
 0 5-2 1-4] + TX、ホルベット [1 3 3-0 7-3] + TX、トリルフルアニド [7 3 1-2 7-1]
 + TX、ボルドー液 [8 0 1 1-6 3-0] + TX、水酸化銅 [2 0

10

20

30

40

50

4 2 7-5 9-2] + TX、オキシ塩化銅 [1 3 3 2-4 0-7] + TX、硫酸銅 [7 7
 5 8-9 8-7] + TX、酸化銅 [1 3 1 7-3 9-1] + TX、マンコッパー (man
 c o p p e r) [5 3 9 8 8-9 3-5] + TX、オキシ銅 [1 0 3 8 0-2 8-6]
 + TX、ジノカップ [1 3 1-7 2-6] + TX、ニトロタール-イソプロピル [1 0 5
 5 2-7 4-6] + TX、エディフェンホス [1 7 1 0 9-4 9-8] + TX、イプロベ
 ンホス [2 6 0 8 7-4 7-8] + TX、イソプロチオラン [5 0 5 1 2-3 5-1] +
 TX、ホスジフェン [3 6 5 1 9-0 0-3] + TX、ピラゾホス [1 3 4 5 7-1 8-
 6] + TX、トルクロホス-メチル [5 7 0 1 8-0 4-9] + TX、アシベンゾラル-
 S-メチル [1 3 5 1 5 8-5 4-2] + TX、アニラジン [1 0 1-0 5-3] + TX
 、ベンチアバリカルブ [4 1 3 6 1 5-3 5-7] + TX、ブラストサイジン-S [2 0
 7 9-0 0-7] + TX、キノメチオナト [2 4 3 9-0 1-2] + TX、クロロネブ [2
 6 7 5-7 7-6] + TX、クロロタロニル [1 8 9 7-4 5-6] + TX、シフルフ
 ェナミド [1 8 0 4 0 9-6 0-3] + TX、シモキサニル [5 7 9 6 6-9 5-7] +
 TX、ジクロン [1 1 7-8 0-6] + TX、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0-3 2-4
] + TX、ジクロメジン [6 2 8 6 5-3 6-5] + TX、ジクロラン [9 9-3 0-9
] + TX、ジエトフェンカルブ [8 7 1 3 0-2 0-9] + TX、ジメトモルフ [1 1 0
 4 8 8-7 0-5] + TX、SYP-LI 90 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7-4 7-9
] + TX、ジチアノン [3 3 4 7-2 2-6] + TX、エタボキサム [1 6 2 6 5 0-7
 7-3] + TX、エトリジアゾール [2 5 9 3-1 5-9] + TX、ファモキサドン [1
 3 1 8 0 7-5 7-3] + TX、フェナミドン [1 6 1 3 2 6-3 4-7] + TX、フェ
 ノキサニル [1 1 5 8 5 2-4 8-7] + TX、フェンチン [6 6 8-3 4-8] + TX
 、フェリムゾン [8 9 2 6 9-6 4-7] + TX、フルアジナム [7 9 6 2 2-5 9-6
] + TX、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0-1 5-7] + TX、フルスルファミド [1 0
 6 9 1 7-5 2-6] + TX、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3-1 7-8] + TX、ホ
 セチル-アルミニウム [3 9 1 4 8-2 4-8] + TX、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4-
 4 4-1] + TX、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3-1 7-7] + TX、IKF-9 1
 6 (シアゾファミド) [1 2 0 1 1 6-8 8-3] + TX、カスガマイシン [6 9 8 0-
 1 8-3] + TX、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2-4 9-6] + TX、メトラフェノン
 [2 2 0 8 9 9-0 3-6] + TX、ペンシクロン [6 6 0 6 3-0 5-6] + TX、フ
 タリド [2 7 3 5 5-2 2-2] + TX、ポリオキシシン [1 1 1 1 3-8 0-7] + TX
 、プロベナゾール [2 7 6 0 5-7 6-1] + TX、プロバモカルブ [2 5 6 0 6-4 1
 -1] + TX、プロキンアジド [1 8 9 2 7 8-1 2-4] + TX、ピロキロン [5 7 3
 6 9-3 2-1] + TX、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5-1 8-7] + TX、キントゼ
 ン [8 2-6 8-8] + TX、硫黄 [7 7 0 4-3 4-9] + TX、チアジニル [2 2 3
 5 8 0-5 1-6] + TX、トリアゾキシド [7 2 4 5 9-5 8-6] + TX、トリシク
 ラゾール [4 1 8 1 4-7 8-2] + TX、トリホリン [2 6 6 4 4-4 6-2] + TX
 、バリダマイシン [3 7 2 4 8-4 7-8] + TX、ゾキサミド (RH 7 2 8 1) [1 5
 6 0 5 2-6 8-5] + TX、マンジプロバミド [3 7 4 7 2 6-6 2-2] + TX、イ
 ソピラザム [8 8 1 6 8 5-5 8-1] + TX、セダキサン [8 7 4 9 6 7-6 7-6]
 + TX、3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (9-
 ジクロロメチレン-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1, 4-メタノ-ナフタレン-5-
 イル)-アミド (国際公開第 2 0 0 7/0 4 8 5 5 6 号に開示される) + TX、3-ジフ
 ルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸 (3', 4', 5'-トリ
 フルオロ-ビフェニル-2-イル)-アミド (国際公開第 2 0 0 6/0 8 7 3 4 3 号に
 開示される) + TX、[(3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12
 bS)-3-[(シクロプロピルカルボニル)オキシ]-1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6
 a, 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 [9
 1 5 9 7 2-1 7-7] + TX および 1, 3, 5-トリメチル-N-(2-メチル-1

