

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 特 許 公 報 (B2)

(11) 特許番号

特許第5215190号
(P5215190)

(45) 発行日 平成25年6月19日 (2013. 6. 19)

(24) 登録日 平成25年3月8日 (2013. 3. 8)

(51) Int. Cl.

F I

C O 7 D 409/14 (2006. 01)

C O 7 D 409/14 C S P

C O 7 D 401/14 (2006. 01)

C O 7 D 401/14

C O 7 D 401/04 (2006. 01)

C O 7 D 401/04

A O 1 P 7/02 (2006. 01)

A O 1 P 7/02

A O 1 P 7/04 (2006. 01)

A O 1 P 7/04

請求項の数 7 (全 139 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願2008-549849 (P2008-549849)
(86) (22) 出願日 平成19年1月15日 (2007. 1. 15)
(65) 公表番号 特表2009-523715 (P2009-523715A)
(43) 公表日 平成21年6月25日 (2009. 6. 25)
(86) 国際出願番号 PCT/EP2007/000302
(87) 国際公開番号 W02007/080131
(87) 国際公開日 平成19年7月19日 (2007. 7. 19)
審査請求日 平成21年10月20日 (2009. 10. 20)
(31) 優先権主張番号 06000826.5
(32) 優先日 平成18年1月16日 (2006. 1. 16)
(33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)
(31) 優先権主張番号 06002803.2
(32) 優先日 平成18年2月13日 (2006. 2. 13)
(33) 優先権主張国 欧州特許庁 (EP)

(73) 特許権者 500584309
シンジェンタ パーティシペーションズ
アクチエンゲゼルシャフト
スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 パーゼ
ル, シュバルツバルトアレー 2 1 5
(74) 代理人 100099759
弁理士 青木 篤
(74) 代理人 100077517
弁理士 石田 敬
(74) 代理人 100087871
弁理士 福本 積
(74) 代理人 100087413
弁理士 古賀 哲次
(74) 代理人 100117019
弁理士 渡辺 陽一

最終頁に続く

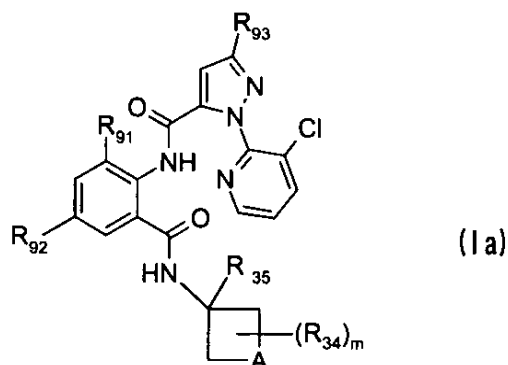
(54) 【発明の名称】 新規殺虫剤

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の式 (I a) :

【化 1】



[式中、

R₉₁は、C₁ - C₄アルキル又はハロゲンであり、

R_{92} は、ハロゲン又はシアノであり、
 R_{93} は、ハロゲン、 C_1-C_4 ハロアルキル又は C_1-C_4 ハロアルコキシであり、
 A は、 N -ベンジル、 SO 又は SO_2 であり、
 R_{34} は、水素又は C_1-C_4 アルキルであり、
 R_{35} は、水素又は C_1-C_4 アルキルであり、
 m は0、1、2、3又は4である。]

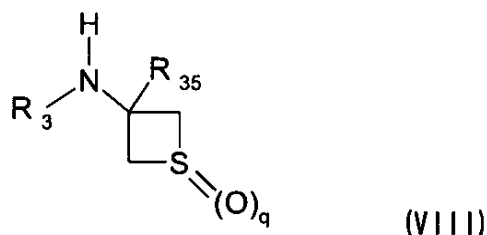
によって表される化合物、又はその化合物の農学的に許容される塩／ジアステレオマー／鏡像異性体／互変異性体／ N -オキシド。

【請求項2】

以下の式 (VIII) :

10

【化2】



20

[式中、 R_3 及び R_{35} は水素であり、 q は1である。]

によって表される化合物。

【請求項3】

有効成分として、遊離型若しくは農薬に利用可能な塩の形態のいずれの場合でも、式 (I a) によって表される請求項1に記載の化合物、又は適当であれば、その互変異性体の中の少なくとも1種類、及び少なくとも1種類の補助剤を含む殺虫組成物。

【請求項4】

昆虫、又はダニ目を防除するための、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

30

請求項3に記載の組成物を、病虫害又はそれらの環境に施用するステップを含む病虫害の防除方法。

【請求項6】

昆虫、又はダニ目を防除するための、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

育種材料、又は育種材料を植えた場所を処理するステップを含む、病虫害による侵襲から植物育種材料を保護するための、請求項5に記載の方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

40

本発明は、新規なアントラニルアミド誘導体、その調製方法、それらの化合物を含む組成物、並びに昆虫及びダニ目の代表的なものの防除のためのその利用に関する。

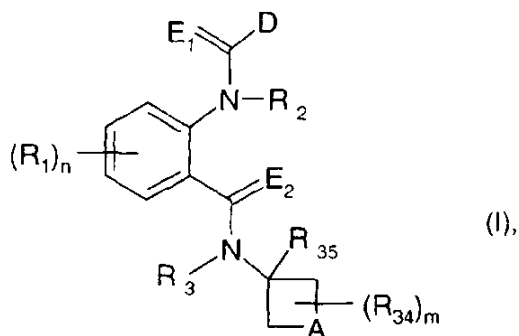
【0002】

殺虫特性を有するアントラニルアミド誘導体が知られており、例えば、WO 03/015518又はWO 2006/055922に記載されている。特に昆虫及びダニ目のメンバーの防除に対する殺虫特性を有する新規アントラニルアミド誘導体が、ここで見つかった。新規化合物は、フェニル環のアミノカルボニル置換基に取り付けられた飽和ヘテロ4員環を特徴とする。

【0003】

従って、本発明は、以下の式 (I) :

【化 1】



10

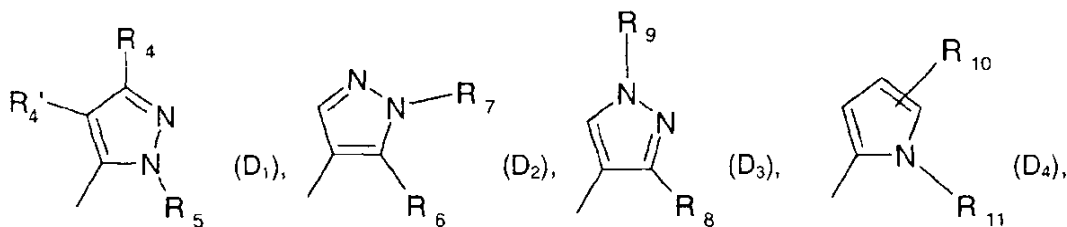
〔式中、

Dが、フェニル、2-ピリジル、3-ピリジルか、4-ピリジル；若しくはC₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄ハロアルコキシ、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄ハロアルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニル、C₁-C₄アルキルスルホニル、C₁-C₄ハロアルキルスルフィニルか、C₁-C₄ハロアルキルスルホニルによって一置換、二置換、若しくは三置換されたフェニル、2-ピリジル、3-ピリジル、若しくは4-ピリジルであるか；又は

20

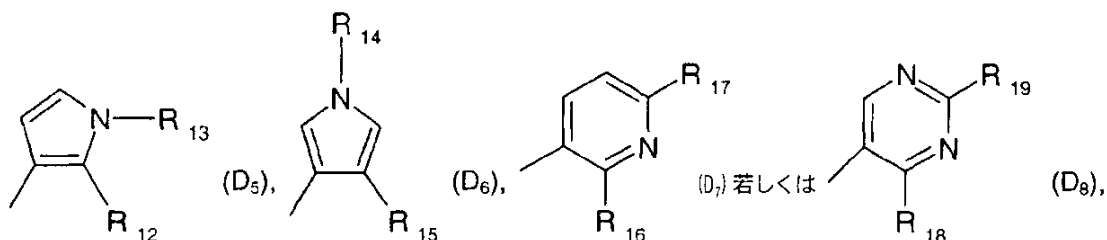
Dが、以下の基：

【化 2】



30

【化 3】



40

{ 式中、

R₄、R₄'、R₁₀、R₁₇、及びR₁₉が、互いに独立に、水素、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₆ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄ハロアルコキシ、C₂-C₄アルコキシカルボニル、C₁-C₄アルキルチオ、C₁-C₄ハロアルキルチオ、C₁-C₄アルキルスルフィニル、C₁-C₄アルキルスルホニル、C₁-C₄ハロアルキルスルフィニル、若しくはC₁-C₄ハロアルキルスルホニルであり；

R₅、R₆、R₈、R₁₁、R₁₂、R₁₅、R₁₆、及びR₁₈が、互いに独立に、C₁-C₆アルキル、若し

50

くはハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_2 - C_4 アルコシカルボニル、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、 C_2 - C_4 ジアルキルアミノか、 C_3 - C_6 シクロアルキルアミノによって一置換、二置換、若しくは三置換された C_1 - C_6 アルキルであるか；又はフェニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジルであるか；又は C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 ハロアルキルスルフィニル、若しくは C_1 - C_4 ハロアルキルスルホニルによって一置換、二置換、若しくは三置換されたフェニル、2-ピリジル、3-ピリジル、4-ピリジルであり；

10

R_7 、 R_9 、 R_{13} 、及び R_{14} が、互いに独立に、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 ハロアルケニル、 C_3 - C_6 アルケニル、若しくは C_3 - C_6 ハロアルケニルである。} であり；

各 R_1 が、独立に、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 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_6 シクロアルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_2 - C_6 ハロアルケニル、 C_2 - C_6 ハロアルキニル、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 ハロアルキルスルホニル、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、 C_2 - C_4 ジアルキルアミノ、 C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ、 C_1 - C_6 アルキル- C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ、 C_2 - C_4 アルキルカルボニル、 C_2 - C_6 アルコシカルボニル、 C_2 - C_6 アルキルアミノカルボニル、 C_3 - C_6 ジアルキルアミノカルボニル、 C_2 - C_6 アルコシカルボニルオキシ、 C_2 - C_6 アルキルアミノカルボニルオキシ、 C_3 - C_6 ジアルキルアミノカルボニルオキシ、若しくは C_3 - C_6 トリアルキルシリルであるか、フェニル、ベンジル、若しくはフェノキシであるか、又はハロゲン、シアノ、ニトロ、ハロゲン、 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_6 シクロアルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_2 - C_6 ハロアルケニル、 C_2 - C_6 ハロアルキニル、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、 C_2 - C_4 ジアルキルアミノ、 C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ、 C_1 - C_6 アルキル- C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ、 C_2 - C_4 アルキルカルボニル、 C_2 - C_6 アルコシカルボニル、 C_2 - C_6 アルキルアミノカルボニル、 C_3 - C_6 ジアルキルアミノカルボニル、 C_2 - C_6 アルコシカルボニルオキシ、 C_2 - C_6 アルキルアミノカルボニルオキシ、 C_3 - C_6 ジアルキルアミノカルボニルオキシ、若しくは C_3 - C_6 トリアルキルシリルによって一置換、二置換、若しくは三置換されたフェニル、ベンジル、若しくはフェノキシであり；

20

30

n が、0、1、2、又は3であり；

R_2 及び R_3 のそれぞれが、同じであるか若しくは異なっているかもしれないところの、水素、 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、若しくは C_3 - C_8 シクロアルキルを表すか；又はハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 アルキルアミノ、 C_2 - C_4 ジアルキルアミノ、 C_3 - C_6 シクロアルキルアミノ、及び C_1 - C_6 アルキル- C_3 - C_6 シクロアルキルアミノから選択される1つ以上の置換基によって置換された 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、若しくは C_3 - C_8 シクロアルキルを表し；

40

E_1 及び E_2 のそれぞれが、同じであるか若しくは異なっているかもしれないところの、酸素又は硫黄を表し；

Aが、酸素、硫黄、 SO 、 SO_2 、 $S(O)_p$ 、 $N-R$ 、 $C=N-OR_{36}$ 、 $N-R_0$ 、 $C=O$ 、又は $P(X)_t-R_{33}$ ：
{式中、

R_{33} が、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、ヒドロキシ、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_3 - C_6 シクロアルキル- C_1 - C_6 アルキル、ベンジル、又はフェニル（ここで、それらの一部に関してフェニル及びベン

50

ジルが、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、若しくはニトロによって一置換、二置換、若しくは三置換されるかもしれない。)であるか；又は R_{33} が、 O^-Na^+ 、 O^-Li^+ 、又は O^-K^+ であり；

R_{36} が、水素、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_2 - C_6 ハロアルケニル、 C_2 - C_6 ハロアルキニル、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、又はベンジルであり；

Xが、酸素又は硫黄であり；

pが、0又は1であり；

tが、0又は1であり；

Rが、水素、 C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又はRが、 C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシによって置換された C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又はRが、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R_{26}$ 、 $-C(O)OR_{27}$ 、 $-CONR_{28}R_{29}$ 、 $-SO_2R_{30}$ 、若しくは $-P(O)(OR_{31})(OR_{32})$ であり；

R_0 が、水素、 C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又は R_0 が、 C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシによって置換された C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又は R_0 が、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R_{026}$ 、 $-C(O)OR_{027}$ 、 $-CONR_{028}R_{029}$ 、 $-SO_2R_{030}$ 、若しくは $-P(O)(OR_{031})(OR_{032})$ であるか；又は R_0 が、フェニルかベンジル、若しくは C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 ハロアルキルスルフィニル、及び C_1 - C_4 ハロアルキルスルホニルから選択される置換基によって一置換、二置換、若しくは三置換されたフェニルかベンジル；

(上記式中、

R_{26} 及び R_{026} のそれぞれが、同じであるか若しくは異なるかもしれないところの、水素、 C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、若しくは C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキルを表すか；又は C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシによって置換された C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、若しくは C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキルを表し；

R_{27} 、 R_{28} 、 R_{29} 、 R_{30} 、 R_{31} 、 R_{32} 、 R_{027} 、 R_{028} 、 R_{029} 、 R_{030} 、 R_{031} 、及び R_{032} のそれぞれが、同じであるか若しくは異なるかもしれないところの、 C_1 - C_6 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、若しくは C_3 - C_6 ハロシクロアルキルを表すか；又は C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシによって置換された C_1 - C_6 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、若しくは C_3 - C_6 ハロシクロアルキルを表す。} であり；

R_{34} 及び R_{35} のそれぞれが、同じであるか若しくは異なっているかもしれないところの、

水素、COOH、ハロゲン、ニトロ、シアノ、ヒドロキシ、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_2 - C_6 アルケニル、 C_2 - C_6 アルキニル、 C_2 - C_6 ハロアルケニル、 C_2 - C_6 ハロアルキニル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 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、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルスルフィニル、 C_1 - C_6 ハロアルキルスルホニル、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル、 C_3 - C_6 アルキルアミノカルボニル、 C_3 - C_6 ジアルキルアミノカルボニル、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、 C_1 - C_6 ハロアルコキシ、 C_1 - C_6 アルキルアミノ、 C_2 - C_6 ジアルキルアミノ、 C_3 - C_6 トリアルキルシリル、ベンジル、又はフェニル（ここで、それらの一部に関してフェニル及びベンジルが、 C_1 - C_6 アルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、 C_1 - C_6 ハロアルコキシ、ハロゲン、シアノ、ヒドロキシル、若しくはニトロによって一置換、二置換、若しくは三置換されるかもしれない。）を表し；

mが、0、1、2、3、又は4であり；

但し、Aが酸素、硫黄、若しくはN- R_0 （式中、 R_0 が、水素、 C_1 - C_3 アルキル、 C_1 - C_3 ハロアルキル、 C_2 - C_4 アルキルカルボニル、 C_2 - C_4 ハロアルキルカルボニル、 C_2 - C_4 アルコキシカルボニル、若しくは C_1 - C_3 アルキルスルホニルである。）である場合に、 E_1 若しくは E_2 が、硫黄であることを条件とする。] によって表される化合物、並びにその化合物の農学的に許容される塩／異性体／ジアステレオマー／鏡像異性体／互変異性体／N-オキシドに関する。

【0004】

少なくとも1つの塩基性中心を持つ式（I）によって表される化合物、例えば、鉱酸などの強い無機酸、例えば、過塩素酸、硫酸、硝酸、含硝硫酸（nitroic acid）、リン酸、若しくはハロゲン化水素酸、を用いた、非置換、又は、例えば、ハロゲン、によって、置換された C_1 - C_4 アルカンカルボン酸などの強い有機カルボン酸、例えば、酢酸、飽和若しく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、若しくはフタル酸、など、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、若しくはクエン酸、など、又は安息香酸などを用いた、あるいは、非置換であるか、又は、例えば、ハロゲンによって置換された C_1 - C_4 アルカン-若しくはアリールスルホン酸などの有機硫酸、例えば、メタン-若しくはp-トルエンスルホン、を用いた、例えば、酸付加塩が、形成されうる。少なくとも1つの酸性基を持っている化合物（I）、例えば、塩基を有する塩、例えば、アルカリ金属、アルカリ土類金属塩、例えば、ナトリウム、カリウム、若しくはマグネシウム塩、などの無機塩、又はモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-、若しくはトリ低級アルキルアミン、例えば、エチル-、ジエチル-、トリエチル-、若しくはジメチルプロピルアミン、又はモノ-、ジ-、若しくはトリヒドロキシ低級アルキルアミン、例えば、モノ-、ジ-、若しくはトリエタノールアミン、などのアンモニア若しくは有機アミンを有する塩が、形成され得る。適切である場合には、対応する内部塩がさらに形成され得る。本発明の範囲内で好まれるのは農薬に有利な塩であるが；しかしながら、本発明は、また、農薬用途に不都合がある塩、例えば、ハチ又は魚に対して毒性である塩も網羅し、そして、例えば、式（I）によって表される遊離化合物、又は農薬に利用可能なその塩の単離又は精製のために利用される。遊離型と、その塩の形態にある式（I）によって表される化合物の間の緊密な関係のため、本発明の目的のために、遊離の式（I）によって表される化合物、又は本明細書中で前述の及び後述のその塩は、適切である場合には、それぞれ、対応する塩、又は遊離の式（I）によって表される化合物を含んでいると理解されるべきである。同じことが、式（I）によって表される化合物の互変異性体と、その塩に同じように適用される。一般に、遊離型がいずれの場合にも好まれる。

【0005】

置換基の定義で生じるアルキル基は、直鎖若しくは分岐であり得、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、sec-ブチル、イソブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、及びオクチル、並びにそれらの分岐異性体である。アルコキシ、アルケニル、及びアルキニル・ラジカルは、言及されたアルキル・ラジカルに由

10

20

30

40

50

来する。アルケニル及びアルキニル基は、一価不飽和、又は多価不飽和であり得る。

【0006】

ハロゲンは、通常、フッ素、塩素、臭素、又はヨウ素である。これは、また、ハロアルキル又はハロフェニルなどの他の意味と組み合わせてハロゲンに対して準用される。

【0007】

ハロアルキル基は、好ましくは、1~6個の炭素原子から成る鎖長をもつ。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、及び2,2,2-トリクロロエチルであり；好ましくは、トリクロロメチル、ジフルオロクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、及びジクロロフルオロメチルである。

10

【0008】

好適なハロアルケニル基は、ハロゲン、つまり、フッ素、塩素、臭素、及びヨウ素であるハロゲン、特に、フッ素及び塩素によって一置換又は多置換されたアルケニル基、例えば、2,2-ジフルオロ-1-メチルビニル、3-フルオロプロペニル、3-クロロプロペニル、3-ブロモプロペニル、2,3,3-トリフルオロプロピル、2,3,3-トリクロロプロペニル、及び4,4,4-トリフルオロブタ-2-エン-1-イルである。ハロゲンによって一置換、二置換、又は三置換されたアルケニル基の中でも、3~5個の炭素原子から成る鎖長をもつものが選好される。

20

【0009】

好適なハロアルキニル基は、例えば、ハロゲン、つまり、臭素及びヨウ素、そして、特にフッ素及び塩素であるハロゲンによって一置換又は多置換されたアルキニル基、例えば、3-フルオロプロピニル、3-クロロプロピニル、3-ブロモプロピニル、3,3,3-トリフルオロプロピニル、及び4,4,4-トリフルオロブタ-2-イン-1-イル、である。ハロゲンによって一置換又は多置換されたアルキニル基の中でも、3~5個の炭素原子から成る鎖長をもつものが選好される。

【0010】

アルコキシ基は、好ましくは、1~6個の炭素原子の好ましい鎖長をもつ。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、及びtert-ブトキシであり、そして、また、異性体のペンチルオキシ及びヘキシルオキシ・ラジカルでもある；好ましくは、メトキシ及びエトキシである。

30

【0011】

アルコキシカルボニルは、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニル、又はtert-ブトキシカルボニルである；好ましくは、メトキシカルボニル又はエトキシカルボニルである。ハロアルコキシ基は、好ましくは、1~6個の炭素原子から成る鎖長がある。ハロアルコキシは、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、及び2,2,2-トリクロロエトキシである；好ましくは、ジフルオロメトキシ、2-クロロエトキシ、及びトリフルオロメトキシである。アルキルチオ基は、好ましくは、1~6個の炭素原子から成る鎖長がある。アルキルチオは、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、n-ブチルチオ、イソブチルチオ、sec-ブチルチオ、又はtert-ブチルチオであり、好ましくは、メチルチオ及びエチルチオである。アルキルスルフィニルは、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、sec-ブチルスルフィニル、tert-ブチルスルフィニルである；好ましくは、メチルスルフィニル及びエチルスルフィニルである。

40

【0012】

50

アルキルスルホニルは、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、sec-ブチルスルホニル、又はtert-ブチルスルホニルである；好ましくは、メチルスルホニル又はエチルスルホニルである。アルコキシアルコキシ基は、好ましくは、1~8個の炭素原子から成る鎖長がある。アルコキシアルコキシ基の例は：メトキシメトキシ、メトキシエトキシ、メトキシプロポキシ、エトキシメトキシ、エトキシエトキシ、プロポキシメトキシ、又はブトキシブトキシである。アルキルアミノは、例えば、メチルアミノ、エチルアミノ、n-プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、又は異性体のブチルアミンである。ジアルキルアミノは、例えば、ジメチルアミノ、メチルエチルアミノ、ジエチルアミノ、n-プロピルメチルアミノ、ジブチルアミノ、及びジイソプロピルアミノである。1~4個の炭素原子から成る鎖長をもつアルキルアミノ基が選好される。アルコキシアルキル基は、好ましくは、1~6個の炭素原子から成る鎖長がある。アルコキシアルキルは、例えば、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル、エトキシエチル、n-プロポキシメチル、n-プロポキシエチル、イソプロポキシメチル、又はイソプロポキシエチルである。アルキルチオアルキル基は、好ましくは、1~8個の炭素原子をもつ。アルキルチオアルキルは例えば、メチルチオメチル、メチルチオエチル、エチルチオメチル、エチルチオエチル、n-プロピルチオメチル、n-プロピルチオエチル、イソプロピルチオメチル、イソプロピルチオエチル、ブチルチオメチル、ブチルチオエチル、又はブチルチオブチルである。シクロアルキル基は、好ましくは、3~6個の環式炭素原子をもち、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、及びシクロヘキシルである。

10

20

【0013】

フェノキシ、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンゾイル、フェニルチオ、フェニルアルキル、フェノキシアルキルなどの置換基の一部としてフェニルは、また、置換されるかもしれない。この場合、置換基は、オルト、メタ、及び／又はパラ位に存在し得る。好ましい置換基位置は、環の取り付けの位置に対してオルト及びパラ位である。

【0014】

E₁、及び／又はE₂は、好ましくは、酸素である。

【0015】

式 (I) :

{式中、

- a) R₂が、水素又はC₁-C₄アルキルであり；及び／又は
 - b) R₃が、水素又はC₁-C₄アルキルであり；及び／又は
 - c) Dが、基D₁であり；及び／又は
 - d) E₂が、硫黄である。}
- によって表される化合物のサブグループが選好される。

30

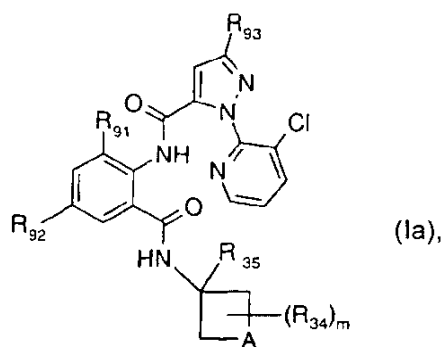
【0016】

さらに、式 (I) {式中、AがN-ベンジル、SO、又はSO₂であり、特に、SO又はSO₂である。} によって表される化合物が好まれる。

【0017】

式 (I) によって表される化合物の好ましいサブグループは、以下の式 (Ia) :

【化 4】



10

{ 式中、

R_{91} が、 C_1 - C_4 アルキル又はハロゲンであり、好ましくは、クロロ、ブロモ、又はメチルであり；

R_{92} が、ハロゲン又はシアノであり、好ましくは、フルオロ、クロロ、ブロモ、又はシアノであり；

R_{93} が、ハロゲン、 C_1 - C_4 ハロアルキル、又は C_1 - C_4 ハロアルコキシであり；そして、

A、 R_{34} と R_{35} 、及び m が、式 (I) の下で定められた意味をもつ。} によって表される化合物によって代表される。

20

【0018】

式 (I) 又は式 (Ia) によって表される化合物の好ましいサブグループでは、Aが、 SO 、 SO_2 、 $S(O)_p=N-R$ 、 $C=N-OR_{36}$ 、 $C=O$ 、 $P(X)_t-R_{33}$ 、又は $N-R_0$ である；式中、

p 、 t 、 X 、 R_{33} 、及び R_{36} が、式 (I) の下で定められた意味をもち、そして、

R_0 が、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又は R_0 が、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシによって置換された C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又は R_0 が、シアノ、ニトロ、 $-CONR_{028}R_{029}$ 若しくは $-P(O)(OR_{031})(OR_{032})$ {式中、 R_{028} 、 R_{029} 、 R_{031} 、及び R_{032} が、式 (I) の下で定められた意味をもつ。} であるか；又は、 R_0 が、フェニル若しくはベンジル、又は C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_1 - C_6 ハロアルキル、ハロゲン、シアノ、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 ハロアルキルスルフィニル、及び C_1 - C_4 ハロアルキルスルホニルから選択される置換基によって一置換、二置換、若しくは三置換されたフェニル若しくはベンジルである。

30

40

【0019】

式 (I) 又は式 (Ia) によって表される化合物のさらに好ましいサブグループでは、Aが、 SO 、 SO_2 、 $S(O)_p=N-R$ 、 $C=N-OR_{36}$ 、 $C=O$ 、 $P(X)_t-R_{33}$ 、又は $N-R_0$ である；式中、

p 、 t 、 X 、 R_{33} 、及び R_{36} が、式 (I) の下で定められた意味をもち、そして、

R_0 が、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであるか；又は、 R_0 が、 C_3 - C_6 シクロアルキル、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルコキシ、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシによって置換された C_1 - C_6 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、 C_3 - C_6 ハロシクロアルキル、 C_1 - C_6 アルキルチオ、 C_1 - C_6 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_6 アルコキシ- C_1 - C_6 アルキル、若しくは C_1 - C_6 ハロアルコキシ

50

-C₁-C₆アルキルであるか；又は、R₀が、シアノ、ニトロ、-CONR₀₂₈R₀₂₉若しくはP(O) (OR₀₃₁) (OR₀₃₂) {式中、R₀₂₈、R₀₂₉、R₀₃₁、及びR₀₃₂が、式(I)の下で定められた意味をもつ。}である。

【0020】

式(I)：

{式中、

e) R₃₄が、水素又はC₁-C₄アルキルであり、好ましくは、水素又はメチルであり；及び／又は

f) R₃₅が、水素又はC₁-C₄アルキルであり、好ましくは、水素又はメチルであり；及び／又は

g) Aが、酸素、硫黄、SO、SO₂、S=NR、又はS(O)_p=NRであり、好ましくは、S、SO、SO₂、又はS(O)_p=NR(式中、pが、1である。)であり；最も好ましくは、酸素又は硫黄であり；及び／又は

h) Rが、水素、シアノ、ニトロ、-C(O)R₂₆、-C(O)OR₂₇、-CONR₂₈R₂₉、-SO₂R₃₀、又は-P(O)(OR₃₁)(OR₃₂)であり、好ましくは、水素、シアノ、-COOMe、-SO₂Me、若しくは-C(O)CF₃であり；及び／又は

i) R₀が、水素、シアノ、ニトロ、-C(O)R₀₂₆、-C(O)OR₀₂₇、-CONR₀₂₈R₀₂₉、-SO₂R₀₃₀、若しくは-P(O)(OR₀₃₁)(OR₀₃₂)であり、好ましくは、水素、シアノ、-COOMe、-SO₂Me、若しくは-C(O)CF₃であり；及び／又は

j) R₄'が、水素と異なる。}によって表される化合物を、特別に重要視すべきでもある。

【0021】

「Me」はメチル基を表す。

【0022】

式(I)によって表される好ましい化合物では、R₂₆が、水素、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、又はC₃-C₆シクロアルキルである。式(I)によって表される好ましい化合物では、互いに独立に、R₂₇、R₂₈、R₂₉、R₃₀、R₃₁、及びR₃₂が、C₁-C₆アルキル若しくはC₁-C₆ハロアルキルであるか；又は、C₁-C₆アルキル若しくはC₁-C₆ハロアルキルで置換されたC₁-C₆アルキル若しくはC₁-C₆ハロアルキルである。

【0023】

式(I)によって表される好ましい化合物では、R₀₂₆が、水素、C₁-C₆アルキル、C₁-C₆ハロアルキル、又はC₃-C₆シクロアルキルである。式(I)によって表される好ましい化合物では、互いに独立に、R₀₂₇、R₀₂₈、R₀₂₉、R₀₃₁、及びR₀₃₂が、C₁-C₆アルキル若しくはC₁-C₆ハロアルキルであるか；又は、C₁-C₆アルキル若しくはC₁-C₆ハロアルキルで置換されたC₁-C₆アルキル若しくはC₁-C₆ハロアルキルである。

【0024】

式(I)によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又その塩の調製に関する本発明による過程は、公知の過程、例えば、WO 01/70671、WO 03/016284、WO 03/015518、及びWO 04/033468に記載のもの、と同じように行われる。

【0025】

遊離型の若しくは塩の形態のいずれの場合にも、式(I)によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体の調製過程には、例えば、以下のステップが含まれる：

a) 式(I) {式中、R₂が水素であり、そして、E₁及びE₂が酸素である。}によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩を調製するために、以下の式(II)：

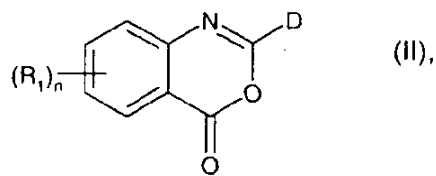
10

20

30

40

【化 5】

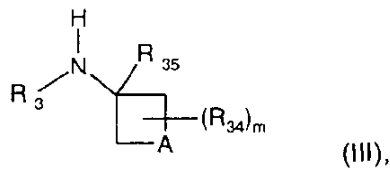


{式中、

10

R_1 、 n 、及び D が、式 (I) によって表される化合物について定められた意味をもつ。
} によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩を、以下の式 (III) :

【化 6】



20

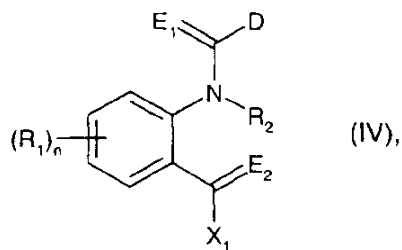
{式中、

A 、 R_3 、 R_{34} 、 R_{35} 、及び m が、式 (I) について定められた意味をもつ。} によって表される化合物と、又は、適当であれば互変異性体、及び／又はその塩と反応させることによるか、あるいは

b) 式 (I) によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩を調製するために、以下の式 (IV) :

【化 7】

30

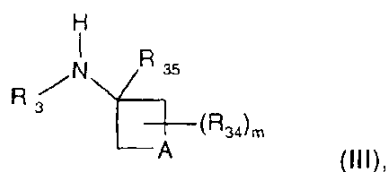


{式中、

40

R_1 、 R_2 、 n 、 E_1 、 E_2 、及び D が、式 (I) について定められた意味をもち；そして、 X_1 が脱離基である。} によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩を、以下の式 (III) :

【化 8】

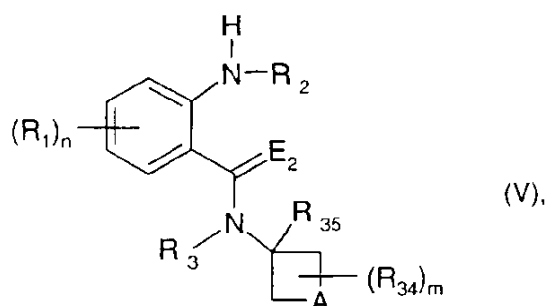


{式中、

A、R₃、R₃₄、R₃₅、及びmが、式 (I) によって表される化合物について定められた意味をもつ。} によって表される化合物と、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩と反応させるか、あるいは

c) 式 (I) によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩を調製するために、以下の式 (V) :

【化 9】



{式中、

n、R₁、R₂、R₃、E₂、R₃₄、R₃₅、A、及びmが、式 (I) について定められた意味をもつ。} によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩を、以下の式 (VI) :

【化 10】



{式中、

E₁及びDが、式 (I) によって表される化合物について定められた意味をもち；そして、X₂が脱離基である。} によって表される化合物と、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩と反応させ、及び／又は

遊離型の若しくは塩の形態のいずれの場合にも、式 (I) によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体を、式 (I) によって表される別の化合物、又は、適当であれば、その互変異性体に変換し、

上記過程により得えられる異性体混合物を分離し、そして、所望の異性体を単離し、及び／又は、

式 (I) によって表される遊離の化合物、若しくは、適当であれば、その互変異性体を、塩に変換するか、又は

式 (I) によって表される化合物の塩、若しくは、適当であれば、その互変異性体を、式 (I) によって表される遊離の化合物、若しくは、適当であれば、その互変異性体、又は別の塩に変換する。

【0026】

式 (II) によって表される化合物は、WO 04/111030に記載されている。式 (III) 及び (V) によって表される化合物は、新規であり、式 (I) によって表される化合物の調製のために特別に開発されたので、本発明のさらなる態様を構成する。先に触れた式 (I) の置換基に好ましいものは、また、式 (III) 及び (V) によって表される化合物にも有効である。

【0027】

式 (III) によって表される特に好ましい化合物では、

R_3 が、水素であり；

R_{34} が、水素又は C_1 - C_4 アルキルであり、好ましくは、水素又はメチルであり；

R_{35} が、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシカルボニル、 C_1 - C_4 アルコキシ- C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ- C_1 - C_4 アルキルであり；

A が、酸素、硫黄、SO、 SO_2 、 $S=NR$ 、又は $S(O)_p=NR$ であり、好ましくは、S、SO、 SO_2 、又は $S(O)_p=NR$ {式中、p が1であり、且つ、式中、R が、水素、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R_{26}$ 、 $-C(O)OR_{27}$ 、 $-CONR_{28}R_{29}$ 、 $-SO_2R_{30}$ 、若しくは $-P(O)(OR_{31})(OR_{32})$ であり、好ましくは、水素、シアノ、 $-COOMe$ 、 $-SO_2Me$ 、若しくは $-C(O)CF_3$ である。} であり；

m が、0、1、2、3、又は4である。

【0028】

式 (V) によって表される特に好ましい化合物では、

R_1 が、 C_1 - C_4 アルキル、ハロゲン、 C_1 - C_5 ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 C_1 - C_4 アルコキシ、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ、 C_1 - C_4 アルキルチオ、 C_1 - C_4 アルキルスルフィニル、 C_1 - C_4 アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 ハロアルキルチオ、 C_1 - C_4 ハロアルキルスルフィニル、又は C_1 - C_4 ハロアルキルスルホニルであり；

R_2 及び R_3 が、水素であり；

E_2 が、酸素又は硫黄であり；

R_{34} が、水素又は C_1 - C_4 アルキルであり、好ましくは、水素又はメチルであり；

R_{35} が、水素、ハロゲン、シアノ、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルキル、 C_1 - C_4 アルコキシカルボニル、 C_1 - C_4 アルコキシ- C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 ハロアルコキシ- C_1 - C_6 アルキルであり；

A が、酸素、硫黄、SO、 SO_2 、 $S=NR$ 、又は $S(O)_p=NR$ であり、好ましくは、S、SO、 SO_2 、又は $S(O)_p=NR$ {式中、p が1であり、且つ、式中、R が、水素、シアノ、ニトロ、 $-C(O)R_{26}$ 、 $-C(O)OR_{27}$ 、 $-CONR_{28}R_{29}$ 、 $-SO_2R_{30}$ 、若しくは $-P(O)(OR_{31})(OR_{32})$ であり、好ましくは、水素、シアノ、 $-COOMe$ 、 $-SO_2Me$ 、若しくは $-C(O)CF_3$ である。} であり；

m が、1、2、3、又は4であり；

n が、1、2、又は3である。

【0029】

表C：式 (III) によって表される好ましい化合物は、以下の式 (IIIa) によって表された：

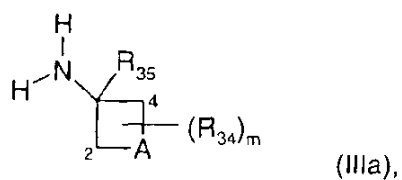
10

20

30

40

【化 1 1】



【0 0 3 0】

【表 1】

化合物番号	A	R ₃₄	R ₃₅
C1	O	H	H
C2	O	H	CH ₃
C3	O	H	CH ₂ OCH ₃
C4	O	H	CF ₃
C5	O	2,2-ジ Me	H
C6	O	2,2-ジ Me	CH ₃
C7	O	2,2,4,4- テトラ Me	H
C8	O	2,2,4,4- テトラ Me	CH ₃
C9	S	H	H
C10	S	H	CH ₃
C11	S	H	CH ₂ OCH ₃
C12	S	H	CF ₃
C13	S	2,2-ジ Me	H
C14	S	2,2-ジ Me	CH ₃
C15	S	2,2,4,4- テトラ Me	H
C16	S	2,2,4,4- テトラ Me	CH ₃
C17	SO	H	H
C18	SO	H	CH ₃

【 0 0 3 1 】

【表 2】

化合物番号	A	R ₃₄	R ₃₅
C19	SO	H	CH ₂ OCH ₃
C20	SO	H	CF ₃
C21	SO	2,2-ジ Me	H
C22	SO	2,2-ジ Me	CH ₃
C23	SO	2,2,4,4-テトラ Me	H
C24	SO	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
C25	SO ₂	H	H
C26	SO ₂	H	CH ₃
C27	SO ₂	H	CH ₂ OCH ₃
C28	SO ₂	H	CF ₃
C29	SO ₂	2,2-ジ Me	H
C30	SO ₂	2,2-ジ Me	CH ₃
C31	SO ₂	2,2,4,4-テトラ Me	H
C32	SO ₂	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
C33	S(O)NH	H	H
C34	S(O)NH	H	CH ₃
C35	S(O)NH	H	CH ₂ OCH ₃
C36	S(O)NH	H	CF ₃
C37	S(O)NH	2,2-ジ Me	H
C38	S(O)NH	2,2-ジ Me	CH ₃
C39	S(O)NH	2,2,4,4-テトラ Me	H

【 0 0 3 2 】

10

20

30

40

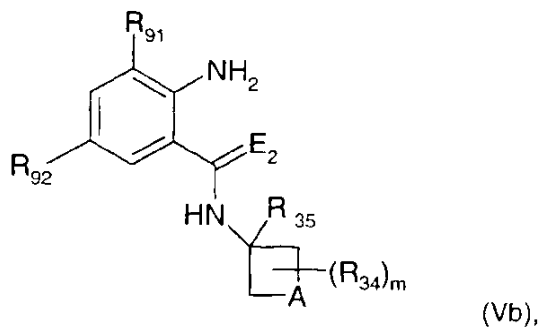
【表 3】

化合物番号	A	R ₃₄	R ₃₅
C40	S(O)NH	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
C41	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H
C42	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	CH ₃
C43	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	CH ₂ OCH ₃
C44	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	CF ₃
C45	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	2,2-ジ Me	H
C46	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	2,2-ジ Me	CH ₃
C47	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	2,2,4,4-テトラ Me	H
C48	N-CH ₂ -C ₆ H ₅	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃

【0033】

表D：式（V）によって表される好ましい化合物は、式（Vb） {ここで、E₂が酸素である。} によって表された。

【化12】



【0034】

【表 4】

化合物番号	R ₉₁	R ₉₂	A	R ₃₄	R ₃₅
D1	Me	Cl	O	H	H
D2	Me	Cl	O	H	CH ₃
D3	Me	Cl	O	2,2-ジ Me	H

【 0 0 3 5 】

【表 5】

化合物番号	R ₉₁	R ₉₂	A	R ₃₄	R ₃₅
D4	Me	Cl	O	2,2,4,4-テトラ Me	H
D5	Me	Br	O	H	H
D6	Me	Br	O	H	CH ₃
D7	Me	NO ₂	O	H	H
D8	Me	NO ₂	O	H	CH ₃
D9	Me	CN	O	H	H
D10	Me	CN	O	H	CH ₃
D11	Me	CN	O	2,2-ジ Me	H
D12	Me	CN	O	2,2,4,4-テトラ Me	H
D13	Me	Cl	S	H	H
D14	Me	Cl	S	H	CH ₃
D15	Me	Cl	S	H	CH ₂ OCH ₃
D16	Me	Cl	S	H	CF ₃
D17	Me	Cl	S	2,2-ジ Me	H
D18	Me	Cl	S	2,2-ジ Me	CH ₃
D19	Me	Cl	S	2,2,4,4-テトラ Me	H
D20	Me	Cl	S	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D21	Me	Br	S	H	H
D22	Me	Br	S	H	CH ₃
D23	Me	NO ₂	S	H	H
D24	Me	NO ₂	S	H	CH ₃

【 0 0 3 6 】

【表 6】

化合物番号	R ₉₁	R ₉₂	A	R ₃₄	R ₃₅
D25	Me	CN	S	H	H
D26	Me	CN	S	H	CH ₃
D27	Me	CN	S	H	CH ₂ OCH ₃
D28	Me	CN	S	H	CF ₃
D29	Me	CN	S	2,2-ジ Me	H
D30	Me	CN	S	2,2-ジ Me	CH ₃
D31	Me	CN	S	2,2,4,4-テトラ Me	H
D32	Me	CN	S	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D33	Me	Cl	SO	H	H
D34	Me	Cl	SO	H	CH ₃
D35	Me	Cl	SO	H	CH ₂ OCH ₃
D36	Me	Cl	SO	H	CF ₃
D37	Me	Cl	SO	2,2-ジ Me	H
D38	Me	Cl	SO	2,2-ジ Me	CH ₃
D39	Me	Cl	SO	2,2,4,4-テトラ Me	H
D40	Me	Cl	SO	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D41	Me	Br	SO	H	H
D42	Me	Br	SO	H	CH ₃
D43	Me	NO ₂	SO	H	H
D44	Me	NO ₂	SO	H	CH ₃
D45	Me	CN	SO	H	H

【 0 0 3 7 】

【表 7】

化合物番号	R ₉₁	R ₉₂	A	R ₃₄	R ₃₅
D46	Me	CN	SO	H	CH ₃
D47	Me	CN	SO	H	CH ₂ OCH ₃
D48	Me	CN	SO	H	CF ₃
D49	Me	CN	SO	2,2-ジ Me	H
D50	Me	CN	SO	2,2-ジ Me	CH ₃
D51	Me	CN	SO	2,2,4,4-テトラ Me	H
D52	Me	CN	SO	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D53	Me	Cl	SO ₂	H	H
D54	Me	Cl	SO ₂	H	CH ₃
D55	Me	Cl	SO ₂	H	CH ₂ OCH ₃
D56	Me	Cl	SO ₂	H	CF ₃
D57	Me	Cl	SO ₂	2,2-ジ Me	H
D58	Me	Cl	SO ₂	2,2-ジ Me	CH ₃
D59	Me	Cl	SO ₂	2,2,4,4-テトラ Me	H
D60	Me	Cl	SO ₂	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D61	Me	Br	SO ₂	H	H
D62	Me	Br	SO ₂	H	CH ₃
D63	Me	NO ₂	SO ₂	H	H
D64	Me	NO ₂	SO ₂	H	CH ₃
D65	Me	CN	SO ₂	H	H
D66	Me	CN	SO ₂	H	CH ₃

【 0 0 3 8 】

【表 8】

化合物番号	R ₉₁	R ₉₂	A	R ₃₄	R ₃₅
D67	Me	CN	SO ₂	H	CH ₂ OCH ₃
D68	Me	CN	SO ₂	H	CF ₃
D69	Me	CN	SO ₂	2,2-ジ Me	H
D70	Me	CN	SO ₂	2,2-ジ Me	CH ₃
D71	Me	CN	SO ₂	2,2,4,4-テトラ Me	H
D72	Me	CN	SO ₂	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D73	Me	Cl	S(O)NH	H	H
D74	Me	Cl	S(O)NH	H	CH ₃
D75	Me	Cl	S(O)NH	H	CH ₂ OCH ₃
D76	Me	Cl	S(O)NH	H	CF ₃
D77	Me	Cl	S(O)NH	2,2-ジ Me	H
D78	Me	Cl	S(O)NH	2,2-ジ Me	CH ₃
D79	Me	Cl	S(O)NH	2,2,4,4-テトラ Me	H
D80	Me	Cl	S(O)NH	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃
D81	Me	Br	S(O)NH	H	H
D82	Me	Br	S(O)NH	H	CH ₃
D83	Me	NO ₂	S(O)NH	H	H
D84	Me	NO ₂	S(O)NH	H	CH ₃
D85	Me	CN	S(O)NH	H	H
D86	Me	CN	S(O)NH	H	CH ₃
D87	Me	CN	S(O)NH	H	CH ₂ OCH ₃

【 0 0 3 9 】

【表 9】

化合物番号	R ₉₁	R ₉₂	A	R ₃₄	R ₃₅
D88	Me	CN	S(O)NH	H	CF ₃
D89	Me	CN	S(O)NH	2,2-ジ Me	H
D90	Me	CN	S(O)NH	2,2-ジ Me	CH ₃
D91	Me	CN	S(O)NH	2,2,4,4-テトラ Me	H
D92	Me	CN	S(O)NH	2,2,4,4-テトラ Me	CH ₃

10

【0040】

表G：式（V）によって表される好ましい化合物は、化合物G1～G92（式中、R₉₁、R₉₂、A、R₃₄、及びR₃₅が、表Dの系列D₁～D₉₂について定められた意味をもつ。）を挙げた式（Vb） {ここで、E₂が硫黄である。} によって表された。

【0041】

表C、D、及びGによる式（IIIa）及び（Vb）によって表される化合物の物理データ：

【0042】

20

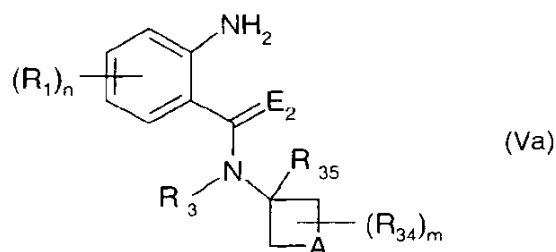
【表 10】

化合物番号	融点	¹ H-NMR
C10	液体	CDCl ₃ : 3.25 (d, 2H), 3.04 (d, 2H), 1.78 (s, 2H), 1.53 (s, 3H).
C42	オイル	CDCl ₃ : 7.2 (m, 5H), 3.62 (s, 2H), 3.27 (d, 2H), 2.88 (d, 2H), 1.68 (bs, 2H), 1.4 (s, 3H).
C9, 臭化水素酸塩として	186-190 °C	d ₆ -DMSO: 8.23 (br s, 3H), 4.52 (m, 1H), 3.47 (m, 2H), 3.18 (m, 2H).
C26, トリフルオロ酢酸塩として	208-210 °C	d ₆ -DMSO: 8.82 (br s, 3H), 4.56 (d, 2H), 4.29 (d, 2H), 1.68 (s, 3H).
C13	オイル	CDCl ₃ : 3.83 (dd, 1H), 3.19 (t, 1H), 2.95 (t, 1H), 1.63 (br s, 2H), 1.50 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
D54	79-82 °C	CDCl ₃ : 7.20 (s, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 5.58 (br s, 2H), 4.64 (d, 2H), 4.15 (d, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.87 (s, 3H).
D14	92-94 °C	CDCl ₃ : 7.14 (s, 1H), 7.10 (s, 1H),
化合物番号	融点	¹ H-NMR
		6.09 (s, 1H), 5.57 (br s, 2H), 3.90 (d, 2H), 3.03 (d, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.83 (s, 3H).

【0043】

以下の式 (Va) :

【化 13】

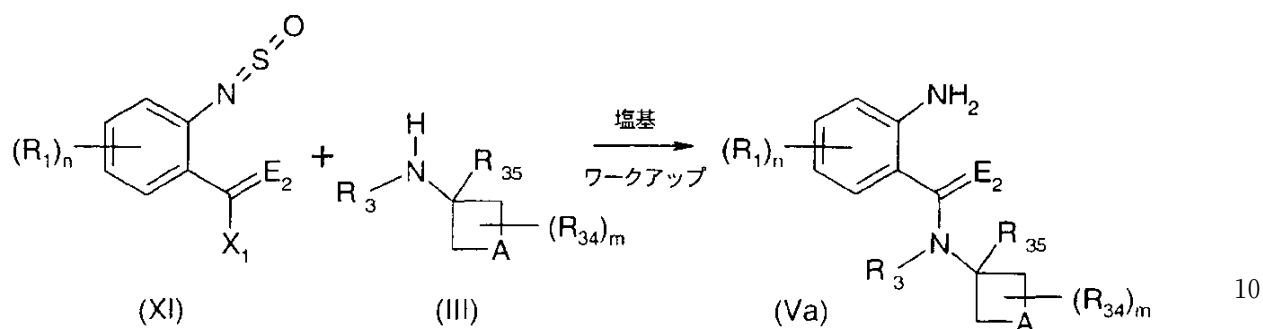


によって表される化合物、つまり、式 (V) {ここで、R₂が水素である。} によって表される化合物のサブグループは、例えば、WO 2001/070671に記載の方法と同じように調製され得る。

【0044】

式 (Va) によって表される化合物は、また、塩基及び不活性溶媒の存在下、式 (XI) によって表される化合物を、式 (III) の化合物と反応させることによって調製される。

【化 1 4】



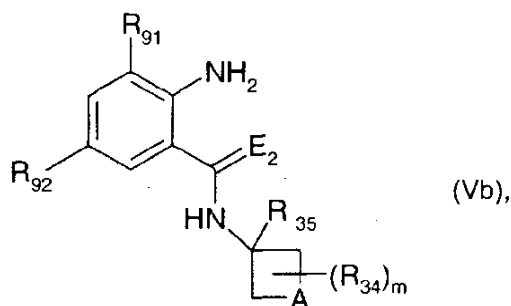
{式中、 n 、 R_1 、 R_3 、 E_2 、 R_{34} 、 R_{35} 、 A 、及び m が、式 (I) について定められた意味をもち；そして、 X_1 が、脱離基（例えば、塩素、臭素）である。}、若しくは、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩である。

【0045】

好適な塩基は、例えば、 $N(C_2H_5)_3$ 、DBU、DBN、又はイミダゾールである。好ましい溶媒は、テトラヒドロフラン、ジオキサン、グリム、酢酸エチル、又はトルエンである。反応は、 $0^\circ\text{C} \sim 100^\circ\text{C}$ の温度にて、好ましくは、 $+15^\circ\text{C} \sim +30^\circ\text{C}$ にて、具体的には外気温にて行われる。式 (V) によって表される化合物のさらなる調製過程は、PCT/EP2006/003504に記載されている。

以下の式 (Vb)：

【化 1 5】



{式中、

R_{91} が、 C_1 - C_4 アルキル又はハロゲンであり、好ましくは、クロロ、ブロモ、又はメチルであり；

R_{92} が、ハロゲン又はシアノであり、好ましくは、フルオロ、クロロ、ブロモ、又はシアノであり；

E 、 A 、 R_{34} 、 R_{35} 、及び m が、式 (I) の下で定められた意味をもつ。} によって表される化合物に代表される式 (V) によって表される化合物のサブグループが、特別に重要視されるべきでもある。

【0046】

式 (V) / (Va) / (Vb) {ここで、 E_2 が酸素である。} によって表されるアミドは、例えば、X. Fontrodona et al., Synthesis, 2001, (13), 2021-27と同じように、五硫化リンやローソン試薬などの市販のチオ転移試薬を使用することによって、式 (V) / (Va) / (Vb) {ここで、 E_2 が硫黄である。} によって表されるチオアミドに容易に変換される。

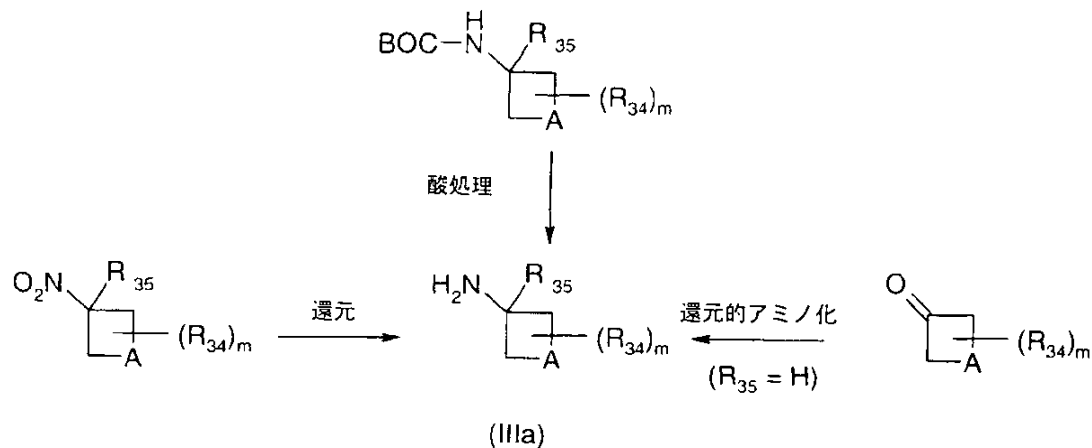
【0047】

式 (XI) によって表される化合物、特に、式 (XI) {ここで、X1が塩素である。} によって表されるそれらの化合物は、例えば、J. Garin et al., Tetrahedron Letters, 1991, 32, 3263-64と同じように調製され得る。

【0048】

式 (III) によって表される化合物は、文献で知られているか、又は公知の方法によるのと同様に調製され得る。

【化16】

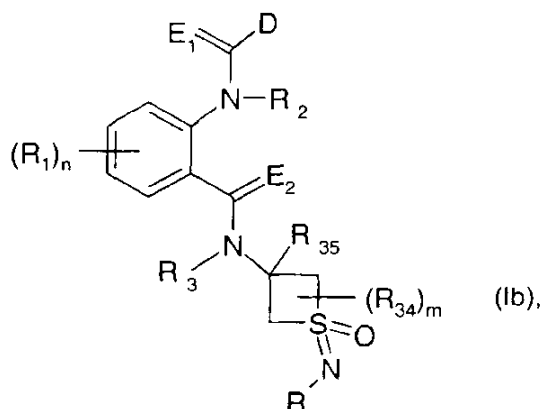


【0049】

式 (IIIa) によって表される化合物、つまり、式 (III) {ここで、R₃が水素である。} によって表される化合物のサブグループは、例えば、還元によるか、又は還元のアミノ化によるか、又は酸性処理によるか、又はさらに公知の方法によるのと同様に、先に記載されているように調製され得る。

以下の式 (Ib) :

【化17】



{式中、

n、R₁、R₂、R₃、D、E₁、E₂、R₃₄、R₃₅、m、及びRが、式 (I) について定められた意味をもつ。} によって表された化合物に代表される式 (I) によって表される化合物のサブグループは、例えば、異型a)、b)、又はc)における式 (I) {式中、異型a)、b)、若しくはc)における式 (I)、(III)、及び(V)の基Aが、基S(O)_p=NRによって置き換えられ、式中、pが1である。} によって表される化合物について記載したのと類似した状

10

20

30

40

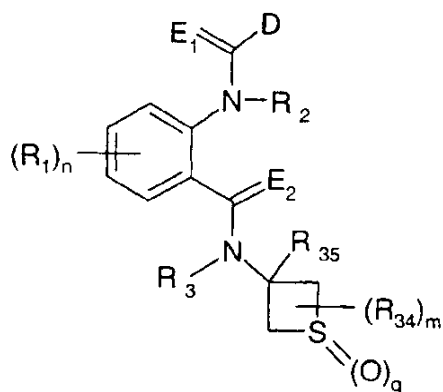
50

況下で調製される。

【0050】

あるいは、遊離型の若しくは塩の形態のいずれの場合にも、式 (Ib) によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体、及び／又はその塩は、公知の手順 (H. Okamura, C. Bolm, Org. Lett. 2004, 6, 1305; H. Okamura, C. Bolm, Chem. Lett. 2004, 33, 482; D. Leca, K. Song, M. Amatore, L. Fensterbank, E. Lacote, M. Malacria, Chem. Eur. J. 2004, 10, 906) に従って、又は以下に記載のとおり、例えば、以下の式：

【化18】



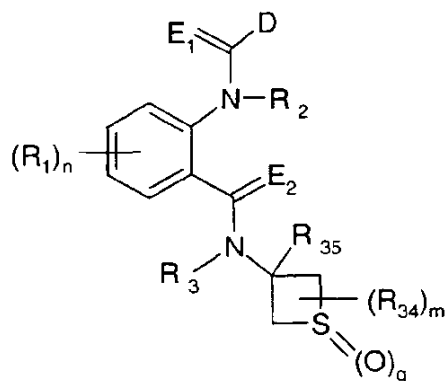
(VII),

{式中、 n 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 D 、 E_1 、 E_2 、 R_{34} 、 R_{35} 、及び m が、式 (I) について定められた意味をもち、そして、 q が、0又は1である。} によって表される化合物から、調製される。

【0051】

式 (I) によって表される化合物又は式 (III) {ここで、式 (I) 及び (III) の基Aが基S (O)_p=NR (式中、 p が1である。) によって置き換えられる。} によって表される化合物は、例えば、公知の手順に従って (スキーム1: $q=0$: ステップAとその後のB; $q=1$: ステップB、例えば、M. Reggelin, C. Zur, Synthesis, 2000, 1を参照のこと)、それぞれ、以下の式 (VII)：

【化19】



(VII),

{式中、 n 、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 D 、 E_1 、 E_2 、 R_{34} 、 R_{35} 、及び m が、式 (I) について定められた意味をもち、そして、 q が、0又は1である。} によって表される化合物から、又は以下の式 (VIII)：

10

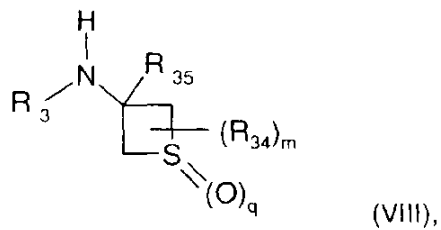
20

30

40

50

【化 2 0】

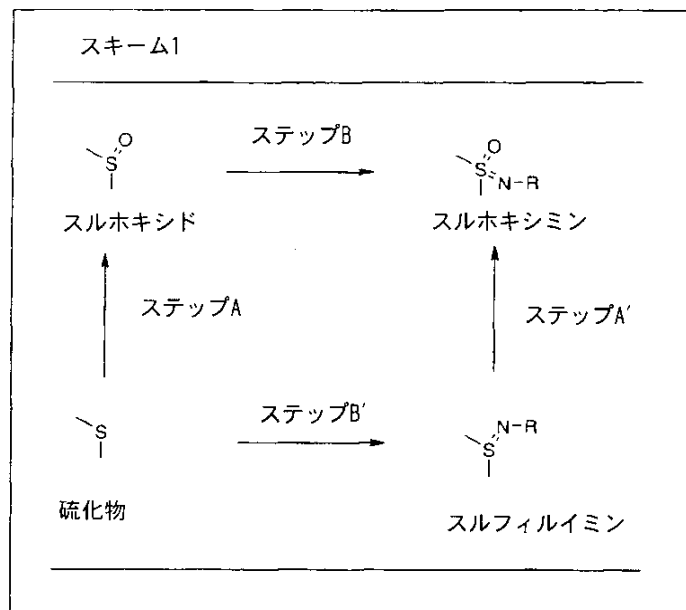


10

{式中、

R_3 、 R_{34} 、 R_{35} 、及び m が、式 (I) について定められた意味をもち、そして、 q が、0又は1である。} によって表される化合物から調製される。式 (III)、(V)、及び (VIII) によって表される化合物は、新規であり、式 (I) によって表される化合物の調製のために特別に開発されたので、本発明のさらなる対象を構成する。

【化 2 1】



20

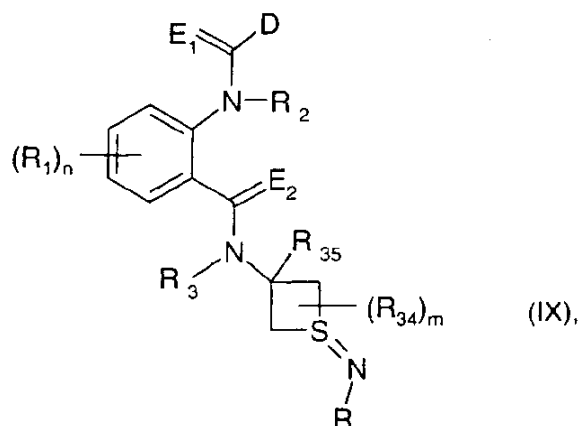
30

【0052】

あるいは、式 (I) によって表される化合物又は式 (III) によって表される化合物 {ここで、式 (I) 及び (III) の基Aが、基S (O)_p=NR (式中、 p が1である。) によって置き換えられる。} は、例えば、公知の方法 (スキーム1、ステップA') に従って、それぞれ、以下の式 (IX) :

40

【化 2 2】

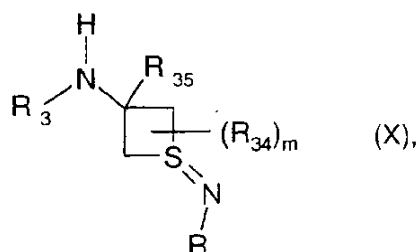


10

{式中、

n、 R_1 、 R_2 、 R_3 、D、 E_1 、 E_2 、 R_{34} 、 R_{35} 、m、及びRが、式 (I) について定められた意味をもつ。} によって表される化合物から、又は以下の式 (X) :

【化 2 3】



20

{式中、 R_3 、 R_{34} 、 R_{35} 、m、及びRが、式 (I) について定められた意味をもつ。} によって表される化合物から調製される、ここで、式 (IX) によって表される化合物又は式 (X) によって表される化合物は、スキーム1のステップB' に記載のとおり、公知の方法に従って、それぞれ、式 (VII) ($q=0$) によって表される化合物から、又は式 (VIII) ($q=0$) によって表される化合物から調製される。

30

【0053】

硫化物からスルホキシドへの変換、又はスルフィリイミンからスルフィリイミンへの変換 (スキーム1のステップA又はA') のための、古典的な酸化試薬は、 KMnO_4 、mCPBA、 $\text{NaIO}_4/\text{RuO}_2$ 、 H_2O_2 、オキシソンである。スルホキシドからスルフィリイミンへの変換、又は硫化物からスルフィリイミンへの変換 (スキーム1のステップB又はB') のための、代表的な試薬は、 $\text{NaN}_3/\text{H}_2\text{SO}_4$ 、0-メシチレンスルホニルヒドロキシルアミン (MSH)、又は $\text{RN}_3/\text{FeCl}_2$ 、 $\text{PhI}=\text{N}-\text{R}/\text{CuOTf}$ 、 $\text{PhI}=\text{N}-\text{R}/\text{Cu}(\text{OTf})_2$ 、 $\text{PhI}=\text{N}-\text{R}/\text{CuPF}_6$ 、 $\text{PhI}(\text{OAc})_2/\text{R}-\text{NH}_2/\text{MgO}/\text{Ru}_2(\text{OAc})_4$ 、若しくはオキサジリジン (例えば、3-(4-シアノ-フェニル)-オキサジリジン-2-カルボン酸tert-ブチル・エステル) などの金属触媒法である。

40

【0054】

式 (Ib) の化合物の合成 (スルフィリイミンの調製) に有用な詳細な調製条件は、WO 2006/061200に定められている。

【0055】

式 (I) によって表される化合物の互変異性体、及び／又は塩について先に言われていることを、その互変異性体、及び／又はその塩に関して本明細書中で先に触れた、及び後に触れる出発物質に同じように適用する。

50

【0056】

本明細書中で先に記載の及び後に記載する反応は、自体公知の様式で、例えば、好適な溶剤若しくは希釈剤、又はこれらの混合物の不存在下、又は、通常、存在下で実施され、その過程は、必要に応じて、冷却しながら、室温にて、又は、加熱しながら、例えば、約-80℃～反応混合物の沸点、好ましくは、約-20℃～約+150℃の温度範囲内で、必要であれば、密封容器内で、減圧、常圧、若しくは高圧下、不活性ガス雰囲気中、及び／又は無水条件下で実施される。特に有利な反応条件は、実施例から分かる。

【0057】

別段の指定がない限り、遊離型の若しくは塩の形態のいずれの場合にも、式(I)によって表される化合物の調製に使用される本明細書中で先に触れた及び後に触れる出発物質、又は、適当であれば、その互変異性体は、公知であり、そして、自体公知の方法によって、例えば、以下に示される情報に従って、調製される。その反応物を、塩基の存在下で反応させてもよい。HX₂の解離を容易にするための好適な塩基の例は、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属アセテート、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属カルボナート、アルカリ金属若しくはアルカリ土類金属ジアルキルアミド、又はアルカリ金属若しくはアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミン、アルキレンジアミン、遊離若しくはN-アルキル化飽和若しくは不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環式化合物、水酸化アンモニウム、及び炭素環式アミンである。言及されるかもしれない例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウム・アミド、ナトリウム・メトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、tert-ブトキシド・カリウム、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウム・ジイソプロピルアミド、カリウム・ビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、ベンジルトリメチルアンモニウム水酸化物、及び1,8-ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデカ-7-エン (DBU) である。

【0058】

前記反応物は、それ自体は互いに、すなわち、溶媒又は希釈剤を加えることなしに、反応する。多くの場合には、しかしながら、不活性な溶媒若しくは希釈剤、又はそれらの混合物を加えることが、有利である。反応が塩基の存在下で実施されるならば、トリエチルアミン、ピリジン、N-メチルモルホリン、若しくはN,N-ジエチルアニリンなどの過剰に利用される塩基は、また、溶媒又は希釈剤としても作用するかもしれない。

【0059】

前記反応は、約-80℃～約+140℃、好ましくは、約-30℃～約+100℃の温度範囲にて、多くの場合、室温～約+80℃の範囲にて有利に実施される。

【0060】

式(I)によって表される化合物は、式(I)によって表される出発化合物の1つ以上の置換基を慣例の様式により本発明による(単数若しくは複数の)他の置換基で置き換えることによって、自体公知の様式により、別の化合物(I)に変換される。

【0061】

いずれの場合にも、好適な反応条件と出発物質の選択によって、例えば、たった1つの反応ステップにおいて、1つの置換基を、本発明による別の置換基によって置き換えることが可能であり、又は複数の置換基を、同じ反応ステップにおいて、本発明による他の置換基によって置き換えることができる。

【0062】

式(I)によって表される化合物の塩は、自体公知の様式で調製できる。これにより、例えば、式(I)によって表される化合物の酸付加塩は、好適な酸又は好適なイオン交換体試薬で処理することによって得られ、そして、塩基をもつ塩は、好適な塩基又は好適な

イオン交換体試薬で処理することによって得られる。

【0063】

式(I)によって表される化合物の塩は、慣例の様式により式(I)によって表される遊離の化合物に変換され、例えば、好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換体試薬での処理によって、酸付加塩に変換され、そして、例えば、好適な酸又は好適なイオン交換体試薬での処理によって、塩基をもつ塩に変換される。

【0064】

式(I)によって表される化合物の塩は、自体公知の様式で、式(I)によって表される化合物の他の塩、つまり、酸付加塩に、例えば、他の酸付加塩に変換され、例えば、ナトリウム塩、バリウム塩、若しくは銀塩などの好適な金属塩での、ハイドロクロライドなどの無機酸の塩の処理によって、例えば、塩化銀を形成する無機塩が、不溶であり、そのため、反応混合物から沈殿する好適な溶剤中、例えば、酢酸銀での、酸の処理によって、変換される。

【0065】

手順又は反応条件に依存して、塩を形成する特性を有する式(I)によって表される化合物が、遊離型又は塩の形態で得られる。

【0066】

遊離型の若しくは塩の形態のいずれの場合にも、式(I)によって表される化合物、又は、適当であれば、その互変異性体は、分子内に生じる不斉炭素原子の数、絶対的及び相対的な立体配置に依存して、及び／又は分子内に生じる非芳香族結合の立体配置に依存して、可能な1種類の異性体の形態で、又はこれらの混合物として、例えば、対掌体、及び／又はジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態で、又はエナンチオマー混合物などの異性体混合物として、例えば、ラセミ体、ジアステレオマー混合物、若しくはラセミ体混合物として存在し得る；本発明は、純粋な異性体に関し、それと同様に、可能性のあるすべての異性体混合物に関し、そして、それぞれの場合について、立体化学の詳細が具体的に言及されていない場合であっても、いずれの場合においても、本明細書中の先にも後にも、この意味で理解される。

【0067】

出発物質と選択された手順に依存して得られる、遊離型の若しくは塩の形態の、式(I)によって表される化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ体混合物は、公知の様式により、成分の物理化学的な相違に基づいて、例えば、分別結晶作用、蒸留、及び／又はクロマトグラフィーによって、純粋なジアステレオマー又はラセメートに分離され得る。

【0068】

同様の方法により得られるラセミ体などのエナンチオマー混合物は、公知の方法によって、光学対掌体に分離されうる。、例えば、光学的に活性な溶剤からの再結晶によって、キラル吸着媒によるクロマトグラフィーによって、アセチル・セルロースによる高速液体クロマトグラフィー(HPLC)によって、好適な微生物を活用して、特異的な固定化酵素を用いた開裂によって、包接化合物の形成を介して、例えば、1種類の鏡像異性体だけが複合体を形成するキラル・クラウン・エーテルを使用して、又はジアステレオマー塩への変換によって、例えば、塩基性の最終産物ラセミ体を、カルボン酸など、例えば、ショウノウ酸、酒石酸、若しくはリンゴ酸と、又はスルホン酸、例えば、カンファースルホン酸、などの光学的に活性な酸と反応させることによって、そして、このようにして得られたジアステレオマー混合物を、例えば、それらの異なる溶解性に基づいた分別結晶作用によって分離することによって分解して、所望の鏡像異性体が好適な作用物質、例えば、塩基性作用物質、の作用によって放出されうるジアステレオマーを得る。

【0069】

純粋なジアステレオマー又は鏡像異性体は、本発明により、好適な異性体混合物を分離することによるだけでなく、一般に知られているジアステレオ選択的又はエナンチオ選択的な合成方法によっても、例えば、好適な立体化学の出発物質を用いた本発明による過程を実施することによっても、得られる。

【0070】

個々の成分が異なった生物学的活性をもつ場合に、生物学的により効果的な異性体、例えば、鏡像異性体若しくはジアステレオマー、又は異性体混合物、例えば、エナンチオマー混合物若しくはジアステレオマー混合物、を分離するか、又は合成することは、いずれの場合にも、有利である。

【0071】

遊離型の若しくは塩の形態のいずれの場合にも、本発明による化合物、及び、適当であれば、その互変異性体は、適当であれば、また、水和物の形態でも得ることができ、及び／又は他の溶媒、例えば、固体で存在する化合物の結晶化に使用されるかもしれないもの、が含まれる。

10

【0072】

非常に好ましい殺生範囲を有し、且つ、温血種、魚類、及び植物によって良好な許容性が示される本発明による化合物は、低い施用程度であっても、病虫害防除の分野において予防的、及び／又は治療的に有益な有効成分である。本発明による有効成分は、通常感受性のものだけでなく、抵抗性のあるもの、つまり、昆虫又はダニ目の代表的なものなどの家畜害虫の、すべて又は個々の発生段階に対して作用する。本発明による有効成分の殺虫又は殺ダニ活性は、少なくとも50～60%の駆除率（死滅率）に相当する良好な活性が、それ自体、直接的に、すなわち、すぐに、若しくはしばらく経過して初めて、例えば、脱皮の間に、起こる病虫害の駆除により、又は間接的に、例えば、低減された産卵、及び／又は孵化率により、現れ得る。

20

【0073】

先に触れた家畜害虫の例は、以下の通りである：

ダニ（Acarina）目からの、例えば、

アシプトコナダニ（*Acarus siro*）、アセリア・シェルドニ（*Aceria sheldoni*）、リンゴサビダニ（*Aculus schlechtendali*）、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.）、ヒメハダニ属（*Brevipalpus* spp.）、クローバーハダニ（*Bryobia praetiosa*）、カリピトリメルス属（*Calipitrimerus* spp.）、ショクヒヒゼンダニ属（*Chorioptes* spp.）、ワクモ（*Dermanyssus gallinae*）、イエローマイト（*Eotetranychus carpini*）、フシダニ属（*Eriophyes* spp.）、イボマダニ属（*Hyalomma* spp.）、フキノデス属（*Ixodes* spp.）、オリゴニクス プラテンシス（*Olygonychus pratensis*）、カズキダニ属（*Ornithodoros* spp.）、ミカンリングハダニ（*Panonychus* spp.）、フィトロコプトルタ・オレイボラ（*Phytlocoptruta oleivora*）、チャノホコリダニ（*Polyphagotarsonemus latus*）、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.）、ヒゼンダニ属（*Sarcoptes* spp.）、ホコリダニ属（*Tarsonemus* spp.）、及びナミハダニ属（*Tetranychus* spp.）；