10

20

30

40

50

ーオキソプロピル)ーNー[3ー(2ーメチルプロピル)ー4ー[2, 2, 2ートリフル
 オロー1ーメトキシー1ー(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]ー1Hーピラゾー
 ルー4ーカルボキサミド[926914ー55ー8]+TXからなる物質の群から選択さ
 れる生物学的に活性な化合物。

【0242】

活性成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば、[3878ー19ー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 Man
 ualーA World Compendium; Thirteenth Editio
 n; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会(The Brit
 ish 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; C
 ompendium of Pesticide Common Names, (著作権
)1995ー2004];例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネット
 アドレス: <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>に記載されている。

【0243】

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、あるいはそれらの表記の1つも使
 用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号
 」は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。

【0244】

実施形態1~25のいずれか1つに記載の化合物と、上記の活性成分との活性成分混合
 物は、実施形態1~25のいずれか1つに記載の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4:35
 0、または1:750、または2:750、または4:750の比率で含む。それらの混
 合比は、重量基準である。

【0245】

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。

【0246】

実施形態1~25のいずれか1つに記載の化合物と、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。実施形態 1~25 のいずれか 1 つに記載の化合物および上記の活性成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

【0247】

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

10

【0248】

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

【0249】

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

20

【0250】

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

30

【0251】

本発明の化合物およびその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば、果実、塊茎または穀粒などの種子、または苗の保護にも好適である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。あるいは、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することにより、または固体組成物の層を塗布することにより種子仁に塗付され得る（コーティング）。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を、例えば、ドリルまき (drilling) の際に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法およびこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物および防除される有害生物／真菌に応じて決まり、一般に、100 kg の種子当たり 1~200 グラム、好ましくは、100 kg の種子当たり 5~150 グラム（100 kg の種子当たり 10~100 グラムなど）である。

40

【0252】

種子という用語は、真正種子 (true seed)、種子片、吸枝、トウモロコシ粒 (corn)、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽 (cut shoot)

50

などを含むがこれらに限定されないあらゆる種類の種子および植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

【0253】

本発明は、実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物で被覆または処理されるかあるいはそれを含有する種子も含む。「で被覆または処理されるかおよび／またはそれを含有する」という用語は、一般に、活性成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、活性成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

10

【0254】

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

【0255】

実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物の殺有害生物性／殺虫特性は、以下のテストにより例示可能である。

20

【0256】

ジアブロチカバルテアタ（*Diabrotica balteata*）（コーンルートワーム）：

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層の上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより10'000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を外寄生させた（ウェル当たり6～10匹）。サンプルを外寄生の4日後に死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200ppmの施用量でもたらした：1、2、6、9、15、16、17、19、20、21、22、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46、58、59、61、62、64および65。

30

【0257】

ユースキスツスヘロス（*Euschistus heros*）（ネオトロピカルブラウンスティンクバグ（*Neotropical Brown Stink Bug*））：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ダイズの葉に、10'000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉にN2若虫を外寄生させた。サンプルを外寄生の5日後に死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200ppmの施用量でもたらした：1、2、6、9、15、16、17、19、20、21、22、33、34、35、36、37、38、39、40、41および42。