30

シラミ目（Anoplura）からの、例えば、

ブタジラミ属（*Haematopinus* spp.）、ケモノホソジラミ属（*Linognathus* spp.）、ヒトジラミ属（*Pediculus* spp.）、ペンフィグス属（*Pemphigus* spp.）、及びフィロキセラ属（*Phylloxera* spp.）；

40

鞘翅（Coleoptera）目からの、例えば、

コメツキムシ属（*Agriotes* spp.）、ハナゾウムシ属（*Anthonomus* spp.）、アトマリア・リネアリス（*Atomaria linearis*）、カエトクネマ・ティビアリス（*Chaetocnema tibialis*）、コスモポリテス属（*Cosmopolites* spp.）、シギゾウムシ属（*Curculio* spp.）、カツオブシムシ属（*Dermestes* spp.）、ディアブロチカ属（*Diabrotica* spp.）、エビラクナ属（*Epilachna* spp.）、エレムヌス属（*Eremnus* spp.）、コロラドハムシ（*Leptinotarsa decemlineata*）、リッソロプトルス属（*Lissorhoptrus* spp.）、メロロンタ属（*Melolontha* spp.）、オリカエフィルス属（*Orycaephilus* spp.）、オチオリンクス属（*Otiorynchus* spp.）、フリクチヌス属（*Phlyctinus* spp.）、ポピリア属（*Popillia* spp.）、プシルリオディス属（*Psylliodes* spp.）、リゾペルタ属（*Rhizopertha* spp.）、コガ

50

ネムシ科 (Scarabeidae)、シトフィルス属 (Sitophilus spp.)、シトトロガ属 (Sitotroga spp.)、テネブリオ属 (Tenebrio spp.)、コクヌストモドキ属 (Tribolium spp.)、及びトロゴデルマ属 (Trogoderma spp.) ;

双翅 (Diptera) 目からの、例えば、

アエデス属 (Aedes spp.)、アンテリゴナ・ソッカタ (Antherigona soccata)、ケバエ (Bibio hortulanus)、クロバエ (Calliphora erythrocephala)、セラチチス属 (Ceratitis spp.)、オビキンバエ属 (Chrysomya spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、ウサギヒフバエ属 (Cuterebra spp.)、ダクス属 (Dacus spp.)、キイロショウジョウバエ (Drosophila melanogaster)、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.)、ウマバエ属 (Gastrophilus spp.)、ツェツェバエ属 (Glossina spp.)、ウシバエ属 (Hyppobosca spp.)、ウマシラミバエ属 (Hyppobosca spp.)、ハナモグリバエ属 (Liriomyza spp.)、キンバエ属 (Lucilia spp.)、メラナグロミザ属 (Melanagromyza spp.)、イエバエ属 (Musca spp.)、ヒツジバエ属 (Oestrus spp.)、オルセオリア属 (Orseolia spp.)、オシネラ・フリト (Oscineila frit)、アカザモグリハナバエ (Pegomyia hyoscyami)、クロキンバエ属 (Phorbia spp.)、コドリリング (Rhagoletis pomonella)、ギョウレツウジバエ属 (Sciara spp.)、サシバエ属 (Stomoxys spp.)、アブ属 (Tabanus spp.)、タニア属 (Tannia spp.)、及びガガンボ属 (Tipula spp.) ;

異翅 (Heteroptera) 目からの、例えば、

シメクス属 (Cimex spp.)、ジスタンチエラ・テオブロマ (Distantiella theobroma)、ジスデルクス属 (Dysdercus spp.)、オイキスツス属 (Euchistus spp.)、チャイロカメムシ属 (Eurygaster spp.)、レプトコリス属 (Leptocoirsa spp.)、アオクサカメムシ属 (Nezara spp.)、ピエスマ属 (Piesma spp.)、ロドニウス属 (Rhodnius spp.)、サールベルゲラ・シングラリス (Sahlbergella singularis)、スコチノファラ属 (Scotinophara spp.)、及びサシガメ属 (Triatoma spp.) ;

同翅 (Homoptera) 目からの、例えば

ウーリーコナジラミ (Aleurothrixus floccosus)、アレイロデス・ブラッシカ (Aleyrodes brassicae)、アオニジエラ属 (Aonidiella spp.)、アブラムシ科 (Aphididae)、ワタアブラムシ属 (Aphis spp.)、アスピジオツス属 (Aspidiotus spp.)、タバココナジラミ (Bemisia tabaci)、セロプラステル属 (Ceroplaster spp.)、クリソンファルス・アオニジウム (Chrysomphalus aonidium)、コノハカイガラムシ (Chrysomphalus dictyospermi)、ヒラタカカイガラムシ (Coccus hesperidum)、エンポアスカ属 (Empoasca spp.)、エリオソマ・ラリゲルム (Eriosoma larigerum)、エリスロノイラ属 (Erythroneura spp.)、ガスカルジア属 (Gascardia spp.)、ラオデルファキス属 (Laodelphax spp.)、ミズキカタカイガラムシ (Lecanium corni)、レピドサフェス属 (Lepidosaphes spp.)、マクロシフス属 (Macrosiphus spp.)、コブアブラムシ属 (Myzus spp.)、ツマグロヨコバイ属 (Nephotettix spp.)、ニラパルバタ属 (Nilaparvata spp.)、パルラトリア属 (Parlatoria spp.)、ペンフィグス属 (Pemphigus spp.)、プラノコッカス属 (Planococcus spp.)、シューダウラカスピス属 (Pseudaulacaspis spp.)、シュードコックス属 (Pseudococcus spp.)、キジラミ属 (Psylla spp.)、プルビナリア・アチオピカ (Pulvinaria aethiopica)、クアドラスピジオツス属 (Quadraspidotus spp.)、クビレアブラムシ属 (Rhopalosiphum spp.)、サイッセチア属 (Saissetia spp.)、スカホイドイス属 (Scaphoideus spp.)、スキザフィス属 (Schizaphis spp.)、シトピオン属 (Sitobion spp.)、オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum)、ミカントガリキジラミ (Trioza erytraeae)、及びシトラススノースケール (Unaspis citri) ;

膜翅 (Hymenoptera) 目からの、例えば、

ハキリアリ (Acromyrmex)、アッタ属 (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)、ハバチ属 (Hoplocampa spp.)、クロクサアリ属 (Lasius spp.)、イエヒメアリ (Monomorium pharaonis)、ネオジプリオン属 (Neodiprion spp.)、ファイヤーアント属 (Solenopsis spp.)、及びスズメバチ属 (Vespa spp.) ;

翅 (Isoptera) 目からの、例えば、

レチクリテルメス属 (*Reticulitermes* spp.) ;

鱗翅 (Lepidoptera) 目からの、例えば、

アクレリス属 (*Accleris* spp.)、チャノコカクモンハマキ属 (*Adoxophyes* spp.)、
アエゲリア属 (*Aegeria* spp.)、ヤガ属 (*Agrotis* spp.)、アラバーマヤガ (*Alabama ar*
gillaceae)、アミロイス属 (*Amylois* spp.)、アンチカルシア・ゲルンマタリス (*Antica*
rsia gernmatalis)、ハマキガ属 (*Archips* spp.)、アルギロタエニア属 (*Argyrotaenia*
spp.)、アウトグラファ属 (*Autographa* spp.)、アフリカズイムシ (*Busseola fusca*)
、スジマダラメイガ (*Cadra cautella*)、モモノヒメシンクイ (*Carposina nipponensis*
)、ニカメイガ属 (*Chilo* spp.)、コリストノイラ属 (*Choristoneura* spp.)、クリシア
・アンビグエラ (*Clysia ambiguella*)、クナファロクロシス属 (*Cnaphalocrocis* spp.)
、クネファシア属 (*Cnephasia* spp.)、コキルイス属 (*Cochylis* spp.)、コレオホラ属
(*Coleophora* 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*)、シジア属 (*Cydia* spp.)、ジアトラエア
属 (*Diatraea* spp.)、ジパロプシス・カスタネア (*Diparopsis castanea*)、エアリアス
属 (*Earias* spp.)、エフェスティア属 (*Ephestia* spp.)、オイコスマ属 (*Eucosma* spp.)
、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguella*)、ドクガ属 (*Euproctis* spp.)、オイ
キソア属 (*Euxoa* spp.)、グラホリタ属 (*Grapholita* spp.)、ヘジア・ヌビフェラナ (*H*
edya nubiferana)、ヘリオチス属 (*Heliothis* spp.)、ハイマダラノメイガ (*Hellula u*
ndalis)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコペルシセラ (
Keiferia lycopersicella)、ロイコプテラ・シテラ (*Leucoptera scitella*)、リトコレ
チス属 (*Lithocollethis* spp.)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、マイマイガ属
(*Lymantria* spp.)、リオネチア属 (*Lyonetia* spp.)、テンマクケムシ属 (*Malacosoma*
spp.)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、オペロ
フテラ属 (*Operophtera* spp.)、ヨーロッパアワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パン
メン属 (*Pammene* spp.)、パンデミス属 (*Pandemis* spp.)、マツキリガ (*Panolis flamm*
ea)、ペクチノホラ・ゴッシピエラ (*Pectinophora gossypiella*)、ジャガイモガ (*Phtho*
rimaea operculella)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属 (*Pieris* spp.)
、コナガ (*Plutella xylostella*)、プライス属 (*Prays* spp.)、シルポファガ属 (*Scirp*
ophaga spp.)、セサミア属 (*Sesamia* spp.)、スパルガノチス属 (*Sparganothis* spp.)
、シロナヨトウ属 (*Spodoptera* spp.)、コスカシバ (*Synanthedon* spp.)、タウメトポ
エア属 (*Thaumetopoea* spp.)、トルトリキス属 (*Tortrix* spp.)、イラクサギンウワバ
(*Trichopiusia ni*)、及びスガ属 (*Yponomeuta* spp.) ;

食毛 (Mallophaga) 目からの、例えば、

ダマリネア属 (*Damalinea* spp.) 及びケモノハジラミ属 (*Trichodectes* spp.) ;

直翅 (Orthoptera) 目からの、例えば、

ゴキブリ属 (*Blatta* spp.)、チャバネゴキブリ属 (*Blattella* spp.)、ケラ属 (*Gry*
llotalpa spp.)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属 (*Locusta*
spp.)、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta* spp.)、及びコオロギ属 (*Schistocerca* spp.)
);

嘴虫 (Psocoptera) 目からの、例えば、

リポセリス属 (*Liposcelis* spp.) ;

隠翅 (Siphonaptera) 目からの、例えば、

ナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides* spp.)、及びケ
オプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) ;

総翅 (Thysanoptera) 目からの、例えば、

フランクリニエラ属 (*Frankliniella* spp.)、ヘルシノトリプス属 (*Hercinothrips*
spp.)、シルトリプス・アウランチイ (*Scirtothrips aurantii*)、タエニオトリプス
属 (*Taeniothrips* spp.)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、及びネギアザミ
ウマ (*Thrips tabaci*) ;そして、

10

20

30

40

50

総尾 (Thysanura) 目からの、例えば、
セイヨウシミ (Lepisma saccharina)。

【0074】

本発明による有効成分は、具体的には、植物に発生する、特に農業、園芸、及び森林の有用植物及び観賞用植物に発生する、又は、果実、花、葉、茎、塊茎、又は根などの器官に発生する前述のタイプの病害虫、そして、場合によっては、これらの病害虫に対して保護された状態のまま、もっと後の時点で形成される植物器官に発生するものであっても防除する、すなわち、封じ込めるか、又は駆除するために使用され得る。

【0075】

好適な標的作物は、具体的には、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、コメ、トウモロコシ、若しくはソルガムなどの穀類；テンサイ若しくは飼料用ビートなどのビート；リンゴ、洋ナシ、プラム、モモ、アーモンド、チェリー、若しくは、イチゴ、ラズベリーや、キイチゴなどのベリーなどの果物、例えば、仁果類、核果類、若しくは柔らかい果物；マメ、レンズマメ、エンドウマメ、若しくはダイズなどのマメ科作物；ナタネ、マスタートード、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ココナッツ、キャスター、ココア、若しくはラッカセイ (ground nuts) などの油料穀物；カボチャ、キュウリ、若しくはメロンなどのウリ科植物；綿、亜麻、麻、若しくは黄麻などの繊維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツ、若しくはタンゼリンなどの柑橘系果実；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、若しくはピーマンなどの野菜；アボガド、シナモン (Cinnamomum)、若しくはショウノウなどのクスノキ科植物；タバコ、ナッツ、コーヒー、ナス、サトウキビ、チャ、コショウ、ブドウのつる、ホップ、オオバコ・ファミリー、ラテックス植物、及び観賞用植物である。

【0076】

本発明による有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、コメ、及びダイズ作物のマメアブラムシ (Aphis craccivora)、ディアブロチカ・バルテアタ (Diabrotica balteata)、オオタバコガ (Heliothis virescens)、モモアカアブラムシ (Myzus persicae)、コナガ (Plutella xylostella)、及びスポドプテラ・リトラリス (Spodoptera littoralis) の防除に特に好適である。本発明による有効成分は、(好ましくは野菜の) ヨトウガ科 (Mamestra)、(好ましくはリンゴの) コドリガ (Cydia pomonella)、(好ましくは野菜、ブドウ園の) ヨコバイ科 (Empoasca)、(好ましくはジャガイモの) ハムシ科 (Leptinotarsa)、及び(好ましくはコメの) キロ・スプレッサリス (Chilo suppressalis) の防除にさらに特に好適である。

【0077】

用語「作物」は、在来の育種又は遺伝子工学の方法の結果としてプロモキシニルのような除草剤、又は(例えば、HPPD阻害剤、ALS阻害剤、例えば、プリミスルフロン、プロスルフロン、及びトリフルオキシスルフロン、EPSPS (5-エノール-ピロビル-シキマート-3-リン酸シンターゼ) 阻害剤、GS (グルタミン・シンターゼ) 阻害剤などの) 除草剤のクラスに対して耐性を持たせた作物も含んでいると理解されるものとする。在来の育種法(突然変異誘発)によってイミダゾリノン、例えば、イマザモックスに対する耐性を持たせた作物の例は、Clearfield (登録商標) 夏ナタネ (Canola) である。遺伝子工学による方法によって除草剤若しくは除草剤のクラスに対して耐性を持たせた作物の例には、Roundup Ready (登録商標) や LibertyLink (登録商標) の商品名で市販のグリホセート-及びグリホシネート耐性トウモロコシ変種が含まれる。

【0078】

用語「作物」には、例えば、毒素産生細菌、特に、バチルス (Bacillus) 属のもので知られているような1種類以上の選択的に作用する毒素を合成することができるよう組換えDNA技術の使用によって形質転換された作物植物も含まれるものとする。

【0079】

そのようなトランスジェニック植物によって発現される毒素には、例えば、殺虫タンパク質、例えば、バチルス・セレウス (Bacillus cereus) 又はバチルス・ポピリアエ (Bac

10

20

30

40

50

illus popliae) からの殺虫タンパク質；又は、 δ -エンドトキシン、などのバチルス・チューリンゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) からの殺虫タンパク質、例えば、CryIA (b)、CryIA (c)、CryIF、CryIF (a2)、CryIIA (b)、CryIIIA、CryIIIB (b1)、若しくはCry9c、又は植物性殺虫タンパク質 (VIP)、例えば、VIP1、VIP2、VIP3、若しくはVIP3A；又は線虫にコロニーを作る細菌、例えば、フォトラブダス種 (*Photorhabdus* spp.) 若しくはゼノラブダス種 (*Xenorhabdus* spp.)、例えば、フォトラブダス・ルミネセンス (*Photorhabdus luminescens*)、ゼノラブダス・ネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*)、の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ毒素、ハチ毒素、及び他の昆虫に特異的な神経毒などの動物によって産生される毒素；ストレプトミセス毒素などの真菌によって産生される毒素、エンドウマメ・レクチン、オオムギ・レクチン、若しくはスノードロップ・レクチンなどの植物性レクチン；アグルチニン；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロテイナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン (luffin)、サポリン、若しくはブリオジン (bryodin) 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などのステロイド代謝酵素、エクジステロイド-UDP-グリコシル転移酵素、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、ナトリウム若しくはカルシウム・チャンネル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、ジウレチック・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、並びにグルカナーゼが含まれる。

【0080】

本発明との関連において、 δ -エンドトキシン、例えば、CryIA (b)、CryIA (c)、CryIF、CryIF (a2)、CryIIA (b)、CryIIIA、CryIIIB (b1)、若しくはCry9c、又は植物性殺虫タンパク質 (VIP)、例えば、VIP1、VIP2、VIP3、若しくはVIP3A、によって、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素 (truncated toxins)、及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ったドメインの新たな組合せによって組換えにより生み出される (例えば、WO 02/15701を参照のこと)。切断毒素、例えば、切断CryIA (b)、が公知である。改変毒素の場合には、天然に存在する毒素のアミノ酸の1つ以上が置き換えられている。そのようなアミノ酸置換において、好ましくは、非天然プロテアーゼ認識配列が、毒素内に挿入される、例えば、CryIIIA055の場合では、カテプシンD認識配列がCryIIIA毒素内に挿入されている (WO 03/018810を参照のこと)。

【0081】

そのような毒素、又はそのような毒素を合成できるトランスジェニック植物の例は、例えば、EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878、及びWO 03/052073に開示されている。

【0082】

そのようなトランスジェニック植物の調製過程は、当業者によって一般的に知られており、そして、例えば、先に記載の刊行物に記載されている。CryI型のデオキシリボ核酸、及びその調製方法は、例えば、WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979、及びWO 90/13651によって知られている。

【0083】

トランスジェニック植物に含まれた毒素は、害虫に対する抵抗性を植物に与える。そのような昆虫は、昆虫のあらゆる分類群でも起こるが、甲虫 (鞘翅類)、2つの翅を持つ昆虫 (双翅類)、及びチョウ (鱗翅類) において特に一般的に見られる。

【0084】

殺虫性の抵抗性をコードする1種類以上の遺伝子を含み、そして、1種類以上の毒素を発現するトランスジェニック植物が、知られており、そして、それらの中のいくつかが市販されている。そのような植物の例は、以下の通りである：YieldGard (登録商標) (CryIA (b) 毒素を発現するトウモロコシ変種)；YieldGard Rootworm (登録商標) (CryIIIB (b1) 毒素を発現するトウモロコシ変種)；YieldGard Plus (登録商標) (CryIA (b) 及びCryIIIB (b1) 毒素を発現するトウモロコシ変種)；Starlink (登録商標) (Cry9 (c) 毒

素を発現するトウモロコシ変種) ; Herculex I (登録商標) (CryIF (a2) 毒素、及び除草剤のグルホシネート・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変種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (CryIA (c) 毒素を発現するワタ変種) ; Bollgard I (登録商標) (CryIA (c) 毒素を発現するワタ変種) ; Bollgard II (登録商標) (CryIA (c) 及びCryIIA (b) 毒素を発現するワタ変種) ; VIPCOT (登録商標) (VIP毒素を発現するワタ変種) ; NewLeaf (登録商標) (CryIIIA毒素を発現するジャガイモ変種) ; NatureGard (登録商標) Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA21グリホセート耐性形質)、Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt11アワノメイガ (corn borer) (CB) 形質)、並びにProtecta (登録商標) 。

10

【0085】

そのようなトランスジェニック作物のさらなる例は、以下の通りである：

1. Bt11トウモロコシ、Syngenta Seeds SAS製、Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France、登録番号C/FR/96/05/10。切断CryIA (b) 毒素のトランスジェニック発現によってヨーロッパ・アワノメイガ (アワノメイガ及びセサミア・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) による侵襲に対する抵抗性を得た遺伝子組換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、また、除草剤のグルホシネート・アンモニウムに対する耐性を得るために、遺伝子組換えにより酵素PATも発現する。

【0086】

2. Bt176トウモロコシ、Syngenta Seeds SAS製、Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France、登録番号C/FR/96/05/10。CryIA (b) 毒素のトランスジェニック発現によってヨーロッパ・アワノメイガ (アワノメイガ及びセサミア・ノナグリオイデス (*Sesamia nonagrioides*)) による侵襲に対する抵抗性を得た遺伝子組換えトウモロコシ。Bt176トウモロコシは、また、除草剤のグルホシネート・アンモニウムに対する耐性を得るために、遺伝子組換えにより酵素PATも発現する。

20

【0087】

3. MIR₆04トウモロコシ、Syngenta Seeds SAS製、Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, France、登録番号C/FR/96/05/10。改変CryIIIA毒素のトランスジェニック発現によって耐虫性を持たせたトウモロコシ。この毒素は、カテブシンD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。そのようなトランスジェニック・トウモロコシ植物の調製は、WO 03/018810に記載されている。

30

【0088】

4. MON863トウモロコシ、Monsanto製、Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium、登録番号C/DE/02/9。MON863は、CryIIIB (b1) 毒素を発現するので、特定の鞘翅類昆虫に対して抵抗性を持っている。

【0089】

5. IPC531ワタ、Monsanto製、Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium、登録番号C/ES/96/02。

【0090】

6. 1507トウモロコシ、Pioneer Overseas Corporation製、Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅類昆虫に対する抵抗性を得るためのタンパク質Cry1F、及び除草剤のグルホシネート・アンモニウムに対する耐性を得るためのPATタンパク質の発現のための遺伝子組換えトウモロコシ。

40

【0091】

7. NK603×MON810トウモロコシ、Monsanto製、Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組換え変種NK603とMON810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ変種から成る。NK603×MON810トウモロコシは、(グリホサートを含む) 除草剤のRoundup (登録商標) に対する耐性を与えるアグロバクテリウム種菌株CP4から得られるタンパク質CP4 EPSPS、並びにヨーロッパ・アワノメイガを含めた特定の鱗翅類に対する抵抗性を引き起こすバチルス・チュ

50

ーリンゲンシス亜種クルスタキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) から得られるCryIA (b) 毒素も遺伝子組換えにより発現する。

【0092】

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

【0093】

用語「作物」は、また、例えば、いわゆる、「病原性関連タンパク質」(PRPs、例えば、EP-A-0 392 225を参照のこと)などの選択的な作用を有する抗病原性物質を合成できるように、組換えDNA技術の使用によって形質転換された作物植物も含むものとする。そのような抗病原性物質、及びそのような抗病原性物質を合成できるトランスジェニック植物の例は、例えば、EP-A-0 392 225、WO 95/33818、及びEP-A-0 353 191により知られている。そのようなトランスジェニックが植物の調製方法は、当業者によって一般的に知られており、そして、例えば、先に触れた刊行物に記載されている。

【0094】

そのようなトランスジェニック植物によって発現される抗病原性物質には、例えば、ナトリウム及びカルシウム・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、若しくは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」(PRPs；例えば、EP-A-0 392 225を参照のこと)；微生物によって産生される抗病原性物質、例えば、ペプチド系抗生物質若しくは複素環式抗生物質(例えば、WO 95/33818を参照のこと)、又は植物の病原菌防御にかかわるタンパク質若しくはポリペプチド因子(WO 03/000906に記載のいわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」)が含まれる。

【0095】

本発明による化合物の使用のさらに分野は、言及したタイプの病害虫に対する、貯蔵品と貯蔵室の保護、そして、木材、織物、敷物、若しくは建築物などの素材の保護、並びに衛生部門における、特に、ヒト、家畜、及び生産的な家畜の保護でもある。

【0096】

衛生部門では、本発明による化合物は、マダニ類、ヒメダニ類、キュウセンヒゼンダニ類、ツツガムシ、(噛み付く、及びなめる)ハエ、寄生的なハエ幼虫、シラミ、毛ジラミ、鳥のシラミ、及びノミなどの外部寄生虫に対して活性である。

【0097】

そのような寄生生物の例は、以下の通りである：

シラミ (Anoplurida) 目の：ブタジラミ属 (*Haematopinus* spp.)、ケモノホソジラミ属 (*Linognathus* spp.)、ペジクルス属 (*Pediculus* spp.)、フチルス属 (*Phtirus* spp.)、及びソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.)。

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

ハエ (Diptera) 目及びカ (Nematocera) 亜目とハエ (Brachycera) 亜目の、例えば、アエデス属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、ブユ属 (*Simulium* spp.)、エウシムリウム属 (*Eusimulium* spp.)、サンショウバエ属 (*Phlebotomus* spp.)、ルツォミヤ属 (*Lutzomyia* spp.)、サシバエ属 (*Culicoides* spp.)、メクラアブ属 (*Chrysops* spp.)、ヒボミトラ属 (*Hybomitra* spp.)、アチロツス属 (*Atylotus* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、ハエマトポタ属 (*Haematopota* spp.)、フィリポミイア属 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属 (*Braula* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、ヒドロタエア属 (*Hydrotaea* spp.)、ストモキシス属 (*Stomoxys* spp.)、ハエマトビア属 (*Haematobia* spp.)、モレリア属 (*Morellia* spp.)、ヒメイエバエ

属 (*Fannia* spp.)、グロシナ属 (*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 (*Chrysomya* spp.)、ウォルハルチア属 (*Wohlfahrtia* spp.)、サルコファガ属 (*Sarcophaga* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、ヒフバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ウマバエ属 (*Gasterophilus* spp.)、シラミバエ属 (*Hippobosca* spp.)、リポプテナ属 (*Lipoptena* spp.)、及びヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。

ノミ (Siphonaptera) 目の、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.)、及びナガノミ属 (*Ceratophyllus* spp.)。

カメムシ (Heteroptera) 目の、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.)、及びパンストロンギルス属 (*Panstrongylus* spp.)。

ゴキブリ (Blattaria) 目の、例えば、コバネゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、ブラテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、及びスペラ属 (*Supella* spp.)。

アカリア (*Acaria* (Acarida)) 亜綱及びメタスチグマタ (*Metastigmata*) 目とメソスチグマタ (*Mesostigmata*) 目の、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.)、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.)、ハエモフィサリス属 (*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.)、プネウモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.)、及びバロア属 (*Varroa* spp.)。

アクチネジダ (*Actiniedida* (Prostigmata)) 目及びアカリジダ (*Acaridida* (Astigmata)) 目の、例えば、アカラピス属 (*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属 (*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属 (*Ornithocheyletiella* spp.)、ミオビア属 (*Myobia* spp.)、プソレルガテス属 (*Psorergates* spp.)、ニキビダニ属 (*Demodex* spp.)、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp.)、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp.)、ダニ属 (*Acarus* spp.)、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp.)、サルコプテス属 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属 (*Cytodites* spp.)、及びラミノシオプテス属 (*Laminosioptes* spp.)。

【0098】

本発明による化合物は、また、木材、織物、プラスチック、接着剤、膠剤、塗料、紙及びカード、皮革、敷物、並びに建築物などの材料の場合にも虫害から保護するのに好適である。

【0099】

そのため、本発明は、また、本発明による有効成分の一少なくとも一種類以上を含み、且つ、意図された標的及び主だった状況に適合するように選択される乳剤、懸濁液、直接的にスプレー可能な若しくは希釈可能な溶液、塗ることができるペースト剤、希薄乳濁液、可溶性散剤、分散性散剤、水和剤、粉剤、顆粒剤、又は高分子物質内へのカプセル封入などの殺虫組成物にも関する。

【0100】

これらの組成物では、有効成分は、純粋な形で、固体の有効成分で、例えば、特定の粒径で、又は、好ましくは、製剤の技術分野において普通に使用されている、増量剤、例えば、溶媒若しくは固体担体など、又は界面活性化合物 (界面活性剤) などの補助剤の一少なくとも一種類と一緒に、利用される。

【0101】

10

20

30

40

50

好適な溶剤の例は、以下の通りである：非水素化及び部分的水素化芳香族炭化水素、好ましくは、キシレン混合物などのアルキルベンゼンの画分C8-C12、アルキル化ナフタレン若しくはテトラヒドロナフタレン、パラフィン若しくはシクロヘキサンなどの脂肪族若しくは脂環式炭化水素、エタノール、プロパノール、若しくはブタノールなどのアルコール、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、若しくはエチレングリコール・モノメチル・エーテルやエチレングリコール・モノエチルエーテルなどのグリコール及びそれらのエーテルやエステル、シクロヘキサノン、イソホロン、若しくはジアセトン・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、若しくはN,N-ジメチルホルムアミドなどの強極性溶媒、水、非エポキシ化若しくはエポキシ化ナタネ油、キャスター油、ココナッツ油、若しくはダイズ油などの非エポキシ化若しくはエポキシ化植物油、又はシリコン油。

10

【0102】

例えば、粉剤及び分散性の散剤に使用される固体担体は、原則として、方解石、タルク、カオリン、モンモリロナイト、若しくはアタパルジャイトなどの砕いた天然鉱物である。物理特性を改善するために、高分散性シリカ、又は高分散性の吸収性重合体を加えることも可能である。顆粒剤に好適な粒状の吸着性担体は、軽石、レンガ砂 (brick grit)、海泡石、又はベントナイトなどの多孔質型であり、好適な非吸収性担材は、方解石又は砂である。加えて、多くの無機性又は有機性の粒状材料、特に、ドロマイト又は粉碎した植物性残渣が、使用される。

【0103】

20

好適な表面活性化合物は、処方される有効成分のタイプによって、非イオン系、陽イオン系、及び／又は陰イオン系の界面活性剤であるか、あるいは、良好な乳化、分散、湿潤特性を有する界面活性剤混合物である。以下に触れる界面活性剤は、単に例とみなされるべきものである；製剤の技術分野で普通に使用され、そして、本発明に照らし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。

【0104】

好適な非イオン系界面活性剤は、特に、脂肪族若しくは脂環式アルコールから成るポリグリコール・エーテル誘導体、飽和若しくは不飽和脂肪酸から成るポリグリコール・エーテル誘導体、あるいは、(シクロ)脂肪族炭化水素ラジカル内に約3～約30個のグリコール・エーテル基と約8～約20個の炭素原子を含むかもしれないアルキルフェノールから成るか、又はアルキルフェノールのアルキル部分に約6～約18個の炭素原子を含むかもしれないものから成るポリグリコール・エーテル誘導体である。また、好適なものは、ポリプロピレングリコールを有する水溶性ポリエチレン・オキシド付加物、エチレンジアミノポリプロピレングリコール、又はアルキル鎖内に1～約10個の炭素原子を持ち、且つ、約20～約250個のエチレングリコール・エーテル基を持ち、且つ、約10～約100個のプロピレングリコール・エーテル基を持つアルキル・ポリプロピレングリコールである。通常、先に触れた化合物には、1個のプロピレングリコール・ユニットあたり1～約5個のエチレングリコール・ユニットが含まれる。言及されるかもしれない例は、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、又はオクチルフェノキシポリエトキシエタノールである。また、好適であるものは、ポリオキシエチレン・ソルビタン・トリオレア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である。

30

40

【0105】

陽イオン系界面活性剤は、特に、置換基として約8～約22個のC原子から成る少なくとも1個のアルキル・ラジカルを一般的に持ち、そして、さらなる置換基として(非ハロゲン化又はハロゲン化)低級アルキル若しくはヒドロキシアルキル又はベンジル・ラジカルを持つ四級アンモニウム塩である。前記塩は、好ましくは、ハロゲン化物、メチル硫酸塩、又はエチル硫酸塩の形である。例は、ステアリルトリメチルアンモニウム・クロライド及びベンジルビス(2-クロロエチル)エチル-アンモニウム・ブロマイドである。

50

【0106】

好適な陰イオン系界面活性剤の例は、水溶性石鹼又は水溶性合成表面活性化合物である。好適な石鹼の例は、オレイン酸若しくはステアリン酸のナトリウム塩若しくはカリウム塩などの約10～約22個のC原子を持つ脂肪酸の、あるいは、例えば、ココナッツ油若しくはタール油から得られる、天然の脂肪酸混合物のアルカリ、アルカリ土類、又は（非置換若しくは置換された）アンモニウム塩である；言及のものは、また、脂肪酸メチル・タウラートも使わなければならない。しかしながら、合成界面活性剤、具体的には、脂肪性スルホナート、脂肪性スルファート、スルホナート化ベンゾイミダゾール誘導体、又はアルキルアリール・スルホナートが、より頻繁に使用される。原則として、脂肪性スルホナート及び脂肪性スルファートは、アルカリ、アルカリ土類、又は（置換若しくは非置換の）アンモニウム塩として存在し、そして、それらは、一般に、約8～約22個のC原子から成るアルキル・ラジカルを持ち、アルキルは、また、アシル・ラジカルのアルキル部分を含んでいると理解されるべきでもあり；言及されるかもしれない例は、リグノスルホン酸、ドデシル硫酸エステル、若しくは天然の脂肪酸から調製された高級アルコール・スルファート混合物のナトリウム塩又はカルシウム塩である。この群には、また、高級アルコール／エチレン・オキシド付加物の硫酸エステル及びスルホン酸の塩も含まれる。スルホネート化ベンゾイミダゾール誘導体は、好ましくは、2つのスルホニル基、及び約8～約22個のC原子から成る脂肪酸ラジカルを含んでいる。アルキルアリールスルホナートの例は、デシルベンゼンスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸、又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、カルシウム、又はトリエタノールアンモニウム塩である。また、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の塩、又はリン脂質などの好適なリン酸も可能である。

【0107】

原則として、組成物は、0.1～99%、特に、0.1～95%の有効成分、及び1～99.9%、特に、5～99.9%の少なくとも1種類の固体又は液体アジュバントを含み、原則として、組成物の0～25%、特に、0.1～20%までの界面活性剤が存在することが可能である（それぞれの場合で、%は重量パーセントを意味する）。濃厚組成物は、商品として好まれる傾向があるが、最終消費者は、原則として、実質的に低濃度の有効成分を含む希釈組成物を使用する。好ましい組成物は、具体的には、以下の通り構成される（%=重量%）：

乳剤：

有効成分： 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%

粉剤：

有効成分： 0.1～10%、好ましくは0.1～1%
固体担体： 99.9～90%、好ましくは99.9～99%

ゾル剤（Suspension concentrates）：

有効成分： 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%

水和剤：

有効成分： 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%

粒剤：

有効成分： 0.5～30%、好ましくは3～15%
固体担体： 99.5～70%、好ましくは97～85%

【0108】

組成物は、また、安定化剤、例えば、非エポキシ化若しくはエポキシ化植物油（例えば、エポキシ化ココナッツ油、ナタネ油、若しくはダイズ油）、消泡剤、例えば、シリコー

ン油、保存料、粘性調節剤、結合剤、及び／又は粘着付与剤、肥料、あるいは、特定の効果を得るための他の有効成分、例えば、殺菌剤、殺真菌剤、線虫駆除剤、植物活性化剤、軟体動物駆除剤、又は除草剤などの固体又は液体補助剤をさらに含む。

【0109】

本発明による組成物は、補助剤の不存在下、例えば、固体の有効成分をすりつぶし、ふるいにかけ、及び／又は圧縮することによって、そして、少なくとも1種類の補助剤の存在下、例えば、有効成分と（単数若しくは複数の）補助剤をよく混合し、及び／又はすりつぶすことによって、自体公知の様式で調製される。前記組成物のこれらの調製過程、及びこれらの組成物の調製のための化合物（I）の使用もまた、本発明の対象である。

【0110】

前記組成物の施用方法、すなわち、一主だった状況の意図される標的に適合するように選択されるスプレー、噴霧、まぶす（dusting）、はけ塗り（brushing on）、塗る（dressing）、散布（scattering）、若しくは流し込む（pouring）などの先に触れたタイプの病虫害防除方法、並びに先に触れたタイプの病虫害防除のための組成物の使用は、本発明の他の対象である。代表的な濃度の割合は、0.1～1000ppm、好ましくは0.1～500ppmの有効成分である。1ヘクタールあたりの投与割合は、一般に、1ヘクタールあたり1～2000gの有効成分であり、特に、10～1000g/ha、好ましくは10～600g/haである。

【0111】

作物保護の分野での好ましい施用方法は、植物の葉への施用（葉面散布）であり、問題となっている病虫害の出没の危険性に合致するように施用の頻度と割合を選択することが可能である。あるいは、有効成分は、液体組成物で植物のある場所を濡らすこと（drenching）によって、又は固体の有効成分を植物のある場所に、例えば、顆粒剤の形態で、例えば、土の中に、盛り込む（土壌施用）ことによって、根系を介して植物に達する（全身作用）。水稻作物の場合では、そのような顆粒剤は、水田に対して計量されてもよい。

【0112】

本発明による組成物は、また、先に触れたタイプの病虫害に対する、植物育苗材料、例えば、果実などの種子、塊茎若しくはカーネル、又は苗、の保護に好適である。育苗材料は、植え付けの前に組成物で処理することができ、例えば、種子は種蒔きの前に処理することができる。あるいは、前記組成物は、そのカーネルを液体組成物に浸すか、又は固体組成の層を塗布することによって、種子カーネルに施用される（コーティング）。また、育苗材料が施用場所に植え付けされるときに、例えば、筋蒔き中の畝間の中に、前記組成物を施用することも可能である。植物育苗材料のこれらの処理方法、及びこれにより処理された植物育種材料は、本発明のさらなる対象である。

【実施例】

【0113】

調製実施例

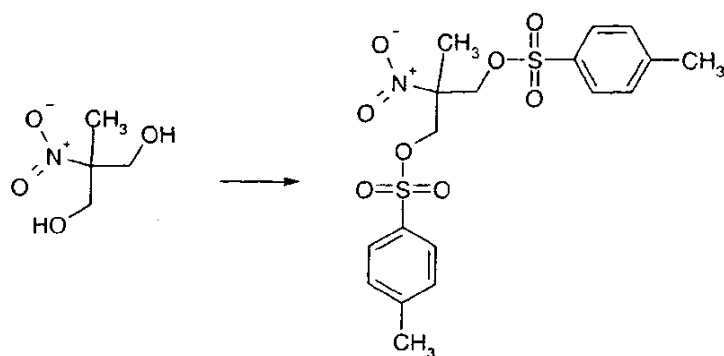
以下の実施例は、本発明について説明すること、及び式（I）によって表される好ましい化合物を示すことを目的としている。自由原子価は、メチル基を表す。

【0114】

実施例P1：化合物T13.1.2の調製：

ステップ1：2-メチル-2-ニトロ-1,3-プロパンジオール・ジトシラートの調製：

【化 2 4】



10

【0 1 1 5】

F. I. Carroll, J. Org. Chem. 1969, 34, 466-8と同じように：

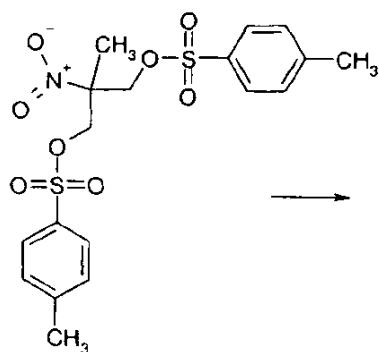
ジエチルエーテル (250ml) 中、2-メチル-2-ニトロ-1,3-プロパンジオール (80g、0.59 2mol) 及びトリエチルアミン (131.8g、1.303mol) の溶液に、-15℃～-20℃にて、ジエチルエーテル (800ml) 中、トシルクロライド (225.7g、1.184mol) の溶液を加える。得られた懸濁液を、0℃にて1時間攪拌し、その後、外気温にて18時間攪拌する。反応混合物を、濾過し、固形残渣を酢酸エチル中に2回溶かし、そして、攪拌し、その懸濁液を再び濾過する。合わせた酢酸エチル層を、蒸発乾固して、未精製の生成物 (175.8g) の第一クロップを得た。エーテル濾液を、水 (2×) 及び塩水で洗浄し、乾燥させ (Na₂SO₄)、濾過して、そして、ある程度濃縮する。懸濁液を濾過して、さらに15.0gの生成物を得た。前記未精製の固体生成物 (190.8g、73%) を、次のステップでさらに精製なしに使用する。

20

【0 1 1 6】

ステップ2：3-メチル-3-ニトロ-チエタンの調製：

【化 2 5】



30

40

【0 1 1 7】

K. K. Andersen et al., J. Org. Chem. 1978, 43, 3827-34と同じように：

DMSO (130ml) 中、2-メチル-2-ニトロ-1,3-プロパンジオール・ジトシレート (ステップ1の生成物) (17g、38.3mmol) の溶液を、硫化ナトリウム (Na₂S・xH₂O 32～38%、11.92g、～53.5mmol) で処理し、そして、その混合物を、90℃ (浴槽110℃) の温度にて2時間攪拌する。冷ました反応混合物を、水中に注ぎ入れ、Et₂Oで抽出し、合わせた有機層を、水 (2×) 及び塩水で洗浄し、乾燥させ (Na₂SO₄)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の液体生成物 (3.52g、69%) を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

【0 1 1 8】

50

ステップ3：3-アミノ-3-メチル-チエタンの調製：
【化26】



【0119】

エタノール (100ml) 及び水 (50ml) 中、3-メチル-3-ニトロ-チエタン (ステップ2の生成物) (3.52g、26.4mmol) の溶液に、塩化アンモニウム (1.55g、29.0mmol) とそれに続いて、鉄粉末 (14.0g、250.7mmol) を加え、そして、その混合物を、1時間、還流温度に加熱する。冷ました反応混合物を、Hyfloを通して濾過し、残渣をジエチルエーテルとジクロロメタンで洗浄し、そして、合わせた濾液を、減圧下で慎重に濃縮する。生成物の黄色がかった液体 (0.66g、24%) を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

【化27】

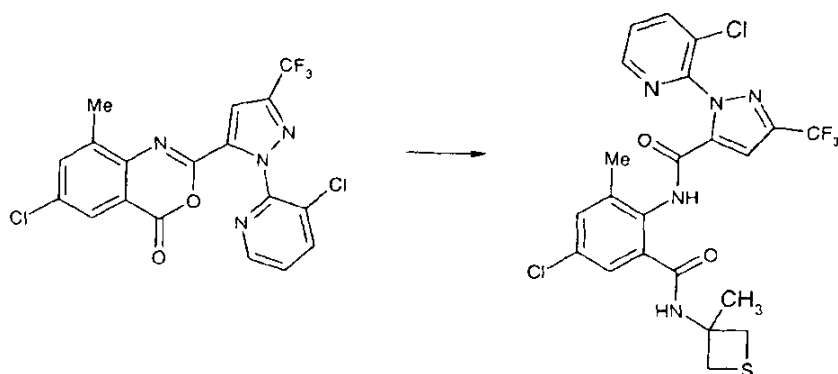
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 3.25 (d, $J=9.3$ Hz, 2H), 3.04 (d, $J=9.8$ Hz, 2H), 1.78 (s, 2H), 1.53 (s, 3H)。

【0120】

ステップ4：(2-(3-クロロピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(3-メチル-チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド) の調製：

【0121】

【化28】



【0122】

テトラヒドロフラン (15ml) 中、6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンゾキサジン-4-オン (1.13g、2.56mmol) (WO 02/48115の実施例2Dに従って調製) の溶液に、3-アミノ-3-メチル-チエタン (ステップ3の生成物) (0.66g、6.40mmol) を加え、そして、その混合物を、50℃で48時間加熱し、その後、還流温度で12時間加熱する。冷ました反応混合物を、水中に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を、水及び塩水で洗浄し、乾燥させ (Na_2SO_4)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の生成物を、フラッシュ・クロマトグラフィー (酢酸エチル/ヘキサン1:2) によって精製して、白色の固体として560mg (40%

10

20

30

40

50

) の表題化合物を得る (m.p. 238~241°C)。

【0123】

【化29】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 10.19 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.10 (s, 2H), 6.39 (s, 1H), 3.63 (d, 2H), 2.98 (d, 2H), 2.09 (s, 3H), 1.68 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー ES⁺): 544, 546 ($\text{M}+\text{H}$)⁺。

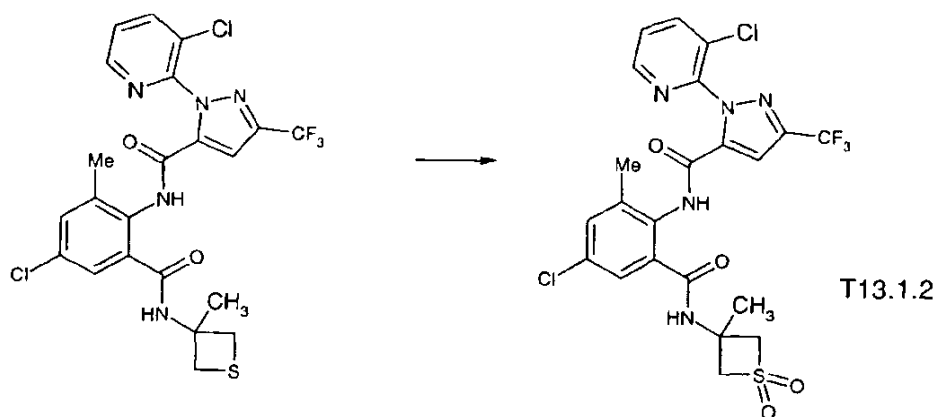
10

【0124】

ステップ5: 化合物T13.1.2 (2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(3-メチル-1,1-ジオキソ-1 λ^6 -チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド) の調製:

【0125】

【化30】



20

30

【0126】

ジクロロメタン (10ml) 中、2-(3-クロロピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(3-メチル-チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド (ステップ4の生成物、150mg、0.275mmol) の溶液に、m-クロロ過安息香酸 (143mg、0.579mmol) を加え、そして、その混合物を、室温にて1時間攪拌する。反応混合物を、ある程度濃縮し、酢酸エチル中に溶かし、有機層を飽和 Na_2CO_3 水溶液 (3x) 及び塩水で洗浄し、乾燥させ (Na_2SO_4)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の生成物を、フラッシュ・クロマトグラフィー (酢酸エチル) によって精製して、白色の固体として78mg (49%) の表題化合物T13.1.2を得る。m.p. 168~171°C。

【0127】

【化31】

40

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 9.61 (s, 1H), 8.48 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.25-7.22 (2xs, 2H), 6.72 (s, 1H), 4.38 (d, 2H), 4.09 (d, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.75 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー ES⁺): 576, 578 ($\text{M}+\text{H}$)⁺。

【0128】

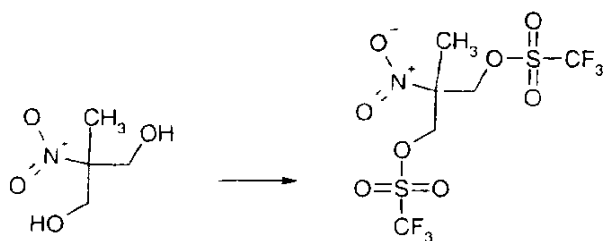
50

実施例P2：化合物T44.1.2の調製：

ステップ1：2-メチル-2-ニトロ-1,3-プロパンジオール・ジトリフラーートの調製：

【0129】

【化32】



10

【0130】

クロロホルム (50ml) 中、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 (16.5ml、0.1mol) の溶液に、添加中に0℃～5℃の温度を確保するために外部冷却しながら、クロロホルム (50 ml) 中、2-メチル-2-ニトロ-1,3-プロパンジオール (6.75g、0.05mol)、及びピリジン (8.85ml、0.11mol) の溶液を加える。添加後に、冷却浴を取り外し、反応物を、外気温にて18時間攪拌する。反応混合物を、分液漏斗に移し、そして、水で洗浄する。有機層を、乾燥させ (Na₂SO₄)、濾過し、そして、蒸発乾固する。未精製の生成物を、溶出液としてヘキサン：酢酸エチルの4：1の混合物を使用したクロマトグラフィーによって精製する；50～52℃の融点を有する固体として生成物を得る。

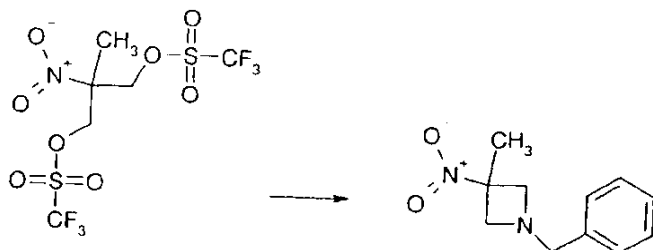
20

【0131】

ステップ2：3-メチル-3-ニトロ-N-ベンジルアゼチジンの調製：

【0132】

【化33】



30

【0133】

アセトニトリル (70ml) 中、2-メチル-2-ニトロ-1,3-プロパンジオール・ジトリフラーート [ステップ1の生成物] (4.0g、10mmol) の溶液を0℃～5℃に冷やし、そして、N-エチル-ジイソプロピルアミン (3.23g、25mmol) を加え、それに続いて、ベンジルアミン (1.60g、15mmol) を加え、そして、その混合物を、80℃の温度にて12時間攪拌する。減圧下で濃縮した、冷ました反応混合物を、酢酸エチル中に溶解し、そして、分液漏斗に移す。次に、これを、水 (2×) 及び塩水で洗浄し、乾燥させ (Na₂SO₄)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の液体生成物を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。未精製の生成物を、溶出液としてヘキサン：酢酸エチルの3：1の混合物を使用したクロマトグラフィーによって精製する；オイルとして生成物を得る。

40

【0134】

【化 3 4】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 7.3 (m, 5H), 3.75 (d, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.42 (d, 2H), 1.88 (s, 3H)。

【0 1 3 5】

ステップ3: 3-アミノ-3-メチル-N-ベンジルアゼチジンの調製:

【0 1 3 6】

10

【化 3 5】



【0 1 3 7】

酢酸エチル (370ml) 及び5%の酢酸 (370ml) 中、3-メチル-3-ニトロ-N-ベンジルアゼチジン [ステップ2の生成物] (3.9g, 18.9mmol) の溶液を、還流温度に加熱する。鉄粉末 (5.25g, 94.1mmol) を、分割して5分おきに加える。添加が完了した後に、反応混合物を、還流温度にて6時間加熱する。冷ました反応混合物を、Hyfloを通して濾過し、そして、残渣を、酢酸エチルで洗浄する。濾液を、分液漏斗に移し、そして、有機層を、分離し、そして、捨てる。水層を、氷冷しながら、30%のNaOH溶液で処理して、約11のpHを得る。次に、ジクロロメタンを加え、そして、その混合物を、外気温にて10分間、激しく攪拌する。この混合物をHyfolを通して濾過し、濾液を分液漏斗に移し、そして、有機層を、分離し、乾燥させ (Na_2SO_4)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の油状生成物 (2.30g, 69%) を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

20

【0 1 3 8】

30

【化 3 6】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 7.2 (m, 5H), 3.62 (s, 2H), 3.27 (d, 2H), 2.88 (d, 2H), 1.68 (bs, 2H), 1.4 (s, 3H)。

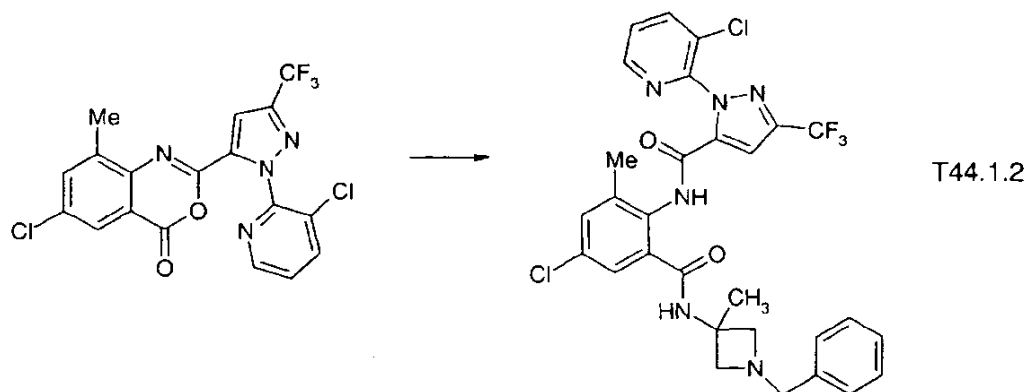
【0 1 3 9】

ステップ4: 化合物T44.1.2 (2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(3-メチル-N-ベンジルアゼチジン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド) の調製:

40

【0 1 4 0】

【化 3 7】



10

【0141】

テトラヒドロフラン (10ml) 中、6-クロロ-2- [1- (3-クロロ-2-ピリジニル) -3- (トリフルオロメチル) -1H-ピラゾール-5-イル] -8-メチル-4H-3,1-ベンゾキサジン-4-オン (353mg、0.8mmol) [WO 02/48115の実施例2Dに従って調製] の溶液に、3-アミノ-3-メチル-N-ベンジルアゼチジン [ステップ3の生成物] (176mg、0.8mmol) を加え、そして、その混合物を、外気温にて18時間攪拌する。反応混合物を濃縮し、そして、未精製の生成物をフラッシュ・クロマトグラフィー (酢酸エチル) によって精製して、白色の固体として 250mg (45%) の表題化合物T44.1.2を得た。m.p. 127~130°C。

20

【0142】

【化 3 8】

¹H-NMR (CDCl₃): 10.4 (s, 1H), 8.4 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.4 (dd, 1H), 7.26 (m, 5H), 7.1 (d, 2H), 6.5 (s, 1H), 3.5 (s, 2H), 3.35 (d, 2H), 3.07 (d, 2H), 2.1 (s, 3H), 1.57 (s, 3H)。

30

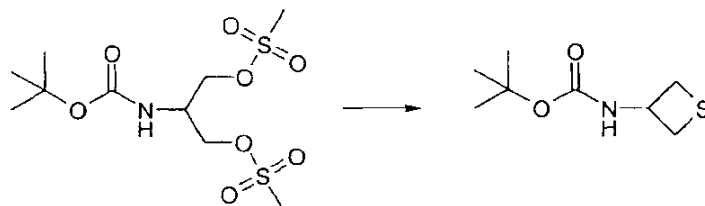
【0143】

実施例P3：化合物T9.1.1の調製：

ステップ1：N- (tert-ブチルオキシカルボニル) -3-チエタンアミンの調製：

【0144】

【化 3 9】



40

【0145】

エタノール (375ml) 中、N- (tert-ブチロキシカルボニル) -2-アミノ-1,3-プロパンジオール・ジメシラート [E. Benoist et al., Synthesis 1998, (8), 1113-1118に従って調製] (25g、72.0mmol) の溶液を、硫化ナトリウム (Na₂S · xH₂O 32~38%、16.82g、~75.4mmol) で処理し、その混合物を50°C (浴槽60°C) の温度にて45分間攪拌する。冷ま

50

した反応混合物を減圧下で濃縮し、そして、固体残渣を、水中に注ぎ入れ、 Et_2O で抽出し、合わせた有機層を、塩水で洗浄し、乾燥させ (Na_2SO_4)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の固体生成物 (12.6g、92%) を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

【0146】

ステップ2: 3-チエタンアミン臭化水素酸塩の調製:

【0147】

【化40】



10

【0148】

酢酸 (11.0ml、62.7mmol) 中、HBrの5.7M溶液を、 -20°C に冷やしたジエチルエーテル (250ml) 中、N-(tert-ブチルオキシカルボニル)-3-チエタンアミン [ステップ1の生成物] (9.17g、48.5mmol) の溶液に滴下して加え、そして、その混合物を、 -20°C にて10分間攪拌する。冷却浴を取り外し、そして、反応物を外気温にて3時間攪拌した。得られた白色の懸濁液を、濾過し、そして、残渣をジエチルエーテルで洗浄して、生成物 (6.0g) の第一クロップを得た。エーテル濾液を濃縮し、そして、残渣を、同じ反応条件に再度晒し、そして、ワークアップして、さらに1.3gの生成物を得た。186~190 $^\circ\text{C}$ の融点もつ未精製の固体生成物 (7.3g、89%) を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

20

【0149】

【化41】

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO): 8.23 (br s, 3H), 4.52 (m, 1H), 3.47 (m, 2H), 3.18 (m, 2H)。

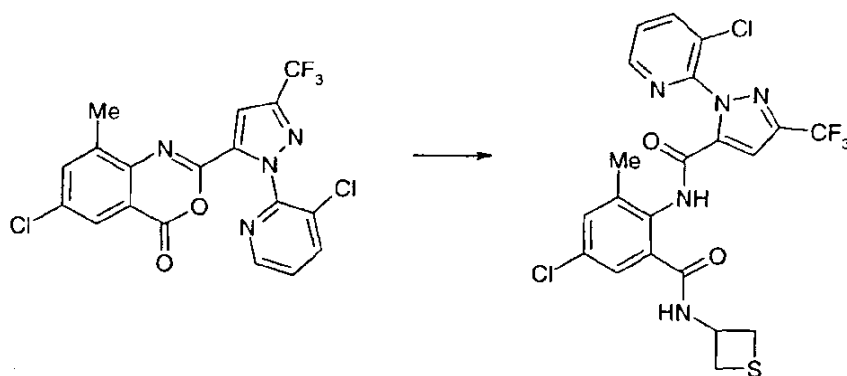
30

【0150】

ステップ3: 2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミドの調製:

【0151】

【化42】



40

【0152】

50

テトラヒドロフラン (10ml) 中、6-クロロ-2-[1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-5-イル]-8-メチル-4H-3,1-ベンゾキサジン-4-オン (500mg, 1.13mmol) [WO 02/48115の実施例2Dに従って調製] の溶液に、トリエチルアミン (0.4ml, 2.87mmol) 及び3-チエタンアミン臭化水素酸塩 [ステップ2の生成物] (250mg, 1.47mmol) を加え、そして、その混合物を、還流温度で一晩加熱する。冷ました反応混合物を、水中に注ぎ入れ、酢酸エチルで抽出し、合わせた有機層を、水及び塩水で洗浄し、乾燥させ (Na_2SO_4)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の生成物を、フラッシュ・クロマトグラフィー (酢酸エチル/ヘキサン 1:2) によって精製して、白色の固体として250mg (41%) の表題化合物を得た。

【0153】

【化43】

10

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 9.94 (s, 1H), 8.48 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.29 (s, 2H), 7.24 (s, 1H), 6.53 (d, 1H), 5.31 (m, 1H), 3.41 (m, 2H), 3.33 (m, 2H), 2.18 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー ES⁺): 530, 532 ($\text{M}+\text{H}$)⁺.

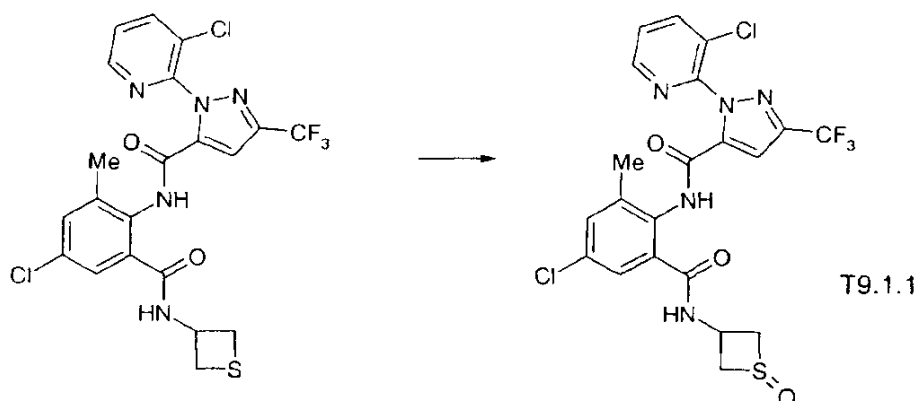
【0154】

ステップ4: 化合物T9.1.1 (2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(1-オキソ-1 λ^4 -チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド) の調製:

【0155】

【化44】

20



30

【0156】

0°Cにて、ジクロロメタン (10ml) 中、2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-5-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド [ステップ3の生成物] (200mg, 0.377mmol) の溶液に、ジクロロメタン (2ml) 中、m-クロロ過安息香酸 (93mg, 0.377mmol) を滴下して加える。0°Cにて40分間の攪拌後に、さらに10mgのm-クロロ過安息香酸が反応を完了するために必要である。反応混合物を、 NaHCO_3 飽和水溶液で処理し、そして、ジクロロメタンで抽出し、合わせた有機層を、塩水で洗浄し、乾燥させ (Na_2SO_4)、濾過し、そして、濃縮する。未精製の生成物を、フラッシュ・クロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製して、白色の固体として50mg (24%) の表題化合物T9.1.1を得た。m.p. 241~244°C。(主なジアステレオマーを、T9.1.1ジアステレオマーAと呼んだ)。

40

50

【0157】

【化45】

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO): 10.38 (s, 1H), 8.91 (d, 1H), 8.54 (d, 1H), 8.23 (d, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.95 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 2.20 (s, 3H);

MS (エレクトロスプレー ES⁺): 546, 548 (M+H)⁺.

【0158】

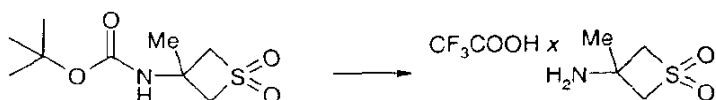
10

実施例P4: 化合物T13.1.22の調製:

ステップ1: 1,1-ジオキソ-3-メチル-3-チエタンアミン・トリフルオロ酢酸塩の調製:

【0159】

【化46】



20

【0160】

0°Cにて、ジクロロメタン (20ml) 中、N-(tert-ブチルオキシカルボニル)-1,1-ジオキソ-3-メチル-3-チエタンアミン [実施例P3のステップ1及び実施例P1のステップ5と同じように調製] (1.7g、7.2mmol) の溶液を、トリフルオロ酢酸 (13ml) で処理し、そして、反応混合物を外気温にて一晩撹拌する。その混合物を、減圧下で濃縮し、ジエチルエーテル中に懸濁した固形残渣を、撹拌型し、濾過し、そして、乾燥させる。208~210°Cの融点を有する未精製の固体生成物 (1.4g、78%) を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

【0161】

30

【化47】

$^1\text{H-NMR}$ (d_6 -DMSO): 8.82 (br s, 3H), 4.56 (d, 2H), 4.29 (d, 2H), 1.68 (s, 3H)。

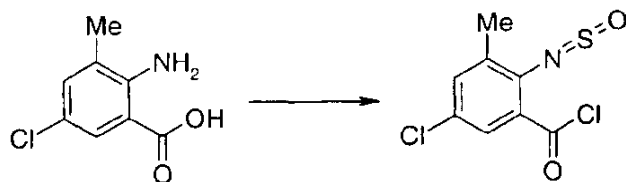
【0162】

ステップ2: 5-クロロ-3-メチル-2-スルフィニルアミノベンゾイル・クロライドの調製

【0163】

40

【化48】



50

【0164】

J. Garin et al., Tetrahedron Lett. 1991, 32, 3263-3264と同じように：

トルエン（200ml）中、2-アミノ-5-クロロ-3-メチル安息香酸（18.5g、100mmol）の懸濁液に、塩化チオニル（36ml、500mmol）を加え、そして、その混合物を、還流温度に加熱し、急激なガス放出が減速するまでその温度にて攪拌する。得られた溶液を、減圧下で濃縮して、高真空下で乾燥させた固体残渣を得た。未精製の固体生成物（23.7g、95%）を、次のステップでさらなる精製なしに使用する。

【0165】

【化49】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8.07 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 2.30 (s, 3H)。

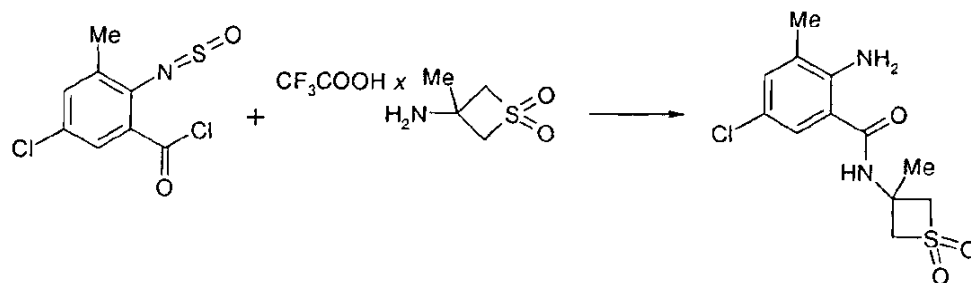
10

【0166】

ステップ3：2-アミノ-5-クロロ-3-メチル-N-（3-メチル-1,1-ジオキソ-1 λ^6 -チエタン-3-イル）-ベンズアミドの調製

【0167】

【化50】



20

【0168】

0～5℃に冷やした、テトラヒドロフラン（6ml）中、1,1-ジオキソ-3-メチル-3-チエタンアミン・トリフルオロ酢酸塩〔ステップ1の生成物〕（598mg、2.40mmol）及びトリエチルアミン（0.836ml、6.00mmol）の溶液に、テトラヒドロフラン（4ml）中、5-クロロ-3-メチル-2-スルフィニルアミノベンゾイル・クロライド〔ステップ2の生成物〕（600mg、2.4mmol）の溶液を加える。反応混合物を、室温にて一晩攪拌し、次に、水中に注ぎ入れる。酢酸エチルで抽出した後に、合わせた有機層を、塩水で洗浄し、乾燥させ（ Na_2SO_4 ）、濾過し、そして、濃縮する。未精製の生成物を、シリカゲルによるカラム・クロマトグラフィー（酢酸エチル／ヘキサン 1：4）によって精製して、79～82℃の融点を有する白色の固体として表題のベンズアミド〔表Dからの化合物D54〕（410mg、56%）を得る。

30

【0169】

【化51】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 7.20 (s, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.52 (s, 1H), 5.58 (br s, 2H), 4.64 (d, 2H), 4.15 (d, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.87 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー ES $^+$) : 303, 305 ($(\text{M}+\text{H})^+$)。

40

【0170】

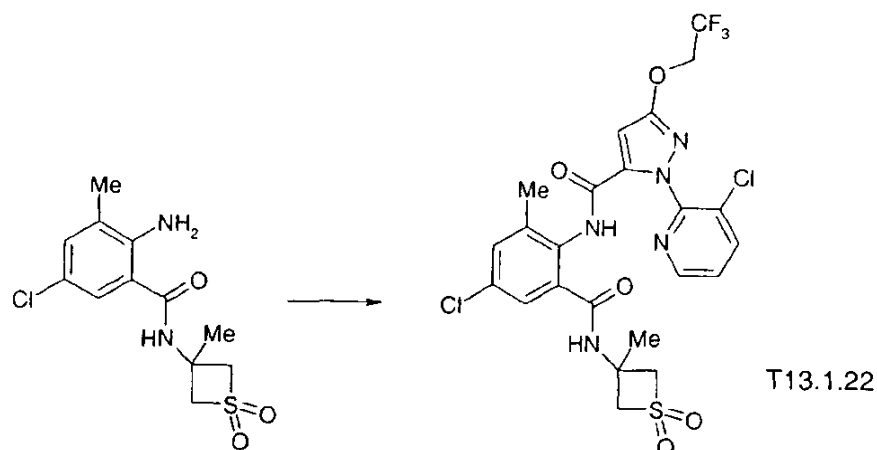
ステップ4：化合物T13.1.22（2-（3-クロロ-ピリジン-2-イル）-5-（2,2,2-トリフルオ

50

ロエトキシ)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸 [4-クロロ-2-メチル-6-(3-メチル-1,1-ジオキソ-1λ⁶-チエタン-3-イルカルバモイル)-フェニル]-アミド)の調製:

【0171】

【化52】



10

【0172】

0~5℃に冷やしたテトラヒドロフラン (6ml) 中、2-アミノ-5-クロロ-3-メチル-N-(3-メチル-1,1-ジオキソ-1λ⁶-チエタン-3-イル)ベンズアミド [ステップ3の生成物] (340 mg、1.12mmol) の溶液に、テトラヒドロフラン (4ml) 中、2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-5-(2,2,2-トリフルオロ-エトキシ)-2H-ピラゾール-3-カルボニル・クロライド (1.12mmol、1eq) の溶液を加える。反応混合物を、室温にて一晩攪拌し、そして、溶媒を真空中で留去した。未精製の生成物を、シリカゲルによるカラム・クロマトグラフィー (グラジエント 酢酸エチル/ヘキサン 1:4→1:1) によって精製して、250℃より高い融点を有する白色の固体として表題のビスアミド化合物T13.1.22 (279mg、41%) を得る。

20

【0173】

【化53】

30

¹H-NMR (CDCl₃): 10.05 (s, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.38 (dd, 1H), 7.29 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 4.69 (q, 2H), 4.54 (d, 2H), 4.08 (d, 2H), 2.22 (s, 3H), 1.76 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー ES⁺): 606, 608 ((M+H)⁺).

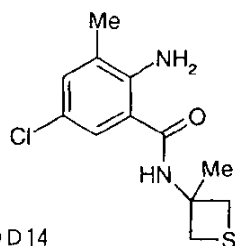
【0174】

実施例P5: 表Dの中からの化合物D₁₄の調製: (2-アミノ-5-クロロ-3-メチル-N-(3-メチル-チエタン-3-イル)ベンズアミド)

40

【0175】

【化 5 4】



表DからのD14

10

【0176】

このベンズアミドを、実施例P4のステップ2及び実施例P1のステップ3の出発物質から実施例P4のステップ3と同じように調製して、92～94℃の融点を有する白色の固体を得る。

【0177】

【化 5 5】

¹H-NMR (CDCl₃): 7.14 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.09 (s, 1H), 5.57 (br s, 2H), 3.90 (d, 2H), 3.03 (d, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.83 (s, 3H); MS (エレクトロスプレー ES+) : 271, 273 ((M+H)⁺).