40

【0258】

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

ヒマワリの葉片を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したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の6日後に死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200ppmの施用量でもたらした：1、2、9、15、16、19、20、21、22、34、17、36、42および57。

【0259】

50

コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ) : 摂食/接触活性

人工飼料を含む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したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を外寄生させた(ウェル1当たり10~15匹)。サンプルを外寄生の5日後に死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200 ppmの施用量でもたらした: 1、2、6、9、15、16、17、19、20、21、22、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45、46および47。

【0260】

エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) : 摂食/接触活性

綿の葉片を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したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を外寄生させた。サンプルを外寄生の3日後に死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200 ppmの施用量でもたらした: 1、2、6、9、15、16、18、18、19、20、21、22、33、34、35、36、37、38、39、40、41、42、43、44、45および46。

【0261】

ナミハダニ (*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の葉片に、10'000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のダニ個体群を外寄生させた。サンプルを混合個体群(活動期)における外寄生から8日後の死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200 ppmの施用量でもたらした: 1、2、6、9、15、16、17、19、20、21、22、33、34、35、36、37、38、39、41、42および44。

【0262】

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

ヒマワリの葉片を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したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアザミウマ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の6日後に死亡率について評価した。以下の化合物が少なくとも80%の死亡率を200 ppmの施用量でもたらした: 6、9、16、19、20、22、22、33、34、35、36、37、40、41、42、43、45および46。

【0263】

本発明の化合物は、低施用量で効力が高いことにより公知の化合物とは区別可能であり、これは、実施例においてアウトラインされている実験手法を用い、必要に応じて、例えば50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppmまたは0.2 ppmといった低施用量を用いて当業者により検証可能である。

【0264】

生物学的比較データ:

化合物Aが国際公開第2014/122083号において実施例(Ic-2)(第82ページ、表3)として開示されている。化合物Aの活性を本発明に係る化合物41および42の活性と比較する。テストは、異なる濃度(ppm)で実施する。本発明の化合物41および42は、化合物Aと比較して驚くほど向上した活性を有することが分かる。

【0265】

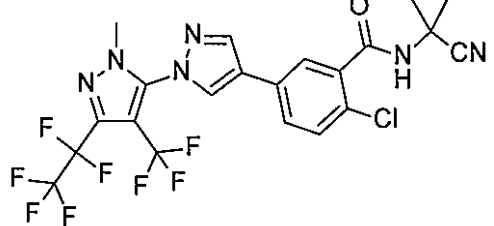
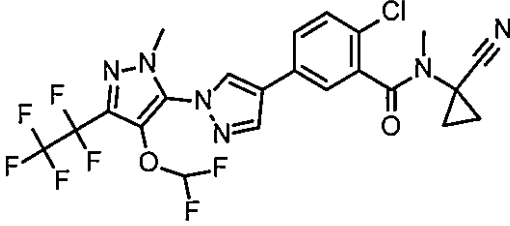
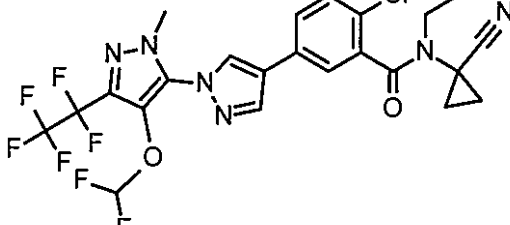
a) コナガ (*Plutella xylostella*) に対する殺虫活性 (コナガ、幼虫駆除剤L-2/3、摂食/接触)

アプリケーションチャンバ中においてハクサイ植物に希釈したテスト溶液を噴霧する。処理の1日後に切除した葉をペトリ皿に置き、10匹のL2を外寄生させる(2回反復)

。サンプルを死亡率、摂食挙動および成長調節について外寄生の5日後に確認する。

【0266】

【表12】

化合物	化合物構造	濃度(ppm)	死亡率(%)
Cpd A		0.8	100
		0.2	100
		0.05	85
		0.0125	35
Cpd 41		0.8	100
		0.2	100
		0.05	100
		0.0125	90
Cpd 42		0.8	100
		0.2	100
		0.05	100
		0.0125	95

【0267】

さらに、殺虫特性に加えて、実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物は、従来技術の化合物と比較して向上した分解特性を有することが意外にも示された。さらに、実施形態1～25のいずれか1つに記載の化合物は、従来技術の化合物と比較してハチに対する有害性が低いことが意外にも示された。