20

【0178】

実施例 P6：表Cの中からの化合物C13の調製：（2,2-ジメチル-チエタン-3-イルアミン）

【0179】

【化 5 6】



表CからのC13

30

【0180】

メタノール（200ml）中、2,2-ジメチル-チエタン-3-オン [W. Luettke et al., Chemische Berichte 1977, 110, 1421-31に従って調製]（8.9g、76.6mmol）の溶液に、酢酸アンモニウム（59g、765mmol）及びシアノ水素化ホウ素ナトリウム（7.8g、118.7mmol）を加え、そして、反応混合物を還流温度で2時間加熱する。冷ました反応混合物を、窒素でフラッシュし、（10℃未満の温度を維持しながら）濃塩酸でpH2に酸性化し、そして、減圧下で濃縮する。残渣を、水中に注ぎ入れ、ジエチルエーテル（2×）で抽出し、水相のpHを30%の水酸化ナトリウムでpH11に調整し、そして、生成物をジエチルエーテルで抽出する。合わせた有機層を、塩水で洗浄し、乾燥させ（Na₂SO₄）、濾過し、そして、濃縮する。未精製の油状の生成物（1.47g、16%）を、さらなる精製なしに使用する。

40

【0181】

【化 5 7】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 3.83 (dd, 1H), 3.19 (t, 1H), 2.95 (t, 1H), 1.63 (br s, 2H), 1.50 (s, 3H), 1.42 (s, 3H)。

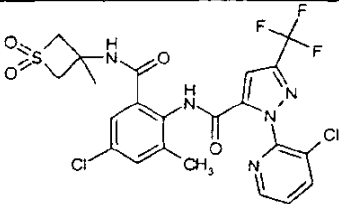
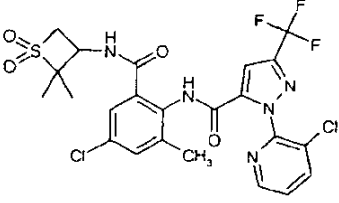
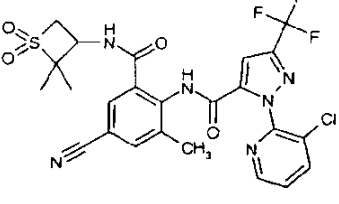
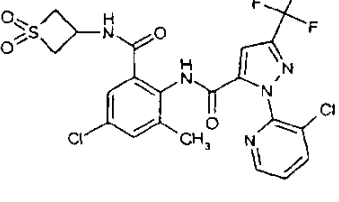
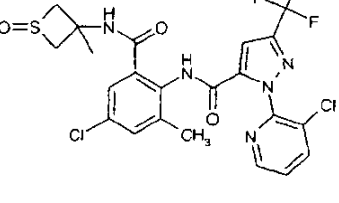
【0 1 8 2】

以下の表Pに列挙する化合物を、先に記載の手順と同じように調製することができる (m.p.= $^{\circ}\text{C}$ 単位の融点)。

表P：式 (I) によって表される化合物：

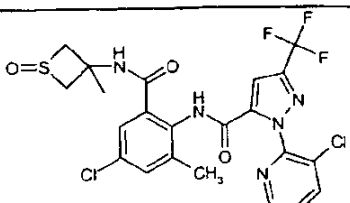
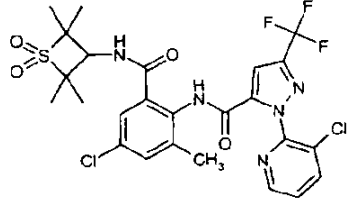
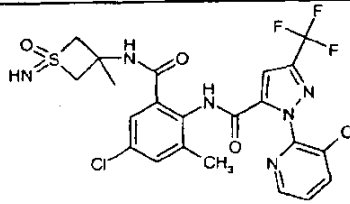
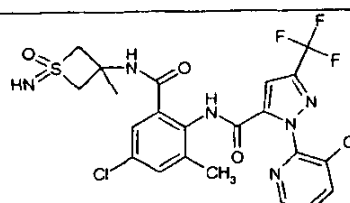
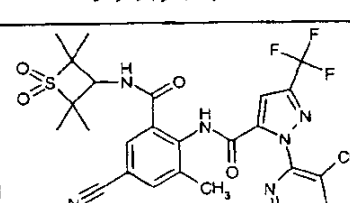
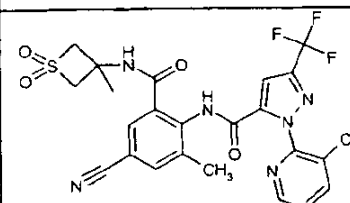
【0 1 8 3】

【表 1 1】

	化合物番号	構造	物理データ
	T13.1.2		m.p. 168-171
	T15.1.1		m.p. 161-163
	T15.1.91		m.p. 198-200
	T13.1.1		238-241
	T9.1.2	 ジアステレオマーA	m.p. 239-241

【0 1 8 4】

【表 1 2】

	化合物番号	構造	物理データ
	T9.1.2	 ジアステレオマーB	m.p. 263-265
	T16.1.1	 ジアステレオマーA	m.p. >250, MS (ES ⁺): 618, 620 (M+H) ⁺
	T17.1.2	 ジアステレオマーB	m.p. 153-155
	T17.1.2	 ジアステレオマーB	m.p. 216-220
	T16.1.91	 ジアステレオマーB	m.p. >250, MS (ES ⁺): 609, 611 (M+H) ⁺
	T13.1.92	 ジアステレオマーB	m.p. 231-235

【表 1 3】

	化合物番号	構造	物理データ
	T13.1.361		m.p. 242-244
	T13.1.391		m.p. 218
	T13.1.91		m.p. 160-163
	T13.1.6		m.p. 156-158
	T13.1.96		m.p. 157-158
	T44.1.2		m.p. 127-130
	T13.1.8		固体, MS (ES+): 600, 602, 604 (M+H) ⁺

【0186】

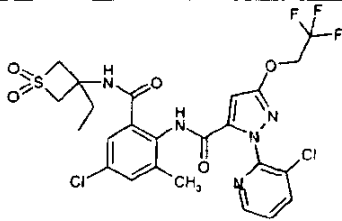
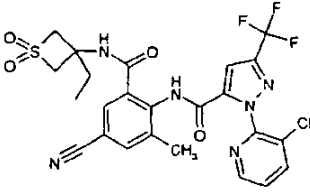
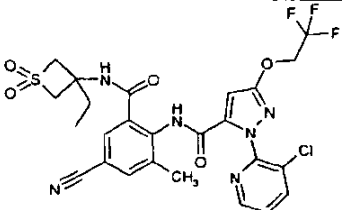
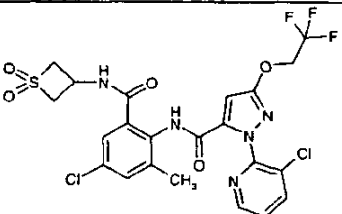
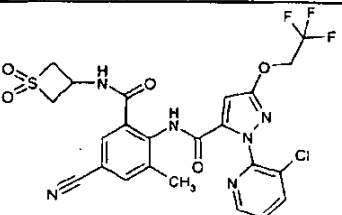
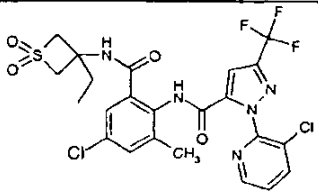
10

20

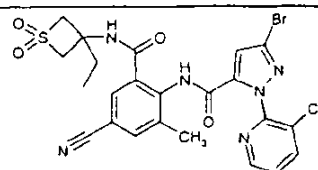
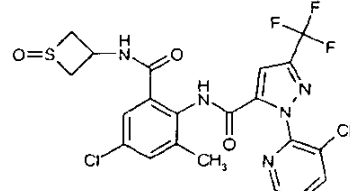
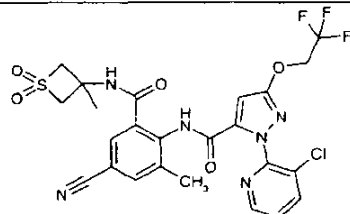
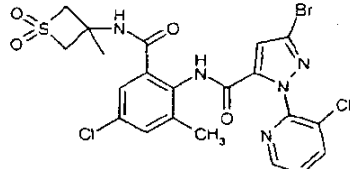
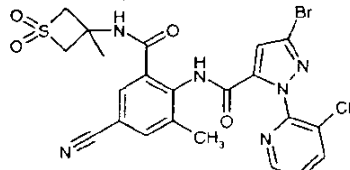
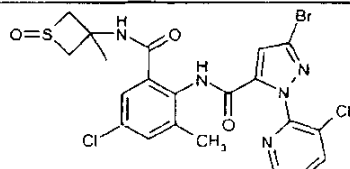
30

40

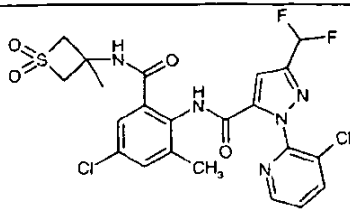
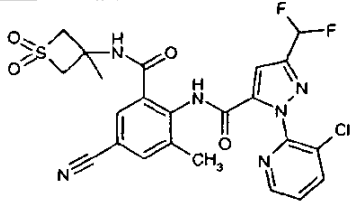
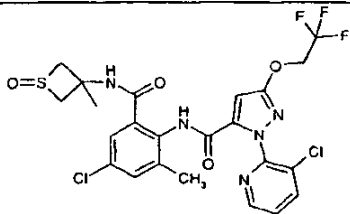
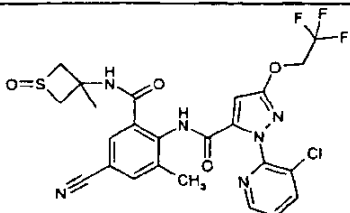
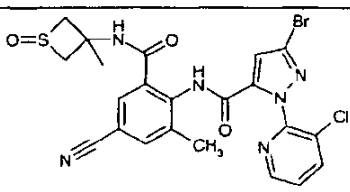
【表 1 4】

	化合物番号	構造	物理データ
	T13.1.23		m.p. 263-267
	T13.1.93		m.p. 249-252
	T13.1.113		m.p. 240-242
	T13.1.21		m.p. 179-181
	T13.1.111		m.p. 158-160
	T13.1.3		m.p. 234-236

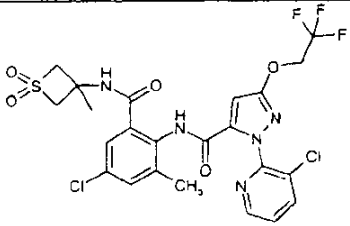
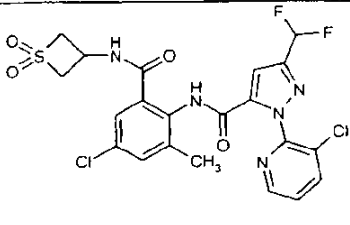
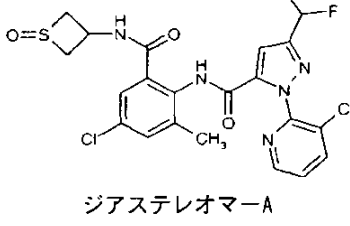
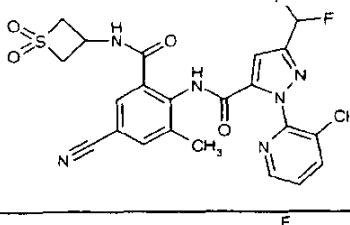
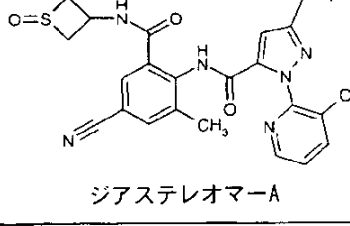
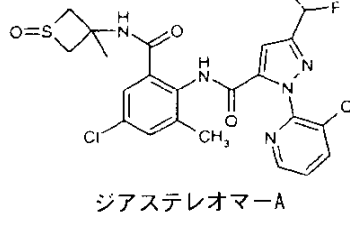
【表 15】

	化合物番号	構造	物理データ
	T13.1.98		固体, MS (ES+): 591, 593, 595 (M+H) ⁺
	T9.1.1	 ジアステレオマーA	m.p. 241-244
	T13.1.112		m.p. 216-219
	T13.1.7		m.p. 191-193
	T13.1.97		m.p. >250, MS (ES+): 577, 579, 581 (M+H) ⁺
	T9.1.7	 ジアステレオマーA	m.p. 244-247

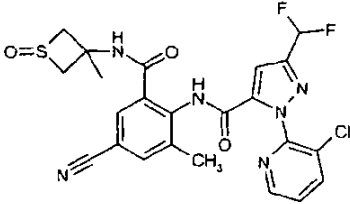
【表 1 6】

	化合物番号	構造	物理データ
	T13.1.422		m.p. 170-173
	T13.1.432		m.p. 238-241
	T9.1.22	 ジアステレオマーA	m.p. 220-222
	T9.1.112	 ジアステレオマーA	m.p. 223-225
	T9.1.97	 ジアステレオマーA	m.p. 244-249

【表 17】

	化合物番号	構造	物理データ
	T13.1.22		m.p. >250, MS (ES ⁺): 606, 608 (M+H) ⁺
	T13.1.421		m.p.151-155
	T9.1.421	 ジアステレオマーA	m.p.171-173
	T13.1.431		m.p.158-160
	T9.1.431	 ジアステレオマーA	m.p. 230-233
	T9.1.422	 ジアステレオマーA	m.p.169-173

【表 1 8】

	化合物番号	構造	物理データ
	T9.1.432	 ジアステレオマー-A	m.p. 235-237

10

【0191】

以下の実施例は、本発明について例証すること、及び式 (I) によって表されるさらに好ましい化合物を示すことを目的とする。それらが本発明を制限することはない。「Me」はメチル基である。

表A：表1～44に関する置換基の指定：

【0192】

【表 1 9】

20

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.1	Me	Cl	CF ₃	H
A.1.2	Me	Cl	CF ₃	CH ₃
A.1.3	Me	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.4	Me	Cl	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.5	Me	Cl	CF ₃	CF ₃
A.1.6	Me	Cl	Br	H
A.1.7	Me	Cl	Br	CH ₃
A.1.8	Me	Cl	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.9	Me	Cl	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.10	Me	Cl	Br	CF ₃
A.1.11	Me	Cl	Cl	H
A.1.12	Me	Cl	Cl	CH ₃

30

40

【0193】

【表 2 0】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.13	Me	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.14	Me	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.15	Me	Cl	Cl	CF ₃
A.1.16	Me	Cl	OCF ₂ H	H
A.1.17	Me	Cl	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.18	Me	Cl	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.19	Me	Cl	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.20	Me	Cl	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.21	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.22	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.23	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.24	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.25	Me	Cl	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.26	Me	Cl	OCF ₃	H
A.1.27	Me	Cl	OCF ₃	CH ₃
A.1.28	Me	Cl	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.29	Me	Cl	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.30	Me	Cl	OCF ₃	CF ₃
A.1.31	Me	Br	CF ₃	H
A.1.32	Me	Br	CF ₃	CH ₃
A.1.33	Me	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.34	Me	Br	CF ₃	CH ₂ OCH ₃

【 0 1 9 4 】

10

20

30

40

【表 2 1】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.35	Me	Br	CF ₃	CF ₃
A.1.36	Me	Br	Br	H
A.1.37	Me	Br	Br	CH ₃
A.1.38	Me	Br	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.39	Me	Br	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.40	Me	Br	Br	CF ₃
A.1.41	Me	Br	Cl	H
A.1.42	Me	Br	Cl	CH ₃
A.1.43	Me	Br	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.44	Me	Br	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.45	Me	Br	Cl	CF ₃
A.1.46	Me	Br	OCF ₂ H	H
A.1.47	Me	Br	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.48	Me	Br	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.49	Me	Br	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.50	Me	Br	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.51	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.52	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.53	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.54	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.55	Me	Br	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.56	Me	Br	OCF ₃	H

【0 1 9 5】

10

20

30

40

【表 2 2】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.57	Me	Br	OCF ₃	CH ₃
A.1.58	Me	Br	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.59	Me	Br	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.60	Me	Br	OCF ₃	CF ₃
A.1.61	Me	F	CF ₃	H
A.1.62	Me	F	CF ₃	CH ₃
A.1.63	Me	F	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.64	Me	F	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.65	Me	F	CF ₃	CF ₃
A.1.66	Me	F	Br	H
A.1.67	Me	F	Br	CH ₃
A.1.68	Me	F	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.69	Me	F	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.70	Me	F	Br	CF ₃
A.1.71	Me	F	Cl	H
A.1.72	Me	F	Cl	CH ₃
A.1.73	Me	F	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.74	Me	F	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.75	Me	F	Cl	CF ₃
A.1.76	Me	F	OCF ₂ H	H
A.1.77	Me	F	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.78	Me	F	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃

【0 1 9 6】

10

20

30

40

【表 2 3】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.79	Me	F	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.80	Me	F	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.81	Me	F	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.82	Me	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.83	Me	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.84	Me	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.85	Me	F	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.86	Me	F	OCF ₃	H
A.1.87	Me	F	OCF ₃	CH ₃
A.1.88	Me	F	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.89	Me	F	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.90	Me	F	OCF ₃	CF ₃
A.1.91	Me	CN	CF ₃	H
A.1.92	Me	CN	CF ₃	CH ₃
A.1.93	Me	CN	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.94	Me	CN	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.95	Me	CN	CF ₃	CF ₃
A.1.96	Me	CN	Br	H
A.1.97	Me	CN	Br	CH ₃
A.1.98	Me	CN	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.99	Me	CN	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.100	Me	CN	Br	CF ₃

【0 1 9 7】

【表 2 4】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.101	Me	CN	Cl	H
A.1.102	Me	CN	Cl	CH ₃
A.1.103	Me	CN	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.104	Me	CN	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.105	Me	CN	Cl	CF ₃
A.1.106	Me	CN	OCF ₂ H	H
A.1.107	Me	CN	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.108	Me	CN	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.109	Me	CN	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.110	Me	CN	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.111	Me	CN	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.112	Me	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.113	Me	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.114	Me	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.115	Me	CN	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.116	Me	CN	OCF ₃	H
A.1.117	Me	CN	OCF ₃	CH ₃
A.1.118	Me	CN	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.119	Me	CN	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.120	Me	CN	OCF ₃	CF ₃
A.1.121	Cl	Cl	CF ₃	H
A.1.122	Cl	Cl	CF ₃	CH ₃

【0 1 9 8】

【表 2 5】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.123	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.124	Cl	Cl	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.125	Cl	Cl	CF ₃	CF ₃
A.1.126	Cl	Cl	Br	H
A.1.127	Cl	Cl	Br	CH ₃
A.1.128	Cl	Cl	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.129	Cl	Cl	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.130	Cl	Cl	Br	CF ₃
A.1.131	Cl	Cl	Cl	H
A.1.132	Cl	Cl	Cl	CH ₃
A.1.133	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.134	Cl	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.135	Cl	Cl	Cl	CF ₃
A.1.136	Cl	Cl	OCF ₂ H	H
A.1.137	Cl	Cl	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.138	Cl	Cl	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.139	Cl	Cl	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.140	Cl	Cl	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.141	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.142	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.143	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.144	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃

【0 1 9 9】

10

20

30

40

【表 2 6】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.145	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.146	Cl	Cl	OCF ₃	H
A.1.147	Cl	Cl	OCF ₃	CH ₃
A.1.148	Cl	Cl	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.149	Cl	Cl	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.150	Cl	Cl	OCF ₃	CF ₃
A.1.151	Cl	Br	CF ₃	H
A.1.152	Cl	Br	CF ₃	CH ₃
A.1.153	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.154	Cl	Br	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.155	Cl	Br	CF ₃	CF ₃
A.1.156	Cl	Br	Br	H
A.1.157	Cl	Br	Br	CH ₃
A.1.158	Cl	Br	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.159	Cl	Br	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.160	Cl	Br	Br	CF ₃
A.1.161	Cl	Br	Cl	H
A.1.162	Cl	Br	Cl	CH ₃
A.1.163	Cl	Br	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.164	Cl	Br	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.165	Cl	Br	Cl	CF ₃
A.1.166	Cl	Br	OCF ₂ H	H

【0 2 0 0】

10

20

30

40

【表 2 7】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.167	Cl	Br	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.168	Cl	Br	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.169	Cl	Br	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.170	Cl	Br	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.171	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.172	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.173	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.174	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.175	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.176	Cl	Br	OCF ₃	H
A.1.177	Cl	Br	OCF ₃	CH ₃
A.1.178	Cl	Br	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.179	Cl	Br	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.180	Cl	Br	OCF ₃	CF ₃
A.1.181	Cl	F	CF ₃	H
A.1.182	Cl	F	CF ₃	CH ₃
A.1.183	Cl	F	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.184	Cl	F	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.185	Cl	F	CF ₃	CF ₃
A.1.186	Cl	F	Br	H
A.1.187	Cl	F	Br	CH ₃
A.1.188	Cl	F	Br	CH ₂ CH ₃

【 0 2 0 1 】

【表 2 8】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.189	Cl	F	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.190	Cl	F	Br	CF ₃
A.1.191	Cl	F	Cl	H
A.1.192	Cl	F	Cl	CH ₃
A.1.193	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.194	Cl	F	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.195	Cl	F	Cl	CF ₃
A.1.196	Cl	F	OCF ₂ H	H
A.1.197	Cl	F	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.198	Cl	F	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.199	Cl	F	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.200	Cl	F	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.201	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.202	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.203	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.204	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.205	Cl	F	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.206	Cl	F	OCF ₃	H
A.1.207	Cl	F	OCF ₃	CH ₃
A.1.208	Cl	F	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.209	Cl	F	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.210	Cl	F	OCF ₃	CF ₃

【0 2 0 2】

10

20

30

40

【表 2 9】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.211	Cl	CN	CF ₃	H
A.1.212	Cl	CN	CF ₃	CH ₃
A.1.213	Cl	CN	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.214	Cl	CN	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.215	Cl	CN	CF ₃	CF ₃
A.1.216	Cl	CN	Br	H
A.1.217	Cl	CN	Br	CH ₃
A.1.218	Cl	CN	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.219	Cl	CN	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.220	Cl	CN	Br	CF ₃
A.1.221	Cl	CN	Cl	H
A.1.222	Cl	CN	Cl	CH ₃
A.1.223	Cl	CN	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.224	Cl	CN	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.225	Cl	CN	Cl	CF ₃
A.1.226	Cl	CN	OCF ₂ H	H
A.1.227	Cl	CN	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.228	Cl	CN	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.229	Cl	CN	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.230	Cl	CN	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.231	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.232	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₃

【 0 2 0 3 】

10

20

30

40

【表 3 0】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.233	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.234	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.235	Cl	CN	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.236	Cl	CN	OCF ₃	H
A.1.237	Cl	CN	OCF ₃	CH ₃
A.1.238	Cl	CN	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.239	Cl	CN	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.240	Cl	CN	OCF ₃	CF ₃
A.1.241	Br	Cl	CF ₃	H
A.1.242	Br	Cl	CF ₃	CH ₃
A.1.243	Br	Cl	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.244	Br	Cl	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.245	Br	Cl	CF ₃	CF ₃
A.1.246	Br	Cl	Br	H
A.1.247	Br	Cl	Br	CH ₃
A.1.248	Br	Cl	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.249	Br	Cl	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.250	Br	Cl	Br	CF ₃
A.1.251	Br	Cl	Cl	H
A.1.252	Br	Cl	Cl	CH ₃
A.1.253	Br	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.254	Br	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃

【 0 2 0 4 】

10

20

30

40

【表 3 1】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.255	Br	Cl	Cl	CF ₃
A.1.256	Br	Cl	OCF ₂ H	H
A.1.257	Br	Cl	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.258	Br	Cl	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.259	Br	Cl	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.260	Br	Cl	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.261	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.262	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.263	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.264	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.265	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.266	Br	Cl	OCF ₃	H
A.1.267	Br	Cl	OCF ₃	CH ₃
A.1.268	Br	Cl	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.269	Br	Cl	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.270	Br	Cl	OCF ₃	CF ₃
A.1.271	Br	Br	CF ₃	H
A.1.272	Br	Br	CF ₃	CH ₃
A.1.273	Br	Br	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.274	Br	Br	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.275	Br	Br	CF ₃	CF ₃
A.1.276	Br	Br	Br	H

【0 2 0 5】

10

20

30

40

【表 3 2】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.277	Br	Br	Br	CH ₃
A.1.278	Br	Br	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.279	Br	Br	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.280	Br	Br	Br	CF ₃
A.1.281	Br	Br	Cl	H
A.1.282	Br	Br	Cl	CH ₃
A.1.283	Br	Br	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.284	Br	Br	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.285	Br	Br	Cl	CF ₃
A.1.286	Br	Br	OCF ₂ H	H
A.1.287	Br	Br	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.288	Br	Br	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.289	Br	Br	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.290	Br	Br	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.291	Br	Br	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.292	Br	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.293	Br	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.294	Br	Br	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.295	Br	Br	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.296	Br	Br	OCF ₃	H
A.1.297	Br	Br	OCF ₃	CH ₃
A.1.298	Br	Br	OCF ₃	CH ₂ CH ₃

【0 2 0 6】

10

20

30

40

【表 3 3】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.299	Br	Br	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.300	Br	Br	OCF ₃	CF ₃
A.1.301	Br	F	CF ₃	H
A.1.302	Br	F	CF ₃	CH ₃
A.1.303	Br	F	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.304	Br	F	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.305	Br	F	CF ₃	CF ₃
A.1.306	Br	F	Br	H
A.1.307	Br	F	Br	CH ₃
A.1.308	Br	F	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.309	Br	F	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.310	Br	F	Br	CF ₃
A.1.311	Br	F	Cl	H
A.1.312	Br	F	Cl	CH ₃
A.1.313	Br	F	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.314	Br	F	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.315	Br	F	Cl	CF ₃
A.1.316	Br	F	OCF ₂ H	H
A.1.317	Br	F	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.318	Br	F	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.319	Br	F	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.320	Br	F	OCF ₂ H	CF ₃

【0 2 0 7】

10

20

30

40

【表 3 4】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.321	Br	F	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.322	Br	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.323	Br	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.324	Br	F	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.325	Br	F	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.326	Br	F	OCF ₃	H
A.1.327	Br	F	OCF ₃	CH ₃
A.1.328	Br	F	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.329	Br	F	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.330	Br	F	OCF ₃	CF ₃
A.1.331	Br	CN	CF ₃	H
A.1.332	Br	CN	CF ₃	CH ₃
A.1.333	Br	CN	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.334	Br	CN	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.335	Br	CN	CF ₃	CF ₃
A.1.336	Br	CN	Br	H
A.1.337	Br	CN	Br	CH ₃
A.1.338	Br	CN	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.339	Br	CN	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.340	Br	CN	Br	CF ₃
A.1.341	Br	CN	Cl	H
A.1.342	Br	CN	Cl	CH ₃

【0 2 0 8】

10

20

30

40

【表 3 5】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.343	Br	CN	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.344	Br	CN	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.345	Br	CN	Cl	CF ₃
A.1.346	Br	CN	OCF ₂ H	H
A.1.347	Br	CN	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.348	Br	CN	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.349	Br	CN	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.350	Br	CN	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.351	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.352	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.353	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.354	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.355	Br	CN	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.356	Br	CN	OCF ₃	H
A.1.357	Br	CN	OCF ₃	CH ₃
A.1.358	Br	CN	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.359	Br	CN	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.360	Br	CN	OCF ₃	CF ₃
A.1.361	Me	H	CF ₃	H
A.1.362	Me	H	CF ₃	CH ₃
A.1.363	Me	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.364	Me	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₃

【 0 2 0 9 】

10

20

30

40

【表 3 6】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.365	Me	H	CF ₃	CF ₃
A.1.366	Me	H	Br	H
A.1.367	Me	H	Br	CH ₃
A.1.368	Me	H	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.369	Me	H	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.370	Me	H	Br	CF ₃
A.1.371	Me	H	Cl	H
A.1.372	Me	H	Cl	CH ₃
A.1.373	Me	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.374	Me	H	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.375	Me	H	Cl	CF ₃
A.1.376	Me	H	OCF ₂ H	H
A.1.377	Me	H	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.378	Me	H	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃
A.1.379	Me	H	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.380	Me	H	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.381	Me	H	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.382	Me	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.383	Me	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.384	Me	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.385	Me	H	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.386	Me	H	OCF ₃	H

【 0 2 1 0 】

10

20

30

40

【表 3 7】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.387	Me	H	OCF ₃	CH ₃
A.1.388	Me	H	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.389	Me	H	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.390	Me	H	OCF ₃	CF ₃
A.1.391	Cl	H	CF ₃	H
A.1.392	Cl	H	CF ₃	CH ₃
A.1.393	Cl	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.394	Cl	H	CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.395	Cl	H	CF ₃	CF ₃
A.1.396	Cl	H	Br	H
A.1.397	Cl	H	Br	CH ₃
A.1.398	Cl	H	Br	CH ₂ CH ₃
A.1.399	Cl	H	Br	CH ₂ OCH ₃
A.1.400	Cl	H	Br	CF ₃
A.1.401	Cl	H	Cl	H
A.1.402	Cl	H	Cl	CH ₃
A.1.403	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A.1.404	Cl	H	Cl	CH ₂ OCH ₃
A.1.405	Cl	H	Cl	CF ₃
A.1.406	Cl	H	OCF ₂ H	H
A.1.407	Cl	H	OCF ₂ H	CH ₃
A.1.408	Cl	H	OCF ₂ H	CH ₂ CH ₃

【0 2 1 1】

10

20

30

40

【表 3 8】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.409	Cl	H	OCF ₂ H	CH ₂ OCH ₃
A.1.410	Cl	H	OCF ₂ H	CF ₃
A.1.411	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	H
A.1.412	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₃
A.1.413	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.414	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.415	Cl	H	OCH ₂ CF ₃	CF ₃
A.1.416	Cl	H	OCF ₃	H
A.1.417	Cl	H	OCF ₃	CH ₃
A.1.418	Cl	H	OCF ₃	CH ₂ CH ₃
A.1.419	Cl	H	OCF ₃	CH ₂ OCH ₃
A.1.420	Cl	H	OCF ₃	CF ₃
A.1.421	Me	Cl	CHF ₂	H
A.1.422	Me	Cl	CHF ₂	CH ₃
A.1.423	Me	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.424	Me	Cl	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.425	Me	Cl	CHF ₂	CF ₃
A.1.426	Me	Br	CHF ₂	H
A.1.427	Me	Br	CHF ₂	CH ₃
A.1.428	Me	Br	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.429	Me	Br	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.430	Me	Br	CHF ₂	CF ₃

【 0 2 1 2 】

【表 3 9】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.431	Me	CN	CHF ₂	H
A.1.432	Me	CN	CHF ₂	CH ₃
A.1.433	Me	CN	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.434	Me	CN	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.435	Me	CN	CHF ₂	CF ₃
A.1.436	Cl	Cl	CHF ₂	H
A.1.437	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₃
A.1.438	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.439	Cl	Cl	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.440	Cl	Cl	CHF ₂	CF ₃
A.1.441	Cl	Br	CHF ₂	H
A.1.442	Cl	Br	CHF ₂	CH ₃
A.1.443	Cl	Br	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.444	Cl	Br	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.445	Cl	Br	CHF ₂	CF ₃
A.1.446	Cl	CN	CHF ₂	H
A.1.447	Cl	CN	CHF ₂	CH ₃
A.1.448	Cl	CN	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.449	Cl	CN	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.450	Cl	CN	CHF ₂	CF ₃
A.1.451	Br	Cl	CHF ₂	H
A.1.452	Br	Cl	CHF ₂	CH ₃

【 0 2 1 3 】

10

20

30

40

【表 4 0】

系列	R ₉₁	R ₉₂	R ₉₃	R ₃₅
A.1.453	Br	Cl	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.454	Br	Cl	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.455	Br	Cl	CHF ₂	CF ₃
A.1.456	Br	Br	CHF ₂	H
A.1.457	Br	Br	CHF ₂	CH ₃
A.1.458	Br	Br	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.459	Br	Br	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.460	Br	Br	CHF ₂	CF ₃
A.1.461	Br	CN	CHF ₂	H
A.1.462	Br	CN	CHF ₂	CH ₃
A.1.463	Br	CN	CHF ₂	CH ₂ CH ₃
A.1.464	Br	CN	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃
A.1.465	Br	CN	CHF ₂	CF ₃

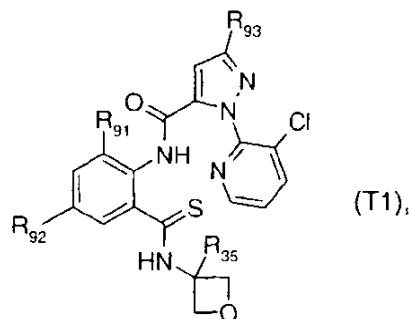
10

20

【 0 2 1 4 】

表1：この表は、以下の式：

【化 5 8】



40

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 (variables) R₉₁、R₉₂、R₉₃、及びR₃₅のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列に定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T1.1.1～T1.1.465を開示する。

【 0 2 1 5 】

例えば、特定の化合物T1.1.23は、式 (T1) {式中、可変部R₉₁、R₉₂、R₉₃、及びR₃₅の

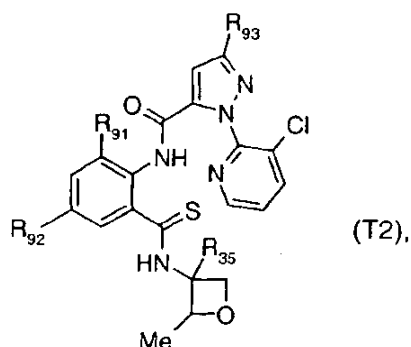
50

それぞれが、表Aの系列A.1.23に定められた特定の意味をもつ。} によって表される化合物である。同じシステムに従って、表1に開示する他の359個の特定の化合物のすべて、並びに表2～44に開示する特定の化合物のすべてもまた、同じように指定する。

【0216】

表2：この表は、以下の式：

【化59】



10

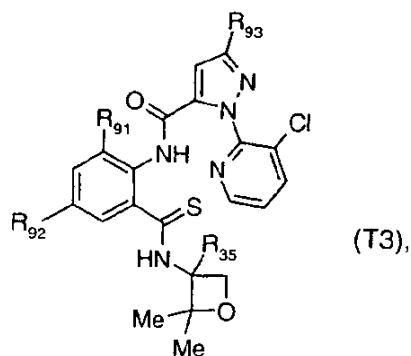
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T2.1.1～T2.1.465を開示する。

20

【0217】

表3：この表は、以下の式：

【化60】



30

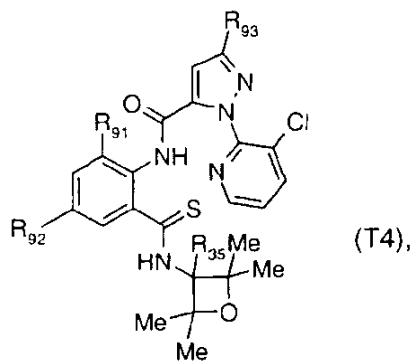
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T3.1.1～T3.1.465を開示する。

40

【0218】

表4：この表は、以下の式：

【化 6 1】



10

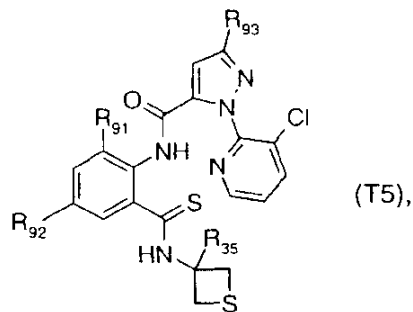
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T4.1.1～T4.1.465を開示する。

【0 2 1 9】

表5：この表は、以下の式：

20

【化 6 2】



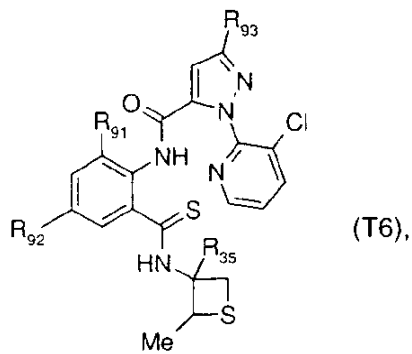
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T5.1.1～T5.1.465を開示する。

【0 2 2 0】

表6：この表は、以下の式：

【化 6 3】



10

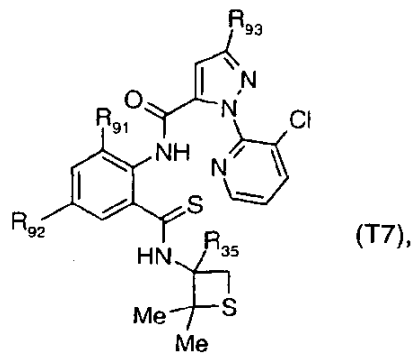
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T6.1.1～T6.1.465を開示する。

【0 2 2 1】

表7：この表は、以下の式：

20

【化 6 4】



30

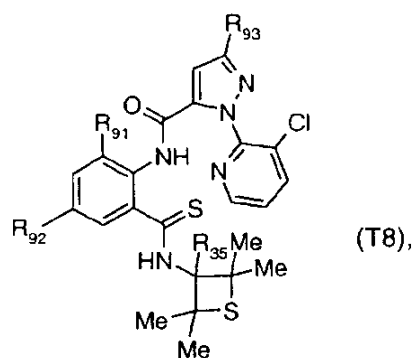
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T7.1.1～T7.1.465を開示する。

【0 2 2 2】

表8：この表は、以下の式：

40

【化 6 5】



10

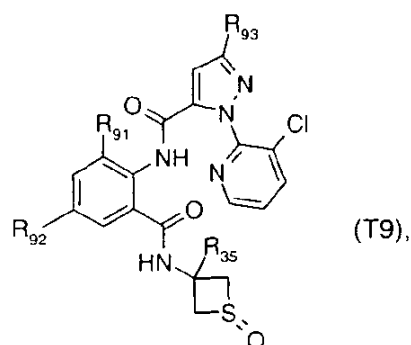
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T8.1.1～T8.1.465を開示する。

【0 2 2 3】

表9：この表は、以下の式：

20

【化 6 6】



30

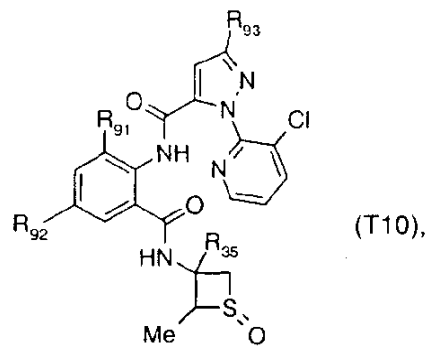
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T9.1.1～T9.1.465を開示する。

【0 2 2 4】

表10：この表は、以下の式：

40

【化 6 7】



10

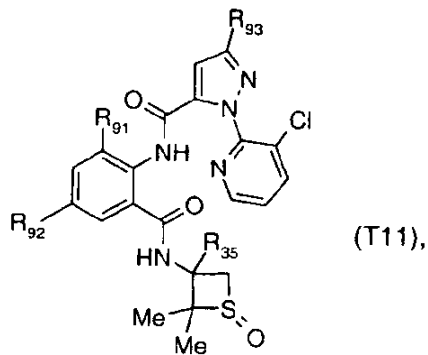
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T10.1.1～T10.1.465を開示する。

【 0 2 2 5】

表11：この表は、以下の式：

【化 6 8】

20



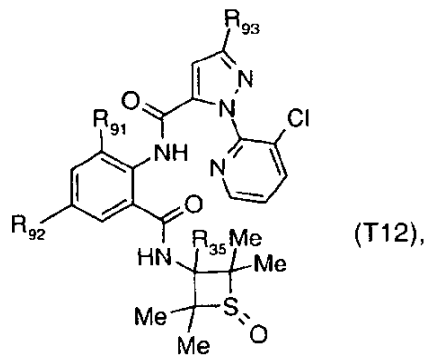
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T11.1.1～T11.1.465を開示する。

【 0 2 2 6】

表12：この表は、以下の式：

【化 6 9】



10

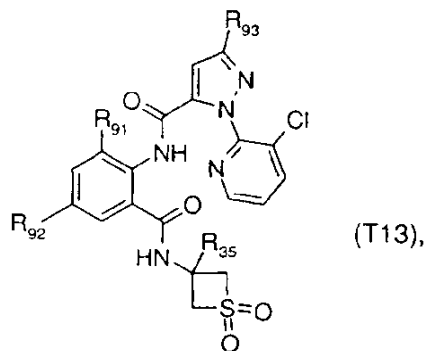
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T12.1.1～T12.1.465を開示する。

【 0 2 2 7】

表13：この表は、以下の式：

【化 7 0】

20



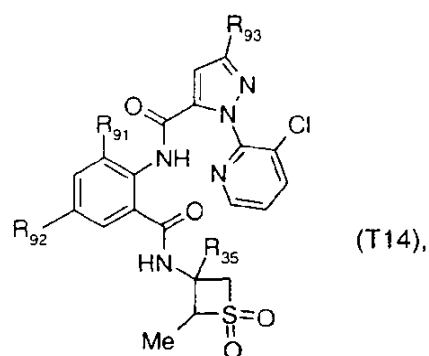
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T13.1.1～T13.1.465を開示する。

【 0 2 2 8】

表14：この表は、以下の式：

【化 7 1】



10

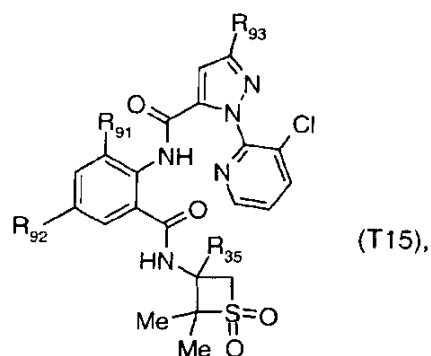
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T14.1.1～T14.1.465を開示する。

【0 2 2 9】

表15：この表は、以下の式：

20

【化 7 2】



30

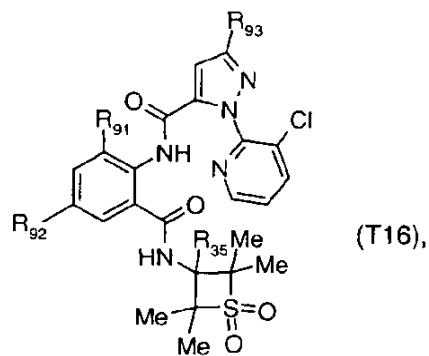
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T15.1.1～T15.1.465を開示する。

【0 2 3 0】

表16：この表は、以下の式：

40

【化 7 3】



10

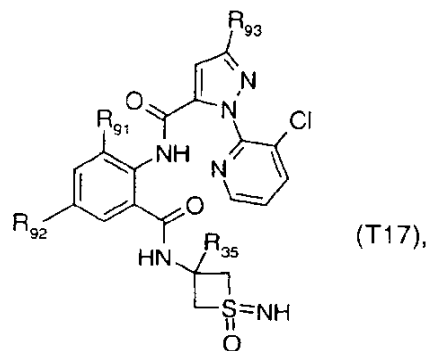
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T16.1.1～T16.1.465を開示する。

【 0 2 3 1】

表17：この表は、以下の式：

20

【化 7 4】



30

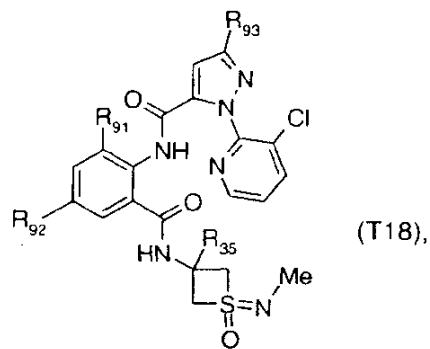
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T17.1.1～T17.1.465を開示する。

【 0 2 3 2】

表18：この表は、以下の式：

40

【化 7 5】



10

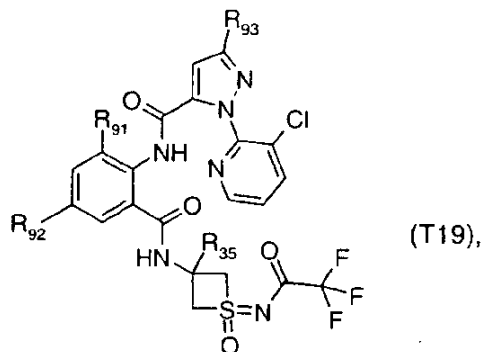
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T18.1.1～T18.1.465を開示する。

【 0 2 3 3 】

表19：この表は、以下の式：

20

【化 7 6】



30

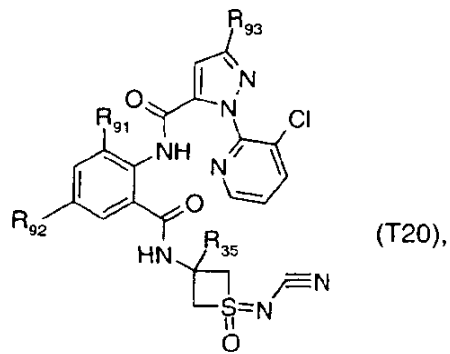
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T19.1.1～T19.1.465を開示する。

【 0 2 3 4 】

表20：この表は、以下の式：

40

【化 7 7】



10

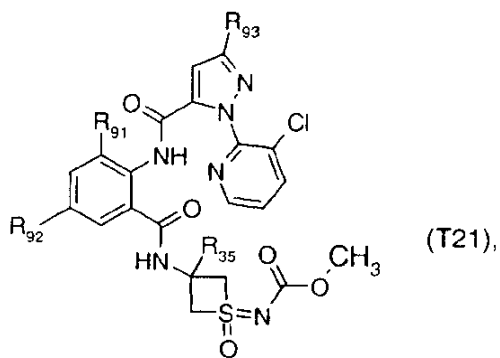
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T20.1.1～T20.1.465を開示する。

【 0 2 3 5】

表21：この表は、以下の式：

【化 7 8】

20



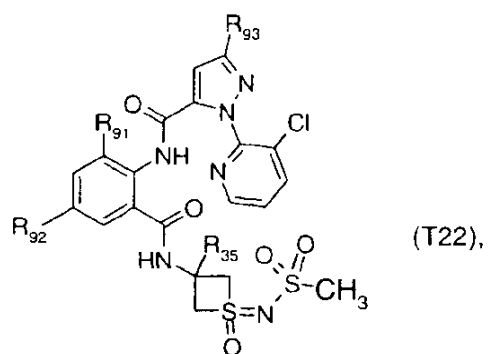
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T21.1.1～T21.1.465を開示する。

【 0 2 3 6】

表22：この表は、以下の式：

【化 7 9】



10

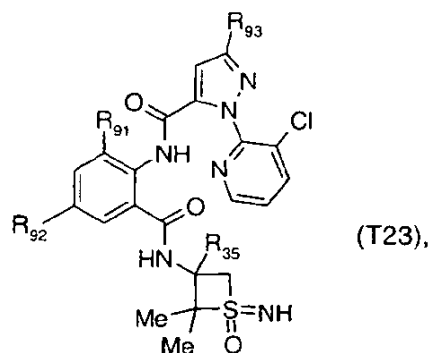
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T22.1.1～T22.1.465を開示する。

【 0 2 3 7】

表23：この表は、以下の式：

【化 8 0】

20



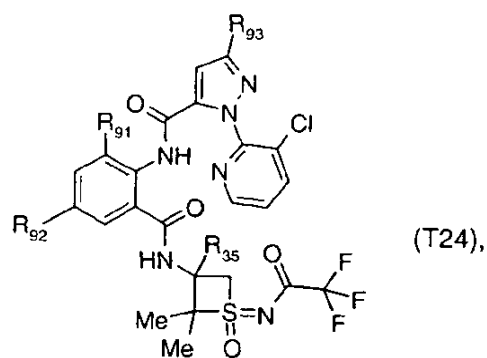
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T23.1.1～T23.1.465を開示する。

【 0 2 3 8】

表24：この表は、以下の式：

【化 8 1】



10

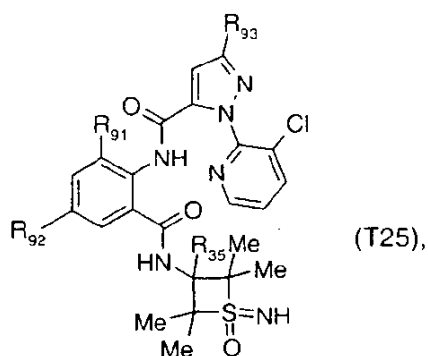
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T24.1.1～T24.1.465を開示する。

【0 2 3 9】

表25：この表は、以下の式：

20

【化 8 2】



30

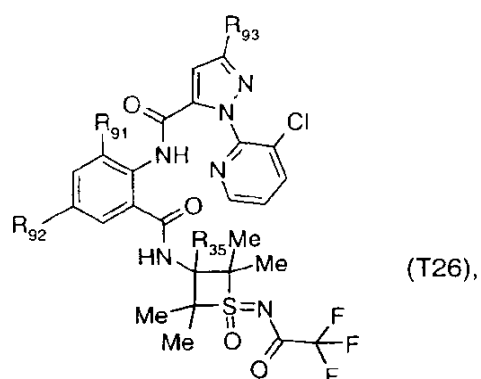
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T25.1.1～T25.1.465を開示する。

【0 2 4 0】

表26：この表は、以下の式：

40

【化 8 3】



10

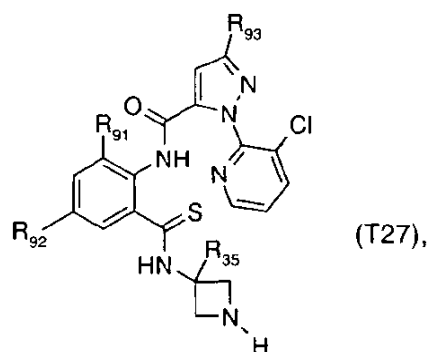
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T26.1.1～T26.1.465を開示する。

【 0 2 4 1 】

表27：この表は、以下の式：

20

【化 8 4】



30

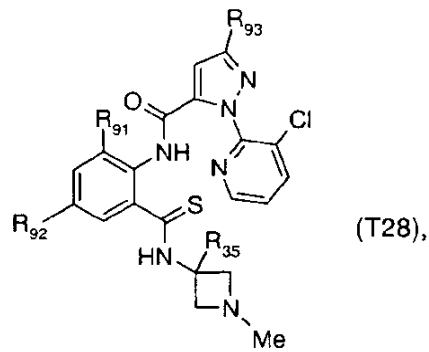
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T27.1.1～T27.1.465を開示する。

【 0 2 4 2 】

表28：この表は、以下の式：

40

【化 8 5】



10

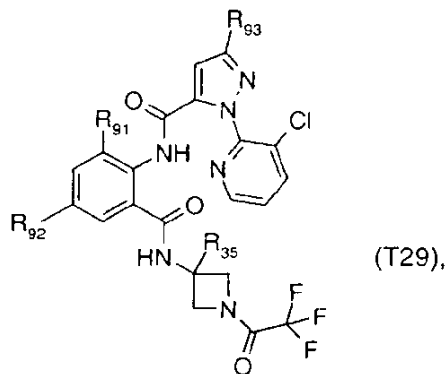
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T28.1.1～T28.1.465を開示する。

【 0 2 4 3】

表29：この表は、以下の式：

【化 8 6】

20



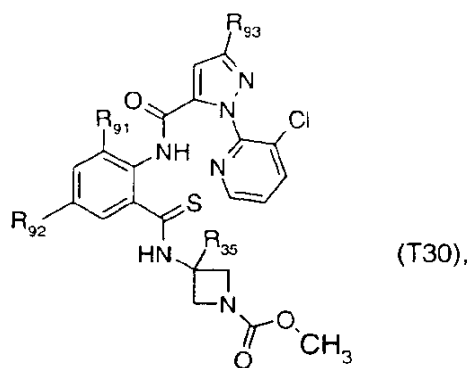
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T29.1.1～T29.1.465を開示する。

【 0 2 4 4】

表30：この表は、以下の式：

【化 8 7】



10

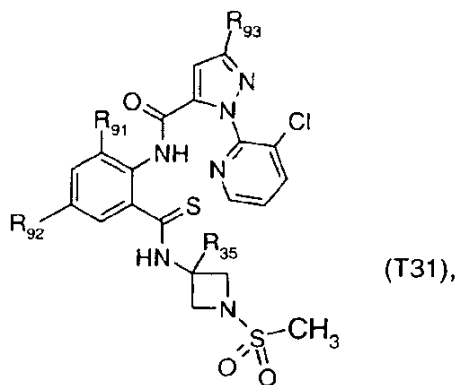
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T30.1.1～T30.1.465を開示する。

【 0 2 4 5】

表31：この表は、以下の式：

20

【化 8 8】



30

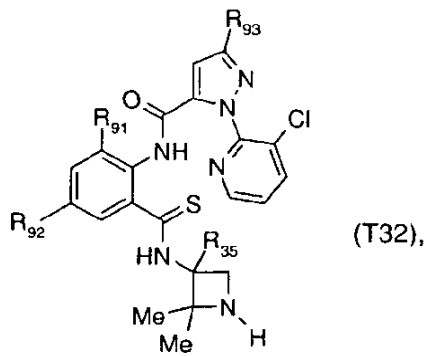
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T31.1.1～T31.1.465を開示する。

【 0 2 4 6】

表32：この表は、以下の式：

40

【化 8 9】



10

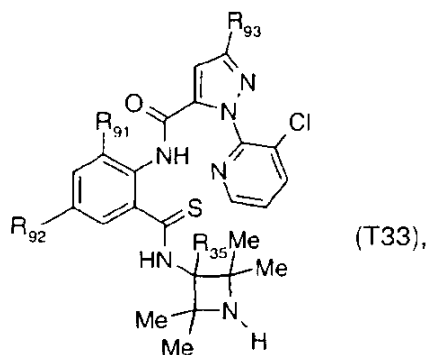
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部R₉₁、R₉₂、R₉₃、及びR₃₅のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T32.1.1～T32.1.465を開示する。

【 0 2 4 7】

表33：この表は、以下の式：

【化 9 0】

20



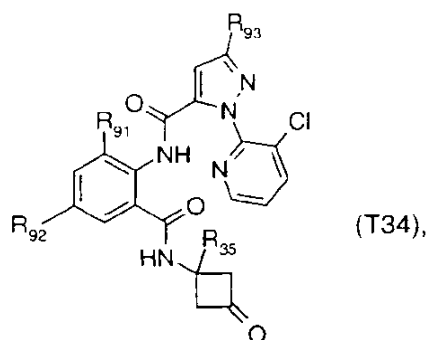
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部R₉₁、R₉₂、R₉₃、及びR₃₅のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T33.1.1～T33.1.465を開示する。

【 0 2 4 8】

表34：この表は、以下の式：

【化 9 1】



10

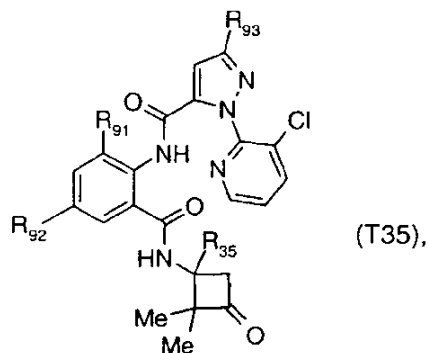
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T34.1.1～T34.1.465を開示する。

【 0 2 4 9】

表35：この表は、以下の式：

【化 9 2】

20



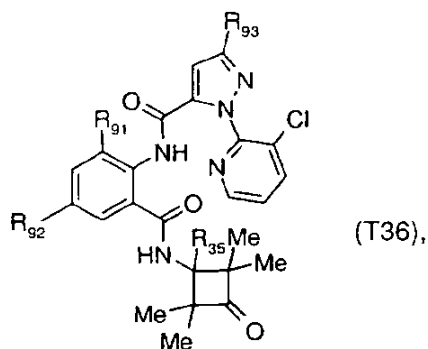
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T35.1.1～T35.1.465を開示する。

【 0 2 5 0】

表36：この表は、以下の式：

【化 9 3】



10

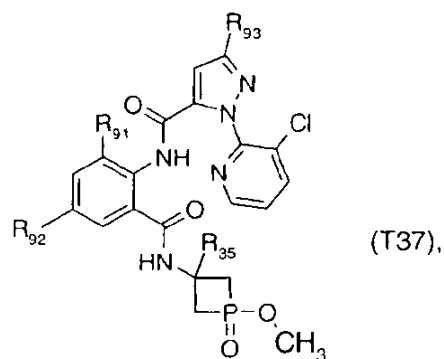
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T36.1.1～T36.1.465を開示する。

【 0 2 5 1】

表37：この表は、以下の式：

20

【化 9 4】



30

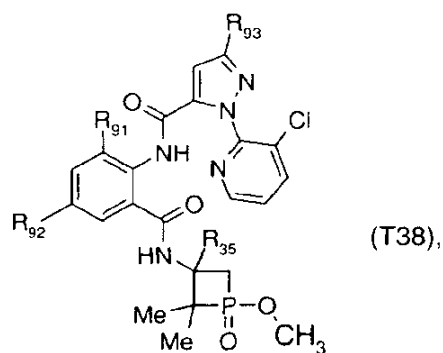
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T37.1.1～T37.1.465を開示する。

【 0 2 5 2】

表38：この表は、以下の式：

40

【化 9 5】



10

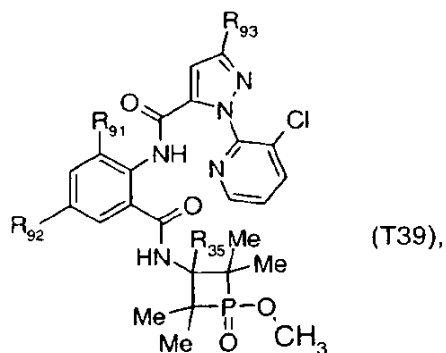
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T38.1.1～T38.1.465を開示する。

【0 2 5 3】

表39：この表は、以下の式：

20

【化 9 6】



30

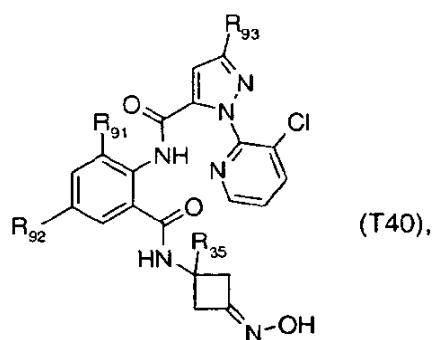
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T39.1.1～T39.1.465を開示する。

【0 2 5 4】

表40：この表は、以下の式：

40

【化 9 7】



10

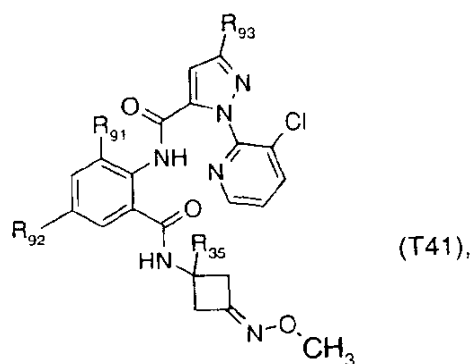
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T40.1.1～T40.1.465を開示する。

【 0 2 5 5】

表41：この表は、以下の式：

【化 9 8】

20



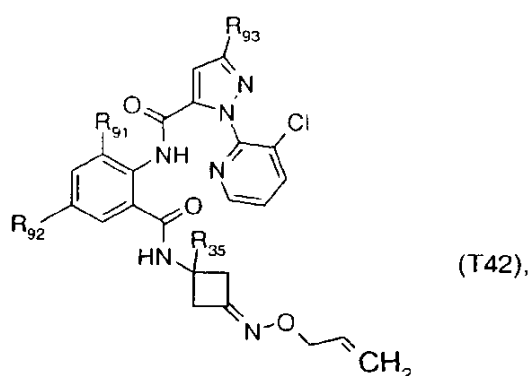
30

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T41.1.1～T41.1.465を開示する。

【 0 2 5 6】

表42：この表は、以下の式：

【化 9 9】



10

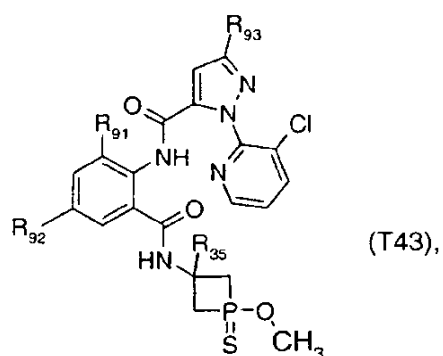
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T42.1.1～T42.1.465を開示する。

【 0 2 5 7】

表43：この表は、以下の式：

20

【化 1 0 0】



30

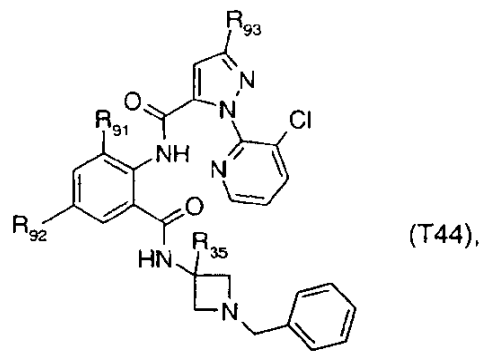
{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T43.1.1～T43.1.465を開示する。

【 0 2 5 8】

表44：この表は、以下の式：

40

【化 1 0 1】



10

{式中、これらの465個の特定の化合物のそれぞれに関して、可変部 R_{91} 、 R_{92} 、 R_{93} 、及び R_{35} のそれぞれが、表Aの465の系列A.1.1～A.1.465の中から適切に選択される、対応する系列において定められた特定の意味をもつ。} によって表される465個の化合物T44.1.1～T44.1.465を開示する。

【 0 2 5 9】

製剤実施例 (%=重量%)

【 0 2 6 0】

20

【表 4 1】

実施例F1：乳剤 (Emulsion concentrates)

	a)	b)	c)
有効成分	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 (36molのE0)	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 (30molのE0)	—	12%	4%
シクロヘキサノン	—	15%	20%
キシレン混合物	65%	25%	20%

30

【 0 2 6 1】

水での希釈によって、あらゆる所望の濃度の乳濁液を、前述の乳剤 (concentrates) から調製することができる。

【 0 2 6 2】

【表 4 2】

実施例F2：溶液剤

	a)	b)	c)	d)
有効成分	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 MW400	—	70%	—	—
メチルピロリド-2-オン	—	20%	—	—
エポキシ化ココナッツ・オイル	—	—	1%	5%
石油エーテル (沸点：160-190°)	—	—	94%	—

40

【 0 2 6 3】

前記溶液剤は、マイクロドロップ (microdrops) の形態での使用に好適である。

【 0 2 6 4】

【表 4 3】

実施例F3：粒剤	a)	b)	c)	d)
有効成分	5%	10%	8%	21%
カオリン	94%	—	79%	54%
高分散性シリカ	1%	—	13%	7%
アタパルジャイト	—	90%	—	18%

【0 2 6 5】

10

前記有効成分を、ジクロロメタン中に溶かし、その溶液を担体上にスプレーし、それに続いて、溶媒を真空中で留去する。

【0 2 6 6】

【表 4 4】

実施例F4：粉剤	a)	b)
有効成分	2%	5%
高分散性シリカ	1%	5%
タルク	97%	—
カオリン	—	90%

20

【0 2 6 7】

使用準備済みの粉剤を、担体と有効成分を十分に混合することによって得る。

【0 2 6 8】

【表 4 5】

実施例F5：水和剤	a)	b)	c)
有効成分	25%	50%	75%
リグノスルホナート・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ナート・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	—	2%	—
エーテル (7-8molのEO)	—	2%	—
高分散性シリカ	5%	10%	10%
カオリン	62%	27%	—

30

【0 2 6 9】

有効成分を、添加物と混合し、そして、その混合物を、好適なミルにより完全にすりつぶす。これにより、水で希釈してあらゆる所望の濃度の懸濁液を得ることができる水和剤を得る。

40

【0 2 7 0】

【表 4 6】

実施例F6：押出成形粒剤

有効成分	10%
リグノスルホナート・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%

【0 2 7 1】

有効成分を、添加物と混合し、その混合物をすりつぶし、水で湿らせて、押出成形し、粒状にし、そして、気流中で乾燥させる。

【0 2 7 2】

【表 4 7】

実施例F7：コート粒剤

有効成分	3%
ポリエチレングリコール (MW 200)	3%
カオリン	94%

【0 2 7 3】

ミキサーにより、細かくすりつぶした有効成分を、カオリンに均一に加え、それを、ポリエチレングリコールで湿らせる。これにより、無塵コート粒剤を得る。

【0 2 7 4】

【表 4 8】

実施例F8：ゾル剤

有効成分	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 (15molのEO)	6%
リグノスルホナート・ナトリウム	10%
カルボキシメチルセルロース	1%
37%ホルムアルデヒド水溶液	0.2%
シリコーン油 (75%水性エマルジョン)	0.8%
水	32%

【0 2 7 5】

細かくすりつぶした有効成分を、添加物と十分に混合する。こうして得られたゾル剤 (suspension concentrate) を水で希釈することによって、あらゆる所望の濃度のゾル剤を調製できる。

【0 2 7 6】

他の殺虫性又は殺ダニ性の有効成分を加えることによって、本発明による化合物の活性を、大幅に広げ、且つ、主だった状況に適合させることができる。この有効成分に対する好適な添加物は、例えば、以下の有効成分のクラス：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、ホルマジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバミン酸、ピレトロイド、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、及びバチルス・チューリンゲンシス調製物の代表的なものである。

【0277】

有効成分を伴った式 (I) によって表される化合物の以下の混合物が好まれる。(略語「TX」は、「本発明の表T1～T44に具体的に記載されている化合物から成る群から選択されるある化合物」を意味する)：

石油(代替名)(628)+TXから成る物質群から選択されるアジュバント、

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・ベンゼンスルホナート(IUPAC/ケミカル・アブストラクツ名)(1059)+TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセトアミド(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、アクリナスリン(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(amidithion)(870)+TX、アミドフルメット[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(875)+TX、アミトラズ(24)+TX、アラマイト(881)+TX、三酸化ヒ素(882)+TX、AVI 382(化合物コード)+TX、AZ 60541(化合物コード)+TX、アジンホス-エチル(44)+TX、アジンホス-メチル(45)+TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888)+TX、アゾシクロチン(46)+TX、アゾトアート(azothoate)(889)+TX、ベノミル(62)+TX、ベノキサホス(代替名)[CCN]+TX、ベンゾキシメート(71)+TX、

安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN]+TX、ビフェナゼート(74)+TX、ビフェントリン(76)+TX、ビナパクリル(907)+TX、ブロフェンバレラート(brofenvalerate)(代替名)+TX、ブロモシクレン(918)+TX、ブロモホス(920)+TX、ブロモホス-エチル(921)+TX、ブロモプロピレート(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、カルバノラート(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、キノメチオナート(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・ハイドロクロライド(964)+TX、クロルフェナピル(130)+TX、クロルフェネトール(968)+TX、クロルフェンゾン(970)+TX、クロルフェンスルフィド(chlorfensulphide)(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(chloromebufarm)(977)+TX、

クロロメチウロン(chloromethiuron)(978)+TX、クロルプロピレート(983)+TX、クロルピリホス(145)+TX、クロルピリホス-メチル(146)+TX、クロルチオホス(994)+TX、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、シアントアート(1020)+TX、シフルメトフェン(GAS登録番号:400882-07-7)+TX、シハロスリン(196)+TX、シヘキサチン(199)+TX、サイパーメスリン(201)+TX、DCPM(1032)+TX、DDT(219)+TX、デメフィオン(1037)+TX、デメフィオン-0(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-0(1038)+TX、デメトン-0-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、ダイアジノン(227)+TX、ジクロフルアニド(230)+TX、ジクロルホス(236)+TX、ジクリホス(dicliphos)(代替名)+TX、ジコホール(242)+TX、ジクロトホス(243)+TX、ジエノクトル(dienochtor)(1071)+TX、ジメホキックス(1081)+TX、ジメトエート(262)+TX、ジナクチン(dinactin)(代替名)(653)+TX、ジネクス(1089)+TX、ジネクス-ジクレキシシン(diclexine)(1089)+TX、ジノブトン(269)+TX、ジノキャップ(270)+TX、ジノキャップ-4[CCN]+TX、ジノキャップ-6[CCN]+TX、ジノクトン(1090)+TX、ジノペントン(dinopenton)(1092)+TX、ジノスルホン(dinosulfon)(1097)+TX、ジノテルボン(dinoterbon)(1098

10

20

30

40

50

) +TX、

ジオキサチオン (1102) +TX、ジフェニルスルホン (IUPAC名) (1103) +TX、アンタビュース (代替名) [CCN] +TX、ジスルホトン (278) +TX、DNOC (282) +TX、ドフェナピン (dofenapyn) (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 (endothion) (1121) +TX、EPN (297) +TX、エプリノメクチン (代替名) [CCN] +TX、エチオン (309) +TX、エトアート (ethoate) -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 (fenazaflor) (1147) +TX、フェナザキン (328) +TX、フェンブタンチン・オキシド (330) +TX、フェノチオカルブ (337) +TX、

フェンプロパスリン (342) +TX、フェンピラド (代替名) +TX、フェンピロキシメート (345) +TX、フェンソン (fenson) (1157) +TX、フェントリファニル (fentrifanil) (1161) +TX、フェンバレレート (349) +TX、フィプロニル (354) +TX、フルアクリピリム (360) +TX、フルアズロン (1166) +TX、フルベンジミン (flubenzimine) (1167) +TX、フルシクロクスロン (366) +TX、フルシスリネート (367) +TX、フルエネチル (fluenetil) (1169) +TX、フルフェノクスロン (370) +TX、フルメトリン (372) +TX、フルオルベンシド (fluorbenside) (1174) +TX、フルバリネート (1184) +TX、FMC1137 (開発コード) (1185) +TX、ホルメタネート (405) +TX、ホルメタネート・ハイドロクロライド (405) +TX、ホルモチオン (1192) +TX、ホルンパラナート (formparanate) (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、ヘブテノホス (432) +TX、ヘキサデシル・シクロプロパンカルボキシラート (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) サリチラート (IUPAC名) (473) +TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] TX、ジャスモリン (jasmolin) I (696) +TX、ジャスモリンII (696) +TX、ジョドフェンホス (jodfenphos) (1248) +TX、リンデン (430) +TX、ルフエヌロン (490) +TX、マラソン (492) +TX、マロノベン (malonoben) (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 (methacrifos) (1266) +TX、メタミドホス (527) +TX、メチダチオン (529) +TX、メチオカルブ (530) +TX、メソミル (531) +TX、臭化メチル (537) +TX、メトルカルブ (550) +TX、メビンホス (556) +TX、

メキサカルバート (1290) +TX、ミルベメクチン (557) +TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] +TX、ミパフォックス (1293) +TX、モノクロトホス (561) +TX、モルホチオン (morphothion) (1300) +TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] +TX、ネイルド (567) +TX、NC-184 (化合物コード) +TX、NC-512 (化合物コード) +TX、ニフルリジド (nifluridide) (1309) +TX、ニコマイシン (代替名) [CCN] +TX、ニトリラカルブ (nitrilacarb) (1313) +TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体 (1313) +TX、NNI-0101 (化合物コード) +TX、NNI-0250 (化合物コード) +TX、オメトエート (594) +TX、オキサミル (602) +TX、オキシデプロホス (1324) +TX、オキシジスルホトン (oxydisulfoton) (1325) +TX、

pp'-DDT (219) +TX、パラチオン (615) +TX、パーメスリン (626) +TX、石油 (代替名) (628) +TX、フェンカプトン (1330) +TX、フェントエート (631) +TX、ホレート (636) +TX、ホサロン (637) +TX、ホスホラン (1338) +TX、ホスメット (638) +TX、ホスファミドン (639) +TX、ホキシム (642) +TX、ピリミホス-メチル (652) +TX、ポリクロテルペン (polychloroterpenes) (伝統的な名称) (1347) +TX、ポリナクチン複合体 (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、プロペタムホス (673) +TX、プロポキスル (678) +TX、プロチダチオン (prothidathion) (1360) +TX、プロトアート (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、ピリミタート (1370) +TX、キナルホス (711) +TX、キンチオホス (1381) +TX、R-1492 (

10

20

30

40

50

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 (sophamide) (1402) +TX、スピロジクロフェ
ン (738) +TX、スピロメシフェン (739) +TX、SSI-121 (開発コード) (1404) +TX、スル
フィラム (代替名) [CCN] +TX、スルフルアミド (750) +TX、スルホテップ (753) +TX、
硫黄 (754) +TX、SZI-121 (開発コード) (757) +TX、 τ -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 (terbam) (代替名) +TX、

テトラクロロビンホス (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 (tetrasul) (1425) +TX、チアフェノックス (thiafenox) (代
替名) +TX、チオカルボキシム (thiocarboxime) (1431) +TX、チオファノックス (800
) +TX、チオメトン (801) +TX、チオキノックス (thioquinox) (1436) +TX、ツリンギエ
ンシン (thuringiensin) (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 (triazuron) (代替名) +TX、
トリクロロホン (824) +TX、トリフェノホス (trifenofos) (1455) +TX、トリナクチン
(trinactin) (代替名) (653) +TX、バミドチオン (847) +TX、バニリプロール (vanil
iprole) [CCN] 及びYI-5302 (化合物コード) +TXから成る物質群から選択されるダニ駆
除剤、

ベトキサジン (bethoxazin) [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、トリフェニルスズ (fentin) (347) +TX、消石灰 [CCN
] +TX、ナーバム (566) +TX、キノクラミン (714) +TX、キノナアミド (quinonamid) (1
379) +TX、シマジン (730) +TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347)、及び水酸化
トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) +TXから成る物質群から選択される殺藻剤、

アバメクチン (1) +TX、クルホメート (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・ベンゾアート (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 (selamectin) (代替名) [CCN] +TX、スピノサッド (737) 及びチ
オファナート (1435) +TXから成る物質群からを選択される駆虫剤、

クロラロース (127) +TX、エンドリン (1122) +TX、フェンチオン (346) +TX、ピリ
ジン-4-アミン (IUPAC名) (23) 及びストリキニーネ (745) +TXから成る物質群から選択
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-硫酸ヒドロキシキノリ
ン (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 (dodacin) (1112) +TX、フェンアミノスルフ (1144) +TX
、ホルムアルデヒド (404) +TX、ヒドラールガフェン (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、ビス (ジメチルジチオカルバミン
酸) ニッケル (IUPAC名) (1308) +TX、ニトラピリン (580) +TX、オクチリノン (octhil
inone) (590) +TX、オキシリニック酸 (606) +TX、オキシテトラサイクリン (611) +TX
、カリウム硫酸オキシキノリン (446) +TX、プロベナゾール (658) +TX、ストレプトマイ
シン (744) +TX、ストレプトマイシン・セスキスルファート (sesquisulfate) (744) +T
X、テクロフタラム (766) +TX、及びチオメルサル (thiomersal) (代替名) [CCN] +T
Xから成る物質群から選択される殺菌剤、

リンゴコカクモンハマキ (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、アンブ
リセイウス属 (Amblyseius spp.) (代替名) (19) +TX、アナグラファ・ファルシフェラ
(Anagrapha falcifera) NPV (代替名) (28) +TX、アナグルス・アトムス (Anagrus ato
mus) (代替名) (29) +TX、アブラコバチ (Aphelinus abdominalis) (代替名) (33) +

10

20

30

40

50

TX、コレマンアブラバチ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) +TX、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) +TX、アウトグラファ・カリホルニカ (*Autographa californica*) NPV (代替名) (38) +TX、

バチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) +TX、バチルス・スファエリクス・ネイド (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49) +TX、バチルス・チューリングゲンシス・ベルリネル (*Bacillus thuringiensis* 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 (*aizawai*) (学名) (51) +TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種イスラエレンシス (*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 (*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キ (*kurstaki*) (学名) (51) +TX、バチルス・チューリングゲンシス亜種テネブリオニス (*tenebrionis*) (学名) (51) +TX、ベアウベリア・パッシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) +TX、ベアウベリア・ブロングニアルチイ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) +TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) +TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) +TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) +TX、

ナモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) +TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) +TX、エンカルシア・ホルモサ (*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 (*Eretmocerus eremicus*) NPV (代替名) (431) +TX、ヘテロラブリジス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) と 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、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) +TX、メクラカメムシ (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) +TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) +TX、メタフィクス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) +TX、メタリジウム・アニソプリエ変異株アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) +TX、メタリジウム・アニソプリエ変異株アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) +TX、

マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV と N.レコンテイ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) +TX、ヒメハナカメムシ属 (*Orius* spp.) (代替名) (596) +TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) +TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) +TX、シロイチモンジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチキャブシド核多核体病ウイルス (学名) (741) +TX、ステイネルネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ・カルポカプサ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ・フェルチア (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ・グラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ・リオブラブ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravis*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) +TX、ステイネルネマ属 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) +TX、トリコグラマ属 (代替名) (826) +TX、チフロドロムス・オッシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844)、及びベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) +TXから成る物質群から選択される生物剤、

ヨードメタン (IUPAC名) (542) 及び臭化メチル (537) +TXから成る物質群から選択される土壌滅菌剤、

アフォレート [CCN] +TX、ビスアジル (*bisazir*) (代替名) [CCN] +TX、ブスルフアン (代替名) [CCN] +TX、ジフルベンズロン (250) +TX、ジマチフ (*dimatif*) (代替名) [CCN] +TX、ヘメル (*hemel*) [CCN] +TX、ヘンパ (*hempa*) [CCN] +TX、メテパ [CCN] +TX、メチオテパ (*methiotepa*) [CCN] +TX、メチル・アフォレート [CCN] +TX、モルジド (*morzid*) [CCN] +TX、ペンフルロン (*penfluron*) (代替名) [CCN] +TX、テパ [C

10

20

30

40

50

CN] +TX、チオヘンパ (thiohempa) (代替名) [CCN] +TX、チオテパ (代替名) [CCN] +TX、トリエチレンメラミン (代替名) [CCN]、及びウレデパ (代替名) [CCN] +TXから成る物質群から選択される不妊化剤、