10

20

30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2017/053488

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D401/14 C07D403/04 A01N43/56 A01N43/64
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2012/107434 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; JUNG PIERRE JOSEPH MARCEL [CH]; HUETE) 16 August 2012 (2012-08-16) cited in the application claims 1, 10 -----	1-14
X	WO 2014/122083 A1 (BAYER CROPS SCIENCE AG [DE]) 14 August 2014 (2014-08-14) cited in the application claims 1, 10 -----	1-14
X	WO 2015/150442 A1 (BAYER CROPS SCIENCE AG [DE]) 8 October 2015 (2015-10-08) cited in the application claims 1, 11 ----- -/--	1-14

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

7 March 2017

Date of mailing of the international search report

17/03/2017

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Beligny, Samuel

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2017/053488

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2015/193216 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 23 December 2015 (2015-12-23) claims 1, 13 -----	1-14
X	WO 2015/193218 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 23 December 2015 (2015-12-23) cited in the application claims 1, 11 -----	1-14
X	WO 2016/020441 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 11 February 2016 (2016-02-11) claims 1, 13 -----	1-14
X	WO 2016/020436 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG [DE]) 11 February 2016 (2016-02-11) claims 1, 14 -----	1-14

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2017/053488

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2012107434 A1	16-08-2012	AR 085318 A1	25-09-2013
		BR 112013020213 A2	02-08-2016
		CA 2826059 A1	16-08-2012
		CN 103354811 A	16-10-2013
		EA 201300894 A1	30-01-2014
		EP 2673270 A1	18-12-2013
		KR 20140051835 A	02-05-2014
		UY 33895 A	28-09-2012
		WO 2012107434 A1	16-08-2012
WO 2014122083 A1	14-08-2014	AU 2014214140 A1	20-08-2015
		CA 2900029 A1	14-08-2014
		CN 105073735 A	18-11-2015
		CR 20150392 A	26-11-2015
		DO P2015000177 A	30-11-2015
		EA 201591452 A1	29-02-2016
		EP 2953942 A1	16-12-2015
		JP 2016511239 A	14-04-2016
		KR 20150116439 A	15-10-2015
		PH 12015501723 A1	09-11-2015
		TW 201518280 A	16-05-2015
		US 2015353500 A1	10-12-2015
		UY 35309 A	29-08-2014
		WO 2014122083 A1	14-08-2014
WO 2015150442 A1	08-10-2015	CN 106459000 A	22-02-2017
		EP 3126353 A1	08-02-2017
		TW 201623246 A	01-07-2016
		UY 36063 A	30-10-2015
		WO 2015150442 A1	08-10-2015
WO 2015193216 A1	23-12-2015	AU 2015276313 A1	12-01-2017
		TW 201611727 A	01-04-2016
		UY 36169 A	29-01-2016
		WO 2015193216 A1	23-12-2015
WO 2015193218 A1	23-12-2015	AU 2015276315 A1	12-01-2017
		TW 201625547 A	16-07-2016
		WO 2015193218 A1	23-12-2015
WO 2016020441 A1	11-02-2016	AU 2015299036 A1	23-02-2017
		TW 201619138 A	01-06-2016
		UY 36255 A	29-01-2016
		WO 2016020441 A1	11-02-2016
WO 2016020436 A1	11-02-2016	AU 2015299031 A1	23-02-2017
		TW 201619151 A	01-06-2016
		UY 36249 A	29-01-2016
		WO 2016020436 A1	11-02-2016

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), EP(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DJ, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KH, KN, KP, KR, KW, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ

(74)代理人 100119013

弁理士 山崎 一夫

(74)代理人 100123777

弁理士 市川 さつき

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100136249

弁理士 星野 貴光

(72)発明者 ジャンゲナ アンドレ

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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ビッテルナ トマス

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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 エル カセミ ミリエム

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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ストーラー アンドレ

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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 モンディエール レジス ジャン ジョルジュ

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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ビゴ アウレリアン

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 アクチェンゲゼルシャフト内

(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 アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 グリブコフ デニス

スイス 4 3 3 3 ミュンヒヴィーレン ブライテンロー 5 シンジェンタ クロップ プロテ
クション アクチェンゲゼルシャフト内

Fターム(参考) 4C063 AA01 AA03 BB02 CC22 DD12 DD22 EE03

4H011 AC01 AC04 BB09 DA02 DA14 DA15 DA16 DC05 DD03 DD04

DE15