(E) -デカ-5-エン-1-オールを伴う (E) -デカ-5-エン-1-イル・アセテート (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+TX, Z) -テトラデカ-4+TX、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-オール (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+TX, 9Z) ドデカ-7+TX、9-ジエン-1-イル・アセテート (IUPAC名) (283) +TX、(9Z+TX, 11E) -テトラデカ-9+TX、11-ジエン-1-イル・アセテート (IUPAC名) (780) +TX、(9Z+TX, 12E) -テトラデカ-9+TX、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-オンを伴う4-メチルノナン-5-オール (IUPAC名) (544) +TX、 α -マルチストリアチン (multistriatin) (代替名) [CCN] +TX、ブレビコミン (代替名) [CCN] +TX、コドレルア (codlelure) (代替名) [CCN] +TX、コドレモン (codlemone) (代替名) (167) +TX、キュウルア (cuelure) (代替名) (179) +TX、ジスパルルア (disparlure) (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 (dominicalure) (代替名) [CCN] +TX、エチル4-メチルオクタノアート (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、

ゴシッブルア (代替名) (420) +TX、グランドルア (grandlure) (421) +TX、グランドルアI (代替名) (421) +TX、グランドルアII (代替名) (421) +TX、グランドルアIII (代替名) (421) +TX、グランドルアIV (代替名) (421) +TX、ヘキサルア (hexalure) [CCN] +TX、イプスジエノール (代替名) [CCN] +TX、イプセノール (代替名) [CCN] +TX、ジャボニルア (japonilure) (代替名) (481) +TX、リネアチン (代替名) [CCN] +TX、リトルア (litlure) (代替名) [CCN] +TX、ロオプルア (looplure) (代替名) [CCN] +TX、メドルア (medlure) [CCN] +TX、メガトモ酸 (megatomoic acid) (代替名) [CCN] +TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) +TX、ムスカルレ (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 (orfralure) (代替名) [CCN] +TX、オリクタルア (oryctalure) (代替名) (317) +TX、オストラモン (ostramone) (代替名) [CCN] +TX、シグルア (siglure) [CCN] +TX、ソルジジン (sordidin) (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 (trimedlure) (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) 及びトルンク-カル (trunc-cal l) (代替名) [CCN] +TXから成る物質群から選択される昆虫フェロモン、

2- (オクチルチオ) -エタノール (IUPAC名) (591) +TX、ブトピロノキシル (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、ジブチルフタラート (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 (dimethylcarbate) [CCN] +TX、ジメチルフタラート [CCN] +TX、エチル・ヘキサンジオール (1137) +TX、ヘキサミド [CCN] +TX、メトキノ-ブチル (1276) +TX、メチルネオデカンアミド [CCN] +TX、オキサマート [CCN] 及びピカリジン [CCN] TXから成る物質群から選択される防虫剤、

10

20

30

40

50

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、1,3-ジクロロプロペンを伴う1,2-ジクロロプロパン (IUPAC名) (1063) +TX、1-ブromo-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) 酢酸エチル (IUPAC名) (1451) +TX、2,2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチル・メチル・ホスファート (IUPAC名) (1066) +TX、2- (1,3-ジチオラン-2-イル) フェニル・ジメチルカルバマート (IUPAC/ケミカル・アブストラクツ名) (1109) +TX、2- (2-プトキシエトキシ) エチル・チオシアナート (IUPAC/ケミカル・アブストラクツ名) (935) +TX、

10

2- (4,5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル) フェニル・メチルカルバマート (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・ホスファート (IUPAC名) (984) +TX、2-イミダゾリドン (IUPAC名) (1225) +TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン (IUPAC名) (1246) +TX、2-メチル (プロパ-2-イニル) アミノフェニル・メチルカルバマート (IUPAC名) (1284) +TX、2-チオシアナートエチル・ラウラート (IUPAC名) (1433) +TX、3-ブromo-1-クロロプロパ-1-エン (IUPAC名) (917) +TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イル・ジメチルカルバマート (IUPAC名) (1283) +TX、4-メチル (プロパ-2-イニル) アミノ-3,5-キシリル・メチルカルバマート (IUPAC名) (1285) +TX、5,5-ジメチル-3-オキソシクロヘキサ-1-エニル・ジメチルカルバマート (IUPAC名) (1085) +TX、

20

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 (acethion) (代替名) [CCN] +TX、アセトプロール [CCN] +TX、アクリナスリン (9) +TX、アクリロニトリル (IUPAC名) (861) +TX、アラニカルブ (15) +TX、アルジカルブ (16) +TX、アルドキシカルブ (863) +TX、アルドリル (864) +TX、アレスリン (17) +TX、アロサミジン (代替名) [CCN] +TX、アリキシカルブ (866) +TX、 α -シペルメトリン (202) +TX、 α -エクジソン (代替名) [CCN] +TX、リン化アルミニウム (640) +TX、アミジチオン (amidithion) (870) +TX、アミドチオエート (amidothioate) (872) +TX、アミノカルブ (873) +TX、アミトン (875) +TX、シュウ酸水素アミトン (875) +TX、アミトラズ (24) +TX、

30

アナバシン (877) +TX、アチダチオン (athidathion) (883) +TX、AVI 382 (化合物コード) +TX、AZ 60541 (化合物コード) +TX、アザディラクチン (代替名) (41) +TX、アザメチホス (42) +TX、アジンホス-エチル (44) +TX、アジンホス-メチル (45) +TX、アゾトアート (azothoate) (889) +TX、バチルス・チューリンゲンシス・ δ -エンドトキシン (代替名) (52) +TX、フッ化ケイ素酸バリウム (代替名) [CCN] +TX、バリウム多硫化物 (IUPAC/ケミカル・アブストラクツ名) (892) +TX、バルトリル [CCN] +TX、Bayer 22/190 (開発コード) (893) +TX、Bayer 22408 (開発コード) (894) +TX、ベンジオカルブ (58) +TX、ベンフラカルブ (60) +TX、ベンスルタップ (66) +TX、 β -シフルトリル (194) +TX、

β -サイパーメスリン (203) +TX、ピフェントリン (76) +TX、ピオアレトリン (78) +TX、ピオアレトリン (bioallethrin) S-シクロペンテニル異性体 (代替名) (79) +TX、ピオエタノメトリン (bioethanomethrin) [CCN] +TX、ピオペルメトリン (biopermethrin) (908) +TX、ピオレスメトリン (80) +TX、ビス (2-クロロエチル) エーテル (IUPAC名) (909) +TX、ビストリフルロン (83) +TX、ハウ砂 (86) +TX、ブروفエンバレラート (brofenvalerate) (代替名) +TX、ブロンフェンビンホス (bromfenvinfos) (914) +TX、ブromoシクレン (918) +TX、ブromo-DDT (代替名) [CCN] +TX、ブromoホス (920) +TX、ブromoホス-エチル (921) +TX、ブフェンカルブ (924) +TX、ブプロフェジン (99) +TX、ブタカルブ (butacarb) (926) +TX、ブタチオホス (927) +TX、プトカルボキシム (103) +TX、

40

プトナート (butonate) (932) +TX、プトキシカルボキシム (104) +TX、ブチルピリダ

50

ベン（代替名）+TX、カズサホス（109）+TX、ヒ酸カルシウム [CCN] +TX、シアン化カルシウム（444）+TX、多硫化カルシウム（IUPAC名）（111）+TX、カンフェクロル（941）+TX、カーボノラート（943）+TX、カルバリル（115）+TX、カルボフラン（118）+TX、二硫化炭素（IUPAC／ケミカル・アブストラクツ名）（945）+TX、四塩化炭素（IUPAC名）（946）+TX、カルボフェノチオン（947）+TX、カルボスルファン（119）+TX、カルタップ（123）+TX、カルタップ・ハイドロクロライド（123）+TX、

セバジン（代替名）（725）+TX、クロルビシクレン（chlorbicyclen）（960）+TX、クロルデン（128）+TX、クロルデコン（963）+TX、クロルジメホルム（964）+TX、塩酸クロルジメホルム（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、クロルフルアズロン（132）+TX、クロルメホス（136）+TX、クロロホルム [CCN] +TX、クロルピクリン（141）+TX、クロルホキシム（chlorphoxim）（989）+TX、クロルプラゾホス（chlorprazophos）（990）+TX、クロルピリホス（145）+TX、クロルピリホス-メチル（146）+TX、クロルチオホス（994）+TX、クロマフェノジド（150）+TX、シネリンI（696）+TX、シネリンII（696）+TX、シネリン（696）+TX、cis-レスメスリン（代替名）+TX、シスメトリン（80）+TX、クロシトリン（clocythrinn）（代替名）+TX、クロエトカルブ（999）+TX、クロサンテル（代替名） [CCN] +TX、クロチアニジン（165）+TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] +TX、

ヒ酸銅 [CCN] +TX、オレイン酸銅 [CCN] +TX、クマホス（174）+TX、クミトアート（cumithoate）（1006）+TX、クロタミトン（代替名） [CCN] +TX、クロトキシホス（1010）+TX、クルホルナート（cruformate）（1011）+TX、氷晶石（代替名）（177）+TX、CS 708（開発コード）（1012）+TX、シアノフェンホス（1019）+TX、シアノホス（184）+TX、シアントアート（cyanthoate）（1020）+TX、シクレトリン（cyclethrin） [CCN] +TX、シクロプロトリン（188）+TX、シフルスリン（193）+TX、シハロスリン（196）+TX、サイパーメスリン（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（cythioate）（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）（788）+TX、DAEP（1031）+TX、ダゾメット（216）+TX、

DDT（219）+TX、デカルボフラン（1034）+TX、デルタメスリン（223）+TX、デメフィオン（1037）+TX、デメフィオン-0（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-0（1038）+TX、デメトン-0-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、ディアフェンチウロン（226）+TX、ジアリホール（dialifos）（1042）+TX、ジアミダホス（diamidafos）（1044）+TX、ダイアジノン（227）+TX、ジカプトン（dicaphton）（1050）+TX、ジクロフェンチオン（1051）+TX、ジクロルホス（236）+TX、ジクリホス（dicliphos）（代替名）+TX、ジクレシル（dicresyl）（代替名） [CCN] +TX、ジクロトホス（243）+TX、ジシクラニル（244）+TX、ディルドリン（1070）+TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イル・ホスファート（IUPAC名）（1076）+TX、

ジフルベンズロン（250）+TX、ジロル（dilor）（代替名） [CCN] +TX、ジメフルトリン（dimefluthrin） [CCN] +TX、ジメホックス（1081）+TX、ディメタン（1085）+TX、ジメトエート（262）+TX、ジメトリン（dimethrin）（1083）+TX、ジメチルビンホス（265）+TX、ジメチラン（1086）+TX、ジネクス（1089）+TX、ジネクス-ジクレキシム（diclexine）（1089）+TX、ジノプロブ（dinoprop）（1093）+TX、ジノサム（dinosam）（1094）+TX、ジノセブ（1095）+TX、ジノテフラン（271）+TX、ジオフェノラン（1099）+TX、ジオキサベンゾホス（dioxabenzofos）（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（dithicrofos）（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・ベンゾエート（291）+TX、EMPC（1120）+TX、エンペントリン（292）+TX、エンドスルファン（294）+TX、

エンドチオン（endothion）（1121）+TX、エンドリン（1122）+TX、EPBP（1123）+TX、EPN（297）+TX、エポフェノナン（epofenonane）（1124）+TX、エブリノメクチン（代替

10

20

30

40

50

名) [CCN] +TX、エスフェンバレラート (302) +TX、エタホス (etaphos) [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、エトアート-メチル (1134) +TX (代替名)、エトプロホス (312) +TX、ギ酸エチル (IUPAC名) [CCN] +TX、エチル-DDD (代替名) (1056) +TX、エチレン・ジプロミド (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、ファミフル (323) +TX、フェナミホス (326) +TX、フェナザフロル (1147) +TX、フェンクロルホス (1148) +TX、フェネタカルブ (fenethacarb) (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 (fenoxacrim) (1153) +TX、フェノキシカーブ (340) +TX、フェンピリトリン (fenpirithrin) (1155) +TX、フェンプロパスリン (342) +TX、

10

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、フェンバレレート (349) +TX、フィプロニル (354) +TX、フロニカミド (358) +TX、フルベンジアミド (CAS登録番号: 272451-65-7) +TX、フルコフロン (flucofuron) (1168) +TX、フルシクロクスロン (366) +TX、フルシトリナート (367) +TX、フルエネチル (fluenetil) (1169) +TX、フルフェンリム [CCN] +TX、フルフェノクスロン (370) +TX、フルフェンプロックス (1171) +TX、フルメトリン (372) +TX、フルバリネート (1184) +TX、FMC 1137 (開発コード) (1185) +TX、ホノホス (1191) +TX、ホルメタネート (405) +TX、ホルメタネート・ハイドロクロライド (405) +TX、ホルモチオン (1192) +TX、ホルムパラナート (formparanate) (1193) +TX、ホスメチラン (fosmethilan) (1194) +TX、ホスピレート (1195) +TX、ホスチアゼート (408) +TX、ホスチエタン (1196) +TX、フラチオカルブ (412) +TX、フレトリン (furethrin) (1200) +TX、 γ -シハロトリン (197) +TX、 γ -HCH (430) +TX、グアザチン (422) +TX、グアザチン・アセテート (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、

20

HEOD (1070) +TX、ヘプタクロル (1211) +TX、ヘプテノホス (432) +TX、ヘテロホス (heterophos) [CCN] +TX、ヘキサフルムロン (439) +TX、HHDN (864) +TX、ヒドラメチルノン (443) +TX、シアン化水素 (444) +TX、ハイドロプレン (445) +TX、ヒキンカルブ (hyquincarb) (1223) +TX、イミダクロプリド (458) +TX、イミプロトリン (460) +TX、インドキサカルブ (465) +TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) +TX、IPSP (1229) +TX、イサゾホス (1231) +TX、イソベンザン (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) +TX、イソラン (isolane) (1237) +TX、イソプロカルブ (472) +TX、O- (メトキシアミノチオホスホリル) サリチル酸イソプロピル (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 (696) +TX、ジャスモリンII (696) +TX、

30

ジョドフェンホス (jodfenphos) (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、リンデン (430) +TX、リリンホス (lirimfos) (1251) +TX、ルフェヌロン (490) +TX、リチダチオン (lythidathion) (1253) +TX、m-クメニルメチルカルバマート (IUPAC名) (1014) +TX、リン化マグネシウム (IUPAC名) (640) +TX、マラソン (492) +TX、マロノベン (malonoben) (1254) +TX、マジドキス (mazidox) (1255) +TX、メカルバム (502) +TX、メカルホン (mecarphon) (1258) +TX、メナゾン (1260) +TX、メホスホラン (1261) +TX、塩化水銀 (513) +TX、メスルフェンホス (1263) +TX、

40

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 (methacrifos) (1266) +TX、メタミドホス (527) +TX、メタンスルホニルフルオリド (fUPAC/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 (met

50

hocrotophos) (1273) +TX、メソミル (531) +TX、メトプレン (532) +TX、メトキン (methoquin) -ブチル (1276) +TX、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、イソチオシアン酸メチル (543) +TX、メチルクロロホルム (代替名) [CCN] +TX、塩化メチレン [CCN] +TX、

メトフルトリン [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、メキサカルバート (1290) +TX、ミルベメクチン (557) +TX、ミルベマイシン・オキシム (代替名) [CCN] +TX、ミパフォックス (1293) +TX、マイレックス (1294) +TX、モノクロトホス (561) +TX、モルホチオン (morphothion) (1300) +TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] +TX、ナフタロホス (naftalofos) [CCN] +TX、ネイルド (567) +TX、ナフタレン (IUPAC/ケミカル・アブストラクツ名) (1303) +TX、NC-170 (開発コード) (1306) +TX、NC-184 (化合物コード) +TX、ニコチン (578) +TX、硫酸ニコチン (578) +TX、ニフルリジド (1309) +TX (代替名)、ニテンピラム (579) +TX、ニチアジン (1311) +TX、ニトリラカルブ (nitrilacarb) (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 (伝統的な名称) (1319) +TX、ノバリュロン (585) +TX、ノビフルムロン (586) +TX、0-5-ジクロロ-4-インドフェニル0-エチル・エチルホスホノチオアート (IUPAC名) (1057) +TX、

0,0-ジエチル0-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イル・ホスホロチオアート (IUPAC名) (1074) +TX、0,0-ジエチル 0-6-メチル-2-プロピルピリミジン-4-イル・ホスホロチオアート (IUPAC名) (1075) +TX、0,0,0',0'-テトラプロピルジチオピロホスファート (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、オキシジメトン-メチル (609) +TX、オキシデプロホス (1324) +TX、オキシオキシジスルホトン (oxydisulfoton) (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 (penfluron) (代替名) [CCN] +TX、ペンタクロロフェノール (623) +TX、ペンタクロロフェニル・ラウラート (IUPAC名) (623) +TX、パーメスリン (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、ホスニクロル (phosnichlor) (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 (pirimetaphos) (1344) +TX、ピリミカーブ (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 (伝統的な名称) (1347) +TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] +TX、ロダン酸カリウム [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、プリイミドホス (primidophos) (1349) +TX、プロフェノホス (662) +TX、プロフルスリン [CCN] +TX、プロマシル (1354) +TX、

プロメカルブ (1355) +TX、プロパホス (1356) +TX、プロペタムホス (673) +TX、プロポキスル (678) +TX、プロチダチオン (prothidathion) (1360) +TX、プロチオホス (686) +TX、プロトアート (1362) +TX、プロトリフェンブト [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 (pyresmethrin) (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、ピリミタート (1370) +TX、ピリプロキシフェン (708) +TX、カッシア (quassia) (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 (quinothion) (1380) +TX、キンチオホス (1381) +TX、R-1492 (開発コード) (1382) +TX、ラホキサニド (代替名) [CCN] +TX、

レスメスリン (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 (ryania) (代替名) (1387) +TX、リア

10

20

30

40

50

ノジン（伝統的な名称）（1387）+TX、サバジラ（代替名）（725）+TX、シュラーダン（1389）+TX、セブホス（sebufos）（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] 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、ペンタクロロフェノキシド・ナトリウム（623）+TX、セレン酸ナトリウム（IUPAC名）（1401）+TX、チオシアン酸ナトリウム [CCN] +TX、ソファミド（1402）+TX、スピノサッド（737）+TX、スピロメシフェン（739）+TX、スピロテトルマト（spirotetmat）（CCN）+TX、スルコフロン（sulcofuron）（746）+TX、スルコフロン-ナトリウム（746）+TX、

10

スルフルアミド（750）+TX、スルホテップ（753）+TX、フッ化スルフリル（756）+TX、スルプロホス（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（tazimcarb）（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（terallethrin）（1418）+TX、テルバム（terbam）（代替名）+TX、テルブホス（773）-f TX、テトラクロロエタン [CCN] +TX、テトラクロロビンホス（777）+TX、テトラメスリン（787）+TX、 θ -シベルメトリン（204）+TX、チアクロプリド（791）+TX、チアフェノックス（代替名）+TX、チアメトキシム（792）+TX、チクロホス（thicrofos）（1428）+TX、チオカルボキシム（thiocarboxime）（1431）+TX、チオシクラム（798）+TX、シュウ酸水素チオシクラム（798）+TX、チオジカルブ（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（thiosultap）（803）+TX、チオスルタップ-ナトリウム（803）+TX、

20

ツリンギエンシン（thuringiensin）（代替名）[CCN]+TX、トルフェンピラド（809）+TX、トラロメスリン（812）+TX、トランスフルトリン（813）+TX、トランスベルメトリン（transpermethrin）（1440）+TX、トリアミホス（triamiphos）（1441）+TX、トリアザメイト（818）+TX、トリアゾホス（820）+TX、トリアズロン（triazuron）（代替名）+TX、トリクロロホン（824）+TX、トリクロロメタホス-3（trichlormetaphos-3）（代替名）[CCN]+TX、トリクロロナート（1452）+TX、トリフェノホス（trifenofos）（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（triprene）（1459）+TX、バミドチオン（847）+TX、バニリプロール（vaniliprole）[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 -シベルメトリン（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（zolaprofos）（1469）、及びZXI 8901（開発コード）（858）+TXから成る物質群から選択される殺虫剤、

30

ビス（トリブチルスズ）酸化物（IUPAC名）（913）+TX、ブromo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、トリフェニルスズ（fentin）（347）+TX、リン酸鉄（III）（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、ペンタクロロフェノキシド・ナトリウム（623）+TX、タジムカルブ（tazimcarb）（1412）+TX、チオジカルブ（799）+TX、酸化トリブチルスズ（913）+TX、トリフェンモルフ（1454）+TX、トリメタカルブ（840）+TX、酢酸トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）及び水酸化トリフェニルスズ（IUPAC名）（347）+TXから成る物質群から選択される軟体動物駆除剤、

40

AKD-3088（化合物コード）+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン（IUPAC／ケミカル・アブストラクツ名）（1045）+TX、1,2-ジクロロプロパン（IUPAC／ケミカル・アブストラクツ名）（1062）+TX、1,3-ジクロロプロパンを伴う1,2-ジクロロプロパン（IUPAC名）

50

(1063) +TX、1,3-ジクロロプロペン (233) +TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフエン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 (3-(4-chlorophenyl)-5-methylrhodanine) (IUPAC名) (980) +TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジジン-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、アルドオキシカルブ (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、クロルピクリン (141) +TX、クロルピリホス (145) +TX、

10

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 (diamidafos) (1044) +TX、ジクロフェンチオン (1051) +TX、ジクリホス (dicliphos) (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・ベンゾエート (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 (heterophos) [CCN] +TX、ヨードメタン (IUPAC名) (542) +TX、

イサミドホス (isamidofos) (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、メカルホン (mecarphon) (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、イソチオシアン酸メチル (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、ミロテシウム・ベルカリア (*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 (sebufos) (代替名) +TX、セラメクチン (selamectin) (代替名) [CCN] +TX、スピノサッド (737) +TX、テルバム (terbam) (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、チアフェノックス (代替名) +TX、チオナジン (1434) +TX、トリアゾホス (820) +TX、トリアズロン (triazuron) (代替名) +TX、キシレノール [CCN] +TX、YI-5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) +TXから成る物質群から選択される殺線虫剤、

20

30

エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) +TXから成る物質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) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) +TXから成る物質群から選択される植物活性化因子、

2-イソバレリルインデン-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 -クロルヒドリン [CCN] +TX、リン化アルミニウム (640) +TX、アンツ (antu) (880) +TX、三酸化ヒ素 (882) +TX、炭酸バリウム (891) +TX、ビスチオセミ (912) +TX、ブロジファクム (89) +TX、ブロマジオロン (bromadiolone) (91) +TX、ブロメタリン (bromethalin) (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、クマクロル (1004) +TX、クマフリル (coumafuryl) (1005) +TX、クマテトラリル (175) +TX、クリミジン (1009) +TX、ジフェナコン (difenacoum) (246) +TX、ジフチアロン (249) +TX、ディファシノン (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、フルプロパジン (flupropadine) (1183) +TX、フルプロパジン・ハイドロクロライド (1183) +TX、 γ -HCH (430) +TX、HCH (430) +TX、シアン化水素 (444) +TX、

40

50

ヨードメタン (IUPAC名) (542) +TX、リンデン (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 (phosacetim) (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 (pyrinuron) (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) 及びリン化亜鉛 (640) +TXから成る物質群から選択される殺鼠剤、

2- (2-プトキシエトキシ) -エチル・ピペロニラート (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、ネロリドールを伴うファルネソール (代替名) (324) +TX、MB-599 (開発コード) (498) +TX、MGK 264 (開発コード) (296) +TX、ピペロニルプトキサイド (649) +TX、ピプロタル (piprotal) (1343) +TX、プロピル異性体 (1358) +TX、S421 (開発コード) (724) +TX、セサメックス (1393) +TX、セサスモリン (sesasmolin) (1394) 及びスルホキシド (1406) +TXから成る物質群から選択される共力剤、

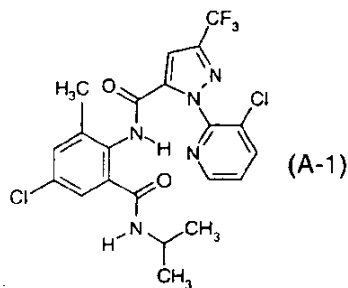
アントラキノン (32) +TX、クロラロース (127) +TX、ナフテン酸銅 [CCN] +TX、オキシ塩化銅 (171) +TX、ダイアジノン (227) +TX、ジシクロペンタジエン (化学名) (1069) +TX、グアザチン (422) +TX、グアザチン・アセテート (422) +TX、メチオカルブ (530) +TX、ピリジン-4-アミン (IUPAC名) (23) +TX、チラム (804) +TX、トリメタカルブ (840) +TX、ナフテン酸亜鉛 [CCN] 及びジラム (856) +TXから成る物質群から選択される動物忌避剤、

イマニン (imanin) (代替名) [CCN] 及びリバビリン (ribavirin) (代替名) [CCN] +TXから成る物質群から選択される殺ウイルス剤、

酸化第二水銀 (512) +TX、オクチリノン (590) 及びチオフアネート・メチル (802) +TXから成る物質群から選択される創傷保護剤、

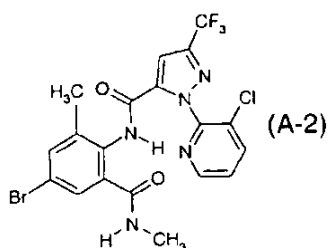
以下の式 (A-1) :

【化 1 0 2】



+TX、以下の式 (A-2) :

【化 1 0 3】



10

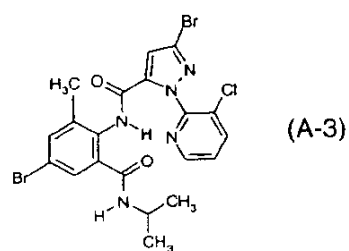
20

30

40

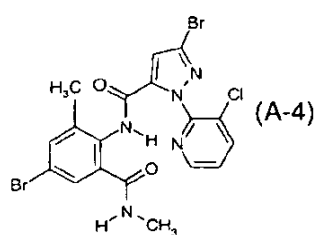
50

+TX、以下の式 (A-3) :
【化 1 0 4】



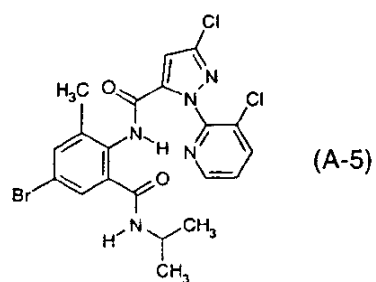
10

+TX、以下の式 (A-4) :
【化 1 0 5】



20

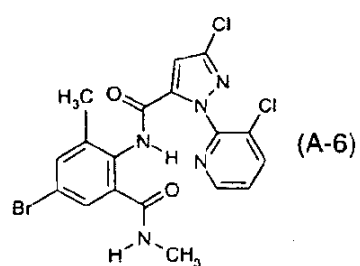
+TX、以下の式 (A-5) :
【化 1 0 6】



30

+TX、以下の式 (A-6) :

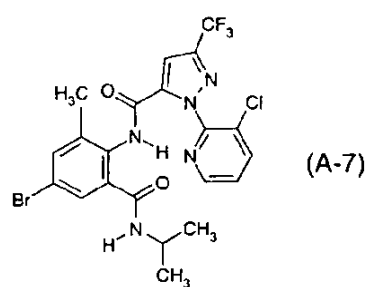
【化 1 0 7】



10

+TX、以下の式 (A-7) :

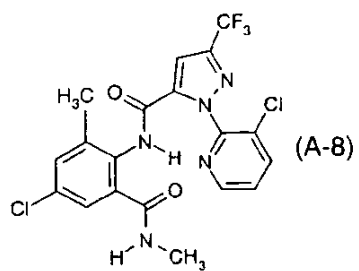
【化 1 0 8】



20

+TX、以下の式 (A-8) :

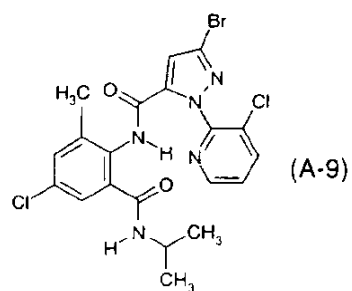
【化 1 0 9】



30

+TX、以下の式 (A-9) :

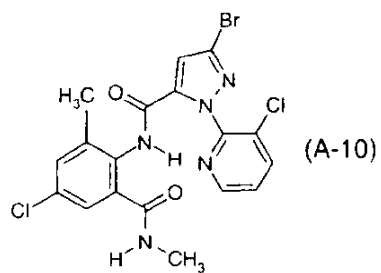
【化 1 1 0】



40

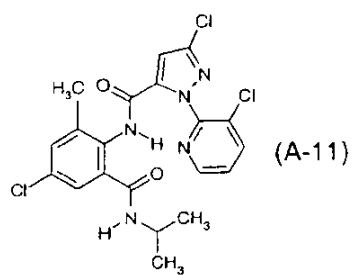
50

+TX、以下の式 (A-10) :
【化 1 1 1】



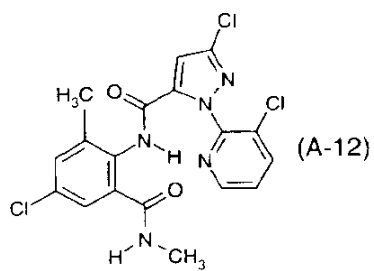
10

+TX、以下の式 (A-11) :
【化 1 1 2】



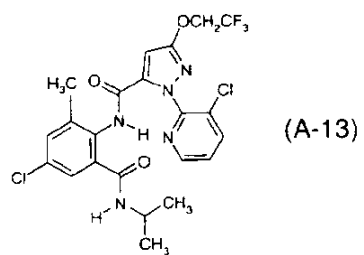
20

+TX、以下の式 (A-12) :
【化 1 1 3】



30

+TX、以下の式 (A-13) :
【化 1 1 4】

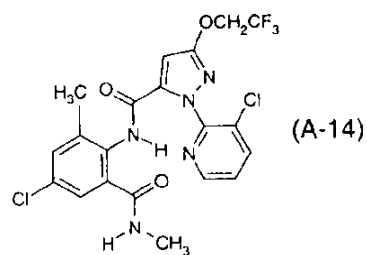


40

+TX、以下の式 (A-14) :

50

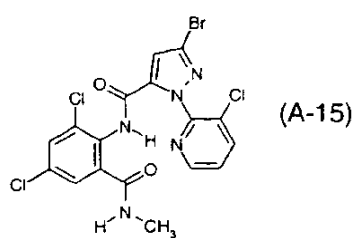
【化 1 1 5】



10

+TX、以下の式 (A-15) :

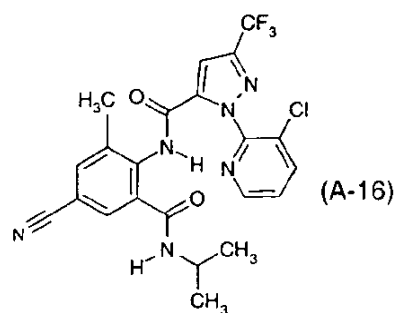
【化 1 1 6】



20

+TX、以下の式 (A-16) :

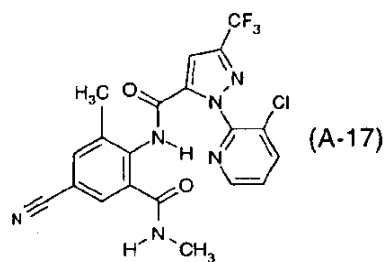
【化 1 1 7】



30

+TX、以下の式 (A-17) :

【化 1 1 8】



40

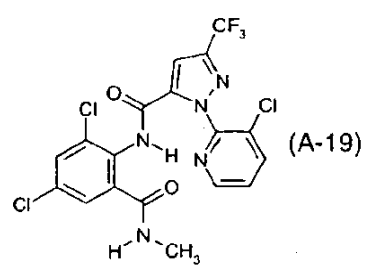
+TX、以下の式 (A-18) :

50

CN(C)C(=O)c1cc(Cl)c(Cl)cc1N2C(=O)c3cc(Cl)ccn3N2C(=O)c4cc(Br)nn4 (A-18)

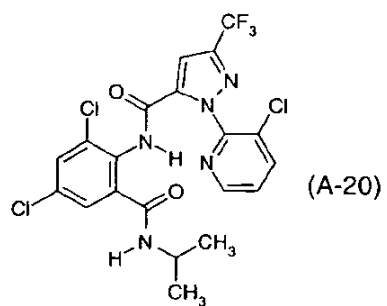
10

【化 1 2 0】



20

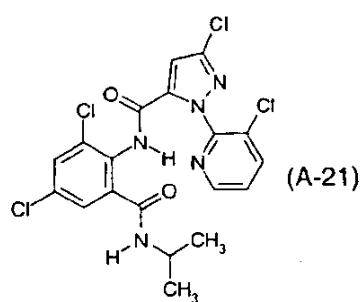
【化 1 2 1】



30

+TX、以下の式 (A-21) :

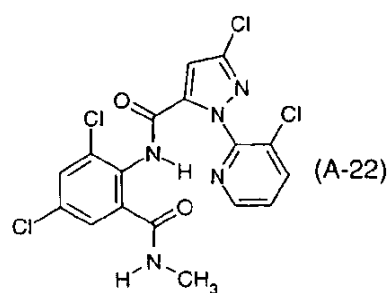
【化 1 2 2】



10

+TX、以下の式 (A-22) :

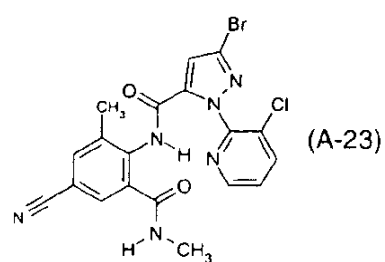
【化 1 2 3】



20

+TX、以下の式 (A-23) :

【化 1 2 4】

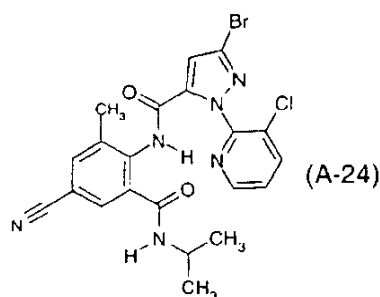


30

+TX、以下の式 (A-24) :

40

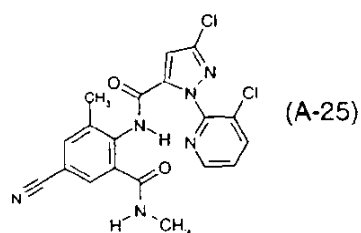
【化 1 2 5】



10

+TX、以下の式 (A-25) :

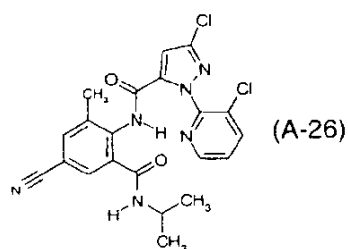
【化 1 2 6】



20

+TX、以下の式 (A-26) :

【化 1 2 7】



30

+TXによって表される化合物から成る群から選択される殺虫剤、並びに

アザコナゾール (Azaconazole) [60207-31-0] +TX、ビテルタノール (Bitertanol) [70585-36-3] +TX、ブロムコナゾール (Bromuconazole) [116255-48-2] +TX、シプロコナゾール (Cyproconazole) [94361-06-5] +TX、ジフェノコナゾール (Difenoconazole) [119446-68-3] +TX、ジニコナゾール (Diniconazole) [83657-24-3] +TX、エポキシコナゾール (Epoconazole) [106325-08-0] +TX、フェンブコナゾール (Fenbuconazole) [114369-43-6] +TX、フルキンコナゾール (Fluquinconazole) [136426-54-5] +TX、フルシラゾール (Flusilazole) [85509-19-9] +TX、フルトリアホル (Flutriafol) [76674-21-0] +TX、ヘキサコナゾール (Hexaconazole) [79983-71-4] +TX、イマザリル (Imazalil) [35554-44-0] +TX、イミベンコナゾール (Imibenconazole) [86598-92-7] +TX、イプコナゾール (Ipconazole) [125225-28-7] +TX、

メトコナゾール (Metconazole) [125116-23-6] +TX、ミクロブタニル (Myclobutanil) [88671-89-0] +TX、ペフラゾエート (Pefurazoate) [101903-30-4] +TX、ペンコナゾール (Penconazole) [66246-88-6] +TX、プロチオコナゾール (Prothioconazole) [178

40

50

928-70-6] +TX、ピリフェノックス (PyrifenoX) [88283-41-4] +TX、プロクロラズ (Prochloraz) [67747-09-5] +TX、プロピコナゾール (Propiconazole) [60207-90-1] +TX、シメコナゾール (Simeconazole) [149508-90-7] +TX、テブコナゾール (Tebuconazole) [107534-96-3] +TX、テトラコナゾール (Tetraconazole) [112281-77-3] +TX、トリアジメホン (Triadimefon) [43121-43-3] +TX、トリアジメノール (Triadimenol) [55219-65-3] +TX、トリチコナゾール (Triticonazole) [131983-72-7] +TX、トリフルミゾール (Triflumizole) [99387-89-0] TX、アンシミドール (Ancymidol) [12771-68-5] +TX、フェナリモール (Fenarimol) [60168-88-9] +TX、ヌアリモール (Nuarimol) [63284-71-9] +TX、ブピリメート (Bupirimate) [41483-43-6] +TX、ジメチリモール (Dimethirimol) [5221-53-4] +TX、

10

エチリモール (Ethirimol) [23947-60-6] +TX、ドデモルフ (Dodemorph) [1593-77-7] +TX、フェンプロピディン (Fenpropidine) [67306-00-7] +TX、フェンプロピモルフ (Fenpropimorph) [67564-91-4] +TX、スピロキサミン (Spiroxamine) [118134-30-8] +TX、トリデモルフ (Tridemorph) [81412-43-3] +TX、シプロジニル (Cyprodinil) [12152-61-2] +TX、メパニピリム (Mepanipyrim) [110235-47-7] +TX、ピリメタニル (Pyrimethanil) [53112-28-0] +TX、フェンピクロニル (Fenpiclonil) [74738-17-3] +TX、フルジオキシニル (Fludioxonil) [131341-86-1] +TX、ベナラキシル (Benalaxyl) [71626-11-4] +TX、フララキシル (Furalaxyl) [57646-30-7] +TX、メタラキシル (Metalaxyl) [57837-19-1] +TX、R-メタラキシル (R-Metalaxyl) [70630-17-0] +TX、オフレース (Ofurace) [58810-48-3] +TX、オキサジキシル (Oxadixyl) [77732-09-3] +TX、ベノミル (Benomyl) [17804-35-2] +TX、カルベンダジム (Carbendazim) [10605-21-7] +TX、デバカルブ (Debacarb) [62732-91-6] +TX、フベルトダゾール (Fubertdazole) [3878-19-1] +TX、

20

チアベンダゾール (Thiabendazole) [148-79-8] +TX、クロゾリナート (Chlozolate) [84332-86-5] +TX、ジクロゾリン (Dichlozoline) [24201-58-9] +TX、イプロジオン (Iprodione) [36734-19-7] +TX、ミクロゾリン (Myclozoline) [54864-61-8] +TX、プロシミドン (Procymidone) [32809-16-8] +TX、ビンクロゾリン (Vinclozoline) [50471-44-8] +TX、ボスカリド (Boscalid) [188425-85-6] +TX、カルボキシシン (Carboxin) [5234-68-4] +TX、フェンフラム (Fenfuram) [24691-80-3] +TX、フルトラニル (Flutolanil) [66332-96-5] +TX、メプロニル (Mepronil) [55814-41-0] +TX、オキシカルボキシシン (Oxycarboxin) [5259-88-1] +TX、ペンチオピラド (Penthiopyrad) [183675-82-3] +TX、チフルズアミド (Thifluzamide) [130000-40-7] +TX、グアザチン (Guazatine) [108173-90-6] +TX、ドジン (Dodine) [2439-10-3] [112-65-2] (遊離塩基) +TX、イミンオクタジン (Iminoctadine) [13516-27-3] +TX、アゾキシストロビン (Azoxystrobin) [131860-33-8] +TX、ジモキシストロビン (Dimoxystrobin) [149961-52-4] +TX、エネストロブリン (enestroburin) {Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93} +TX、フルオキサストロビン (Fluoxastrobin) [361377-29-9] +TX、クレソキシム-メチル (Kresoxim-methyl) [143390-89-0] +TX、メトミノストロビン (Metominostrobin) [133408-50-1] +TX、

30

トリフロキシストロビン (Trifloxystrobin) [141517-21-7] +TX、オリスアストロビン (Orysastrobin) [248593-16-0] +TX、ピコキシスロビン (Picoxystrobin) [117428-22-5] +TX、ピラクロストロビン (Pyraclostrobin) [175013-18-0] +TX、フェルバム (Ferbam) [14484-64-1] +TX、マンコゼブ (Mancozeb) [8018-01-7] +TX、マネブ (Maneb) [12427-38-2] +TX、メチラム (Metiram) [9006-42-2] +TX、プロピネブ (Propineb) [12071-83-9] +TX、チラム (Thiram) [137-26-8] +TX、ジネブ (Zineb) [12122-67-7] +TX、ジラム (Ziram) [137-30-4] +TX、カプタホル (Captan) [133-06-2] +TX、ジクロフロアニド (Dichlofluanid) [1085-98-9] +TX、フルオロイミド (Fluoroimide) [41205-21-4] +TX、ホルペト (Folpet) [133-07-3] +TX、トリルフルアニド (Tolyfluanid) [731-27-1] +TX、ボルドー混合物 (Bordeaux Mixture) [8011-63-0] +TX、水酸化銅 (Copperhydroxid) [20427-59-2] +TX、

40

50

塩基性塩化銅 (Copperoxychlorid) [1332-40-7] +TX、

硫酸銅 (Coppersulfat) [7758-98-7] +TX、酸化銅 (Copperoxid) [131739-1] +TX、マンコッパー (Mancopper) [53988-93-5] +TX、オキシ銅 (Oxine-copper) [10380-28-6] +TX、ジノカプ (Dinocap) [131-72-6] +TX、ニトロタル・イソプロピル (Nitrothal-isopropyl) [10552-74-6] +TX、エジフェンホス (Edifenphos) [17109-49-8] +TX、イプロベンホス (Iprobenphos) [26087-47-8] +TX、イソプロチオラン (Isoprothiolane) [50512-35-1] +TX、ホスジフェン (Phosdiphen) [3651900-3] +TX、ピラゾホス (Pyrazophos) [13457-18-6] +TX、トルクロホス-メチル (Tolclofos-methyl) [57018-04-9] +TX、アシベンゾラル-S-メチル (Acibenzolar-S-methyl) [135158-54-2] +TX、アニラジン (Anilazine) [101-05-3] +TX、ベンチアバリカルブ (Benthiavalicarb) [413615-35-7] +TX、ブラストサイジン-S (Blasticidin-S) [2079-00-7] +TX、キノメチオネート (Chinomethionat) [2439-01-2] +TX、キオロネブ (Chioroneb) [2675-77-6] +TX、クロロタロニイ (Chlorothalonii) [1897-45-6] +TX、シフルフェナミド (Cyflufenamid) [18040960-3] +TX、シモキサニル (Cymoxanil) [57966-95-7] +TX、ジクロン (Dichlone) [117-80-6] +TX、ジクロシメット (Diclocymet) [139920-32-4] +TX、ジクロメジン (Diclomezine) [62865-36-5] +TX、

ドルドラン (Dldoran) [99-30-9] +TX、ジエトフェンカルブ (Diethofencarb) [87130-20-9] +TX、ジメトモルフ (Dimethomorph) [110488-70-5] +TX、SYP-LI90 (フルモルフ (Flumorph)) [211867-47-9] +TX、ジチアノン (Dithianon) [3347-22-6] +TX、エタボキサム (Ethaboxam) [162650-77-3] +TX、エトリジアゾール (Etridiazole) [2593-15-9] +TX、ファモキサドン (Famoxadone) [131807-57-3] +TX、フェンアミドン (Fenamidone) [161326-34-7] +TX、フェノキサニル (Fenoxanil) [115852-48-7] +TX、フェンチン (Fentin) [668-34-8] +TX、フェリムゾン (Ferimzone) [89269-64-7] +TX、フルアジナム (Fluazinam) [79622-59-6] +TX、フルオピコリド (Fluopicolide) [239110-15-7] +TX、フルスルファミド (Flusulfamide) [106917-52-6] +TX、フェンヘキサアミド (Fenhexamid) [126833-17-8] +TX、ホセチル-アルミニウム (Fosetyl-aluminium) [39148-24-8] +TX、ヒメキサゾール (Hymexazol) [10004-44-1] +TX、(イプロバリカルブ Iprovalicarb) [140923-17-7] +TX、IKF-916 (シアゾファミド (Cyazofamid)) [120116-88-3] +TX、カスガマイシン (kasugamycin) [6980-18-3] +TX、

メタスルホカルブ (Methasulfocarb) [66952-49-6] +TX、メトラフェノン (Metrafenone) [220899-03-6] +TX、ペンシクロン (Pencycuron) [66063-05-6] +TX、フタリド (Pththalide) [27355-22-2] +TX、ポリオキシシンス (Polyoxins) [11113-80-7] +TX、プロベナゾール (Probenazole) [27605-76-1] +TX、プロパモカルブ (Propamocarb) [25606-41-1] +TX、プロキナジド (Proquinazid) [189278-12-4] +TX、ピロキロン (Pyroquilon) [57369-32-1] +TX、キノキシフェン (Quinoxifen) [124495-18-7] +TX、キントゼン (Quintozene) [82-68-8] +TX、スクウェフェル (Schwefel) [7704-34-9] +TX、チアジニル (Tiadinil) [223580-51-6] +TX、トリアゾキシド (Triazoxide) [72459-58-6] +TX、トリシクラゾール (Tricyclazole) [41814-78-2] +TX、トリホリン (Triforine) [26644-46-2] +TX、バリダマイシン (Validamycin) [37248-47-8] +TX、ゾキサミド (Zoxamide) (RH7281) [156052-68-5] +TX、マンジプロプアミド (Mandipropamid) [374726-62-2] +TX、以下の式 (F-1) :

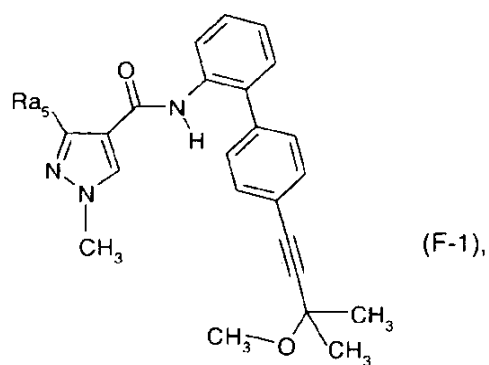
10

20

30

40

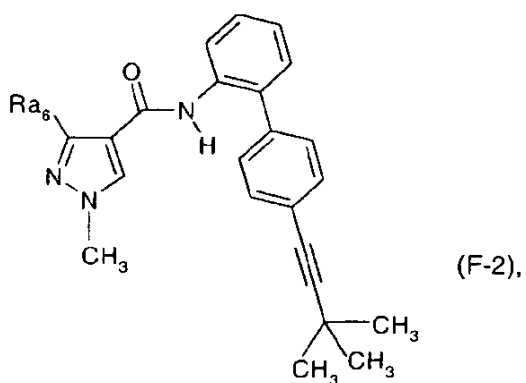
【化 1 2 8】



10

{式中、 Ra_5 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 2004/058723) +TX、以下の式 (F-2) :

【化 1 2 9】

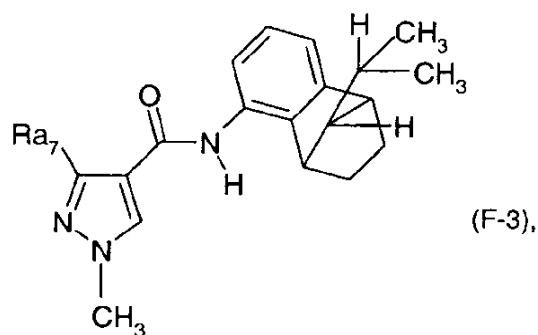


20

{式中、 Ra_6 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 2004/058723) +TX、以下の式 (F-3) (syn) :

30

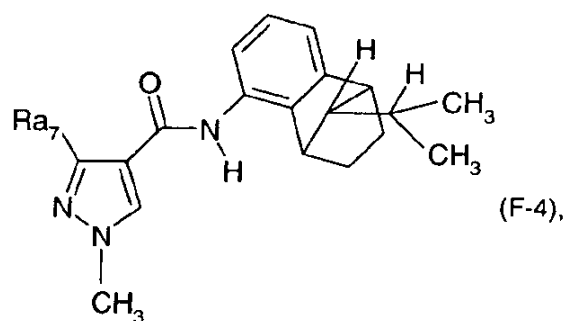
【化 1 3 0】



40

{式中、 Ra_7 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表されるラセミ化合物 (WO 2004/035589) +TX、以下の式 (F-4) (anti) :

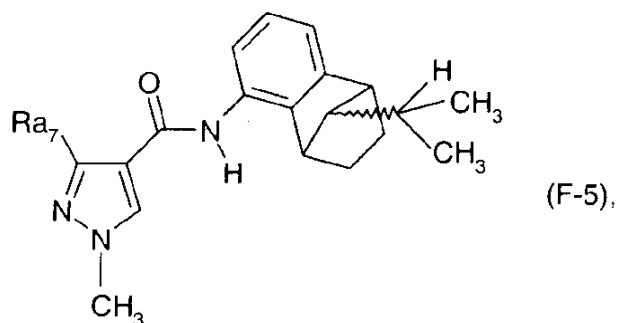
【化 1 3 1】



10

{式中、 Ra_7 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表されるラセミ混合物 (WO 2004/035589) +TX、式 (F-3) (syn) と (F-4) (anti) によって表されるラセミ化合物のエピマー混合物であって、ここで、式 (F-3) (syn) によって表されるラセミ化合物に対する、式 (F-4) (anti) によって表されるラセミ化合物の比が、1000:1~1:1000であり、且つ、以下の式 (F-5) :

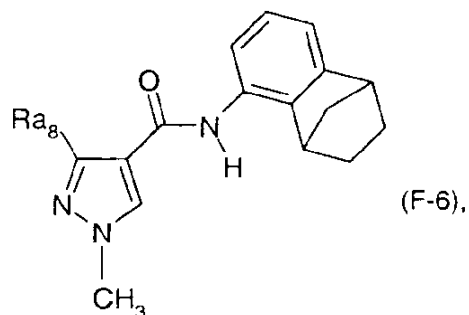
【化 1 3 2】



20

{式中、 Ra_7 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 2004/035589) +TX、以下の式 (F-6) :

【化 1 3 3】

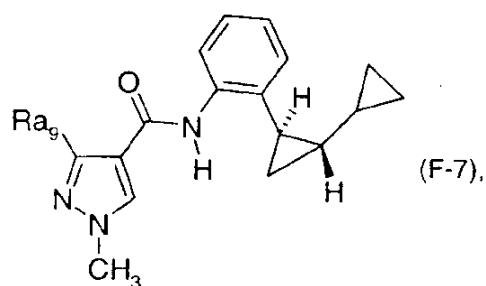


30

{式中、 Ra_8 が、トリフルオロメチルである又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 2004/035589) +TX、以下の式 (F-7) (trans) :

40

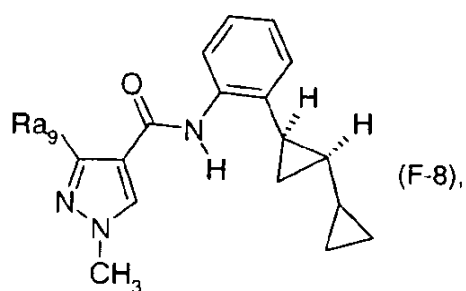
【化 1 3 4】



10

{式中、 Ra_9 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表されるラセミ化合物 (WO 03/074491) +TX、以下の式 (F-8) (cis) :

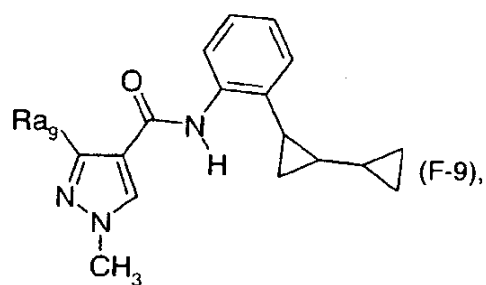
【化 1 3 5】



20

{式中、 Ra_9 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表されるラセミ化合物 (WO 03/074491) +TX、式 (F-7) (trans) と (F-8) (cis) によって表されるラセミ化合物の混合物であって、ここで、式 (F-7) (trans) によって表されるラセミ化合物に対する式 (F-8) (cis) によって表されるラセミ化合物の比が、2 : 1~100 : 1であり、且つ、以下の式 (F-9) :

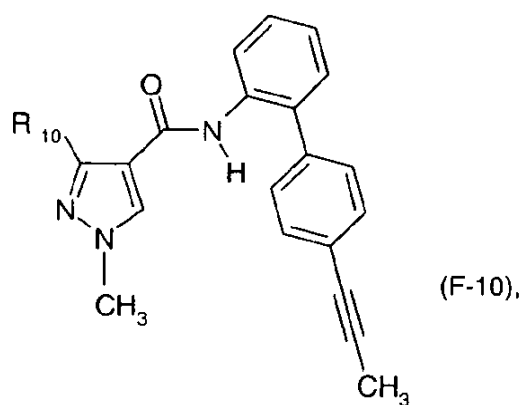
【化 1 3 6】



40

{式中、 Ra_9 が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 03/074491) +TX、以下の式 (F-10) :

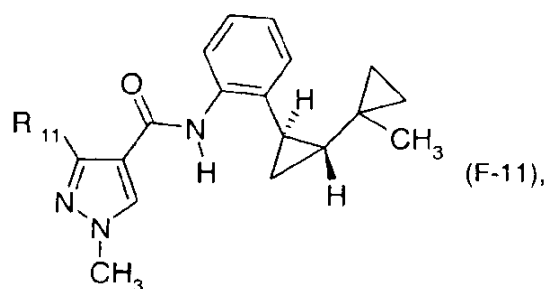
【化 1 3 7】



10

{式中、 R_{10} が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 2004/058723) +TX、以下の式 (F-11) (trans) :

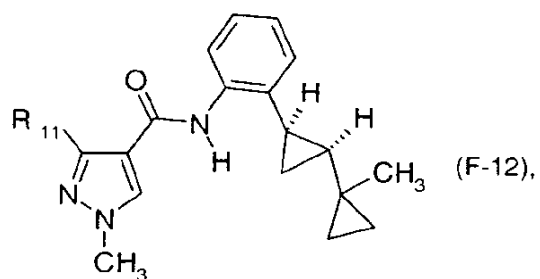
【化 1 3 8】



20

{式中、 R_{11} が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表されるラセミ化合物 (WO 03/074491) +TX、以下の式 (F-12) (cis) :

【化 1 3 9】

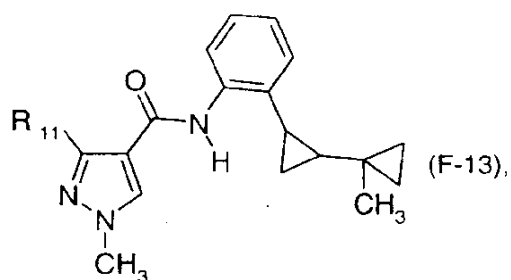


30

40

{式中、 R_{11} が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表されるラセミ化合物 (W003/074491) +TX、式 (F-11) (trans) と (F-12) (cis) のラセミ混合物である以下の式 (F-13) :

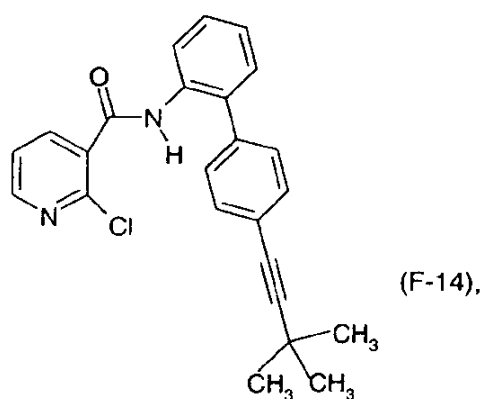
【化 1 4 0】



10

{式中、 R_{11} が、トリフルオロメチル又はジフルオロメチルである。} によって表される化合物 (WO 03/074491) +TX、以下の式 (F-14) :

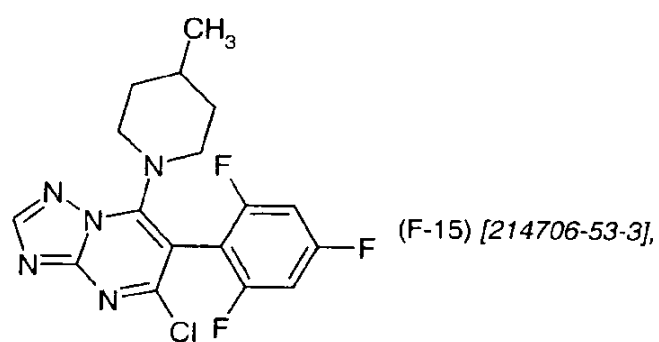
【化 1 4 1】



20

によって表される化合物 (WO 2004/058723) +TX、並びに以下の式 (F-15) :

【化 1 4 2】



40

によって表される化合物+TXから成る群から選択される生物活性化合物。

【0 2 7 8】

先に記載の有効成分と、表T1~T43から選択される式 (I) によって表される化合物の有効成分混合物には、好ましくは100 : 1~1 : 6000、特に50 : 1~1 : 50の混合比において、より特に20 : 1~1 : 20の比において、よりいっそう特に10 : 1~1 : 10、非常に特に5 : 1~1 : 5にて、表T1~T43から選択される化合物と、先に記載の有効成分が含まれ、1 : 1、若しくは5 : 1、若しくは5 : 2、若しくは5 : 3、若しくは5 : 4、若しくは4 : 1、若しくは4 : 2、若しくは4 : 3、若しくは3 : 1、若しくは3 : 2、若しくは2 : 1、若しくは1 : 5、若しくは

50

2:5、若しくは3:5、若しくは4:5、若しくは1:4、若しくは2:4、若しくは3:4、若しくは1:3、若しくは2:3、若しくは1:2、若しくは1:600、若しくは1:300、若しくは1:150、若しくは1:35、若しくは2:35、若しくは4:35、若しくは1:75、若しくは2:75、若しくは4:75、若しくは1:6000、若しくは1:3000、若しくは1:1500、若しくは1:350、若しくは2:350、若しくは4:350、若しくは1:750、若しくは2:750、若しくは4:750の比の中でも、2:1~1:2の比が特別に好まれ、そして、4:1~2:1の比が同じように好まれる。

【0279】

それらの混合比は、一方では質量比を、そして、もう一方ではモル比を含むことが理解されている。

10

【0280】

表T1~T43の中から選択される式(I)によって表される化合物と、1種類以上の、先に記載の有効成分を含む混合物が、例えば、単独の「調合済み」形態として、「タンク混合」などの、単独の有効成分構成要素から成る別々の製剤により構成される混合スプレー混合物として、並びに連続した様式で、すなわち、数時間若しくは数日間などの適度に短い期間で次々と施用される場合の、単独の有効成分の併用使用により施用されてもよい。表T1からT43まで選択される式(I)によって表される化合物と、先に記載の有効成分を施用する順序は、本発明を実施する上でそれほど重要ではない。

【0281】

有効成分の後ろの大括弧内の参照番号、例えば、[3878-19-1]は、ケミカル・アブストラクツ登録番号を表す。式(A-1)~(A-26)によって表される化合物は、WO 03/015518又はWO 04/067528に記載されている。先に記載された混合相手は公知である。有効成分が、「The Pesticide Manual」[The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council]に含まれている場合には、特定化合物について本明細書中に前出の丸括弧内にある記載番号の形でそこに記載されている；例えば、化合物「アバメクチン(abamectin)」は、記載番号(1)の形で記載されている。本明細書中で先に、「[CCN]」が特定化合物に付け加えられている場合には、問題の化合物は、インターネットでアクセス可能である「Compendium of Pesticide Common Names」中に含まれている[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names. Copyright 1995-2004]；例えば、化合物「アセトプロル(acetoprole)」は、インターネット・アドレス<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>の形で記載されている。

20

30

【0282】

先に記載した有効成分の大部分は、本明細書中で前述の、いわゆる「一般名」、関連する「ISO一般名」、又は個々の事例で使用されている別の「一般名」によって表される。指定が「一般名」でなければ、代わりに使用されている指定の内容が、特定化合物について丸括弧内に与えられている；その場合には、IUPAC名、IUPAC/ケミカル・アブストラクツ名、「化学名」、「伝統的な名称」、「化合物名」、又は「開発コード」が使用されるか、又はそれらの指定の中の1つも「一般名」も使用されないのであれば、「代替名」が採用されている。「CAS登録番号」は、ケミカル・アブストラクツ登録番号を意味している。

40

【0283】

生物学の実施例(%=別段の指定がないかぎり、質量パーセント)

実施例B1: スポドプテラ・リトラリス(*Soodootera littoralis*) (エジプシャン・コットン・リーフワーム) に対する活性:

綿葉ディスクを、24ウェル・マイクロタイター・プレート内の寒天上に置き、そして、試験溶液をスプレーする。乾燥後に、前記葉ディスクに5匹のL₁幼虫をはわせる。サンプルを、処理の3日後(DAT)に死滅率、忌避効果、食餌行動、及び成長調節に関して調査する。

【0284】

50

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.1、T15.1.91、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.1、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.91、T13.1.92、T13.1.361、T13.1.391、T13.1.91、T13.1.6、T13.1.96、T44.1.2、T13.1.8、T13.1.23、T13.1.93、T13.1.113、T13.1.21、T13.1.111は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

【0285】

実施例B2：オオタバコガ（*Heliothis virescens*）（タバコ・バドワーム）に対する活性：

卵（0～24時間齢）を、人工飼料上の24ウェル・マイクロタイター・プレート内に置き、そして、ピペットを使うことによって試験溶液で処理する。4日間のインキュベーション期間後に、サンプルを、卵の死滅率、幼虫の死滅率、及び成長調節に関して調査する。

10

【0286】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.1、T15.1.91、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.1、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.91、T13.1.92、T13.1.361、T13.1.391、T13.1.91、T13.1.6、T13.1.96、T44.1.2、T13.1.8、T13.1.23、T13.1.93、T13.1.113、T13.1.21、T13.1.111は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

【0287】

20

実施例B3：コナガ（*Plutella xylostella*）（ダイヤモンド・バック・モス）に対する活性：

人工飼料の入った24ウェル・マイクロタイター・プレート（MTP）を、ピペットを使って試験溶液で処理する。乾燥後に、前記MTPに、幼虫（L2）をはわせる（1ウェルあたり10～15匹）。5日間のインキュベーション期間の後に、サンプルを、幼虫の死滅率、摂食阻害剤、及び成長調節に関して調査する。

【0288】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.1、T15.1.91、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.1、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.91、T13.1.92、T13.1.361、T13.1.391、T13.1.91、T13.1.6、T13.1.96、T44.1.2、T13.1.8、T13.1.23、T13.1.93、T13.1.113、T13.1.21、T13.1.111は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

30

【0289】

実施例B4：ディアブロチカ・バルテアタ（*Diabrotica balteata*）（コーン・ルート・ワーム）に対する活性：

人工飼料の入った24ウェル・マイクロタイタープレート（MTP）を、ピペットを使って試験溶液で処理する。乾燥後に、前記MTPに、幼虫（L2）をはわせる（1ウェルあたり6～10匹）。5日間のインキュベーション期間の後に、サンプルを、幼虫の死滅率、摂食阻害剤、及び成長調節に関して調査する。

40

【0290】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.1、T15.1.91、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.91、T13.1.92、T13.1.91、T13.1.6、T13.1.96、T44.1.2、T13.1.8、T13.1.23、T13.1.113、T13.1.21、T13.1.111は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

【0291】

実施例B5：モモアカアブラムシ（*Myzus persicae*）（グリーン・ピーチ・エイフィド）に対する活性：（接触性）

ヒマワリ葉ディスクを、24ウェル・マイクロタイタープレート内の寒天上に置き、そし

50

て、試験溶液をスプレーする。乾燥後に、前記葉ディスクに、入り混じった齢数のアブラムシ個体群をはわせる。6日間のインキュベーション期間の後に、サンプルを、死滅率、及び特殊効果（例えば、植物毒性）に関して調査する。

【0292】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.91、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T13.1.92、T13.1.91、T13.1.96、T13.1.21は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

【0293】

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

10

入り混じった齢数のアブラムシ個体群をはわせたエンドウ苗の根を、試験溶液中に直接置く。導入の6日後に、サンプルを、死滅率、及び植物に対する特殊効果に関して調査する。

【0294】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T13.1.92、T13.1.6、T13.1.96、T13.1.93、T13.1.113、T13.1.21は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

【0295】

20

実施例B7：ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)（オニオン・スリップス）に対する活性：

ヒマワリ葉ディスクを、24ウェル・マイクロタイタープレート内の寒天上に置き、そして、試験溶液をスプレーする。乾燥後に、前記葉ディスクに、入り混じった齢数のアザミウマ個体群をはわせる。6日間のインキュベーション期間の後に、サンプルを、死滅率、及び特殊効果（例えば、植物毒性）に関して調査する。

【0296】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.91、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T16.1.91、T13.1.92、T13.1.91、T13.1.6、T13.1.96、T44.1.2、T13.1.93、T13.1.113、T13.1.21、T13.1.111は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

30

【0297】

実施例B8：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*)（ツースポット・スパイダー・マイト）に対する活性：

24ウェル・マイクロタイタープレート内の寒天上のマメ葉ディスクに、試験溶液をスプレーする。乾燥後に、前記葉ディスクに、入り混じった齢数のダニ個体群をはわせる。8日後に、ディスクを、卵の死滅率、幼虫の死滅率、及び成虫の死滅率に関して調査する。

【0298】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T9.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T13.1.21は、400ppmにて80%を超える活性を有する。

40

【0299】

実施例B9：スポドプテラ・リトラリス (*Soodoptera littoralis*)（コットン・リーフワーム）に対する浸透殺虫剤試験：

4日目のトウモロコシ苗（トウモロコシ (*zea mais*)、品種Stoneville）を、その中に化学物質を12.5ppmに希釈してある24mlの水が入ったバイアル内に置く。苗を、6日間、成長させる。それに続いて、葉を、切り取って、ペトリ皿（直径5cm）に置き、12~15匹の第1齢のS.リトラリス (*S. littoralis*) 幼虫をはわせ、そして、生育箱（25℃、50%r.h.、18：6のL：D光周期）内で4日間インキュベートする。生きている昆虫数を、カウント

50

し、そして、死滅百分率を計算した。試験を、1回反復しておこなった。

【0300】

この試験で、前記の表で列挙した化合物が、良好な活性を示している。具体的には、化合物T13.1.2、T15.1.1、T13.1.1、T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T17.1.2（ジアステレオマーB）、T13.1.92、T13.1.361、T13.1.391、T13.1.91、T13.1.6、T13.1.96、T44.1.2、T13.1.8、T13.1.23、T13.1.113には、80%を超える活性がある。

【0301】

実施例B10：コドリング（*Cydia pomonella*）（コドリング・モス）に対する活性：

標準的なシディア（*Cydia*）の食餌キューブ（幅1.5cm）を、ようじで刺し、そして、流動パラフィン（約80℃）中に浸す。パラフィン被膜が硬くなった後に、400ppmの有効成分を含む水性乳剤を、De Vilbiss噴霧器（25ml、1bar）を使用して施用する。スプレー被膜が乾いた後に、キューブをプラスチック・コンテナに入れ、次に、そこに2匹の新たに孵化したコドリング（第1齢）を住ませる。次に、そのコンテナを、プラスチック・キャップで閉じる。26℃、40～60%の相対湿度にて14日間のインキュベーション後に、イモムシの生存率、並びにそれらの成長調節を、測定する。

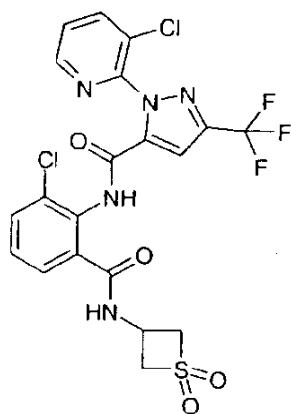
【0302】

この試験で、前記の表で列挙した化合物は、良好な活性を示している。具体的には、化合物T9.1.2（ジアステレオマーA）、T9.1.2（ジアステレオマーB）、T17.1.2（ジアステレオマーA）、T13.1.92には、80%を超える活性がある。

【0303】

実施例B11：本発明による化合物と、最新技術からの構造的に最もよく似ている化合物（WO 2003/015518の108ページに記載されている化合物番号296）との殺虫活性の比較：

【化143】



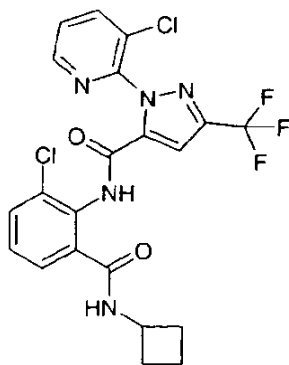
(本発明による化合物番号 T13.1.391)

10

20

30

【化 1 4 4】



(最新技術による化合物番号 296)

10

【0 3 0 4】

4日目のトウモロコシ苗（トウモロコシ（zea mais）、品種Stoneville）を、その中に化学物質を所定の濃度（3及び0.8ppm）に希釈した24mlの水が入ったバイアル内に個別に置く。苗を、6日間、成長させる。その葉を、切り取り、ペトリ皿（直径3.5cm）内に置き、12～15匹の第1齢のS.リトラリス（S. littoralis）幼虫をはわせ、そして、生育箱（25℃、50%r.h.、18：6のL：D光周期）内で4日間インキューベートする。生きている昆虫数を、カウントし、そして、死滅百分率を計算した。幼虫の成長に対する効果を、対照と比較し、そして、幼虫成長減退百分率を計算する。試験を、1回反復しておこなった。結果を、以下の表B11に示す：

20

【0 3 0 5】

【表 4 9】

表B11：アフリカヨトウ（*Spodoptera littoralis*）（鱗翅目：ヤガ科）
に対する浸透殺虫剤試験：

化合物：	濃度 (ppm)	4日間の死滅率 (%)	幼虫の成長低下 (対照に対する%)
Comp. 296 (最新技術)	3	0	0
Comp. 296 (最新技術)	0.8	0	0
Comp. T13. 1. 391 (発明)	3	55	100
Comp. T13. 1. 391 (発明)	0.8	10	0

30

【0 3 0 6】

表B11は、本発明による化合物番号T13.1.391が、最新技術からの化合物に比べて、スポドプテラ・リトラリス（*Spodoptera littoralis*）に対して実質的により良好な殺虫作用を発揮することを示している。特に、3ppmの施用量にて、本発明による化合物は、最新技術の化合物よりはるかに優れている。この高い効果は、これらの化合物の構造的な類似性に基づいて予想されるものではなかった。

40

フロントページの続き

- (51)Int.Cl. F I
- | | | | | | |
|----------------|--------------|------------------|----------------|--------------|----------|
| A 0 1 N | 43/56 | (2006.01) | A 0 1 N | 43/56 | D |
| A 0 1 N | 47/16 | (2006.01) | A 0 1 N | 47/16 | A |
| A 0 1 N | 57/36 | (2006.01) | A 0 1 N | 57/36 | Z |
- (74)代理人 100108903
弁理士 中村 和広
- (74)代理人 100145436
弁理士 小池 慎太郎
- (72)発明者 ミューレバハ, ミヒエル
スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ジャンギユナ, アンドレ
スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト
- (72)発明者 ホール, ロジャー グラハム
スイス国, ツェーハー 4 0 5 8 バーゼル, シュバルツバルトアレー 2 1 5, シンジエンタ
クロップ プロテクション アクチェンゲゼルシャフト

審査官 太田 千香子

- (56)参考文献 国際公開第 9 6 / 0 2 6 2 0 3 (WO, A 1)
特開平 0 3 - 1 8 8 0 7 4 (J P, A)
特開平 0 2 - 0 0 1 4 4 7 (J P, A)
特開昭 5 6 - 1 2 7 3 3 9 (J P, A)
特表 2 0 0 3 - 5 2 9 5 4 6 (J P, A)
特開昭 5 9 - 1 6 1 3 5 4 (J P, A)
国際公開第 9 9 / 0 1 9 2 9 7 (WO, A 1)
特開 2 0 0 8 - 2 8 5 4 6 4 (J P, A)
UNTERHALT. B, ARCHIV DER PHARMAZIE, ドイツ, VCH VERLAGSGESELLSCHAFT MBH, 1 9 9 0 年, V
323, P317-318
ROMVRDOWSKA M D, TETRAHEDRON: ASYMMETRY, 英国, PERGAMON, 1 9 9 4 年, V5 N7, P1327-1332
Synlett, 1 9 9 1 年, No.11, p.783-4
Journal of the American Chemical Society, 1 9 6 2 年, Vol.84, p.399-402
DIGGLE A.W., BULLETIN DE LA SOCIETE CHIMIQUE DE FRANCE, 1 9 8 8 年, P317-321
FRIGOLA J, JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 米国, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, 1 9 9 5 年
, V38 N7, P1203-1215
KURAMOTO Y, JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 米国, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, 2 0 0 3
年 9 月 4 日, V46 N10, P1905-1917
GRZEGORZ MLOSTON, HELVETICA CHIMICA ACTA, スイス, VERLAG HELVETICA CHIMICA ACTA, 2 0
0 5 年 3 月 1 日, V88, P1658-1663
BAUM K, JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, 米国, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, 1 9 8 3 年 9
月 9 日, V48 N18, P2953-2956

- (58)調査した分野(Int.Cl., D B 名)
- | | |
|---------|-------------|
| A 0 1 N | 4 3 / 5 6 |
| C 0 7 D | 4 0 9 / 1 4 |
| C 0 7 D | 4 0 1 / 1 4 |

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