

(19) 日本国特許庁(JP)

## (12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6849687号  
(P6849687)

(45) 発行日 令和3年3月24日(2021.3.24)

(24) 登録日 令和3年3月8日(2021.3.8)

(51) Int.Cl.

F 1

AO1N 43/08 (2006.01)

AO1N 43/08

F

AO1P 5/00 (2006.01)

AO1P 5/00

C07D 307/68 (2006.01)

C07D 307/68

請求項の数 6 (全 54 頁)

(21) 出願番号	特願2018-534658 (P2018-534658)
(86) (22) 出願日	平成28年12月8日 (2016.12.8)
(65) 公表番号	特表2019-505507 (P2019-505507A)
(43) 公表日	平成31年2月28日 (2019.2.28)
(86) 国際出願番号	PCT/US2016/065580
(87) 国際公開番号	W02017/116646
(87) 国際公開日	平成29年7月6日 (2017.7.6)
審査請求日	令和1年10月15日 (2019.10.15)
(31) 優先権主張番号	62/272,728
(32) 優先日	平成27年12月30日 (2015.12.30)
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国(US)
(31) 優先権主張番号	62/353,795
(32) 優先日	平成28年6月23日 (2016.6.23)
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国(US)

(73) 特許権者	390023674 イー・アイ・デュポン・ドウ・ヌムール・ アンド・カンパニー E. I. DU PONT DE NEMO URS AND COMPANY アメリカ合衆国デラウエア州19805. ウィルミントン. センターロード974. ピー・オー・ボックス2915. チェスナ ット・ラン・プラザ
(74) 代理人	100127926 弁理士 結田 純次
(74) 代理人	100140132 弁理士 竹林 則幸

最終頁に続く

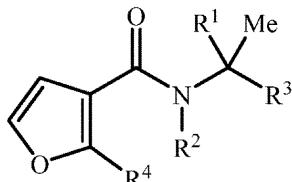
(54) 【発明の名称】殺線虫性複素環式アミド

## (57) 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

式 1、

## 【化 1】



10

(式中、

R<sup>1</sup> は、H またはメチルであり；R<sup>2</sup> は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオもしくはC<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニルであり；R<sup>3</sup> は、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルケニルまたはC<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアル

20

キルであり；

R<sup>4</sup>は、C1またはBrであり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルである）

から選択される化合物を含む、殺線虫剤組成物。

#### 【請求項2】

R<sup>2</sup>が、Hであり；

R<sup>3</sup>が、-CR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>R<sup>6c</sup>であり；

R<sup>4</sup>が、C1またはBrであり；

R<sup>6a</sup>が、H、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルケニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>6b</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sup>6c</sup>が、Hまたは- CR<sup>7a</sup>R<sup>7b</sup>R<sup>7c</sup>であり；

R<sup>7a</sup>が、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

R<sup>7b</sup>が、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

R<sup>7c</sup>が、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルである、請求項1に記載の組成物。

#### 【請求項3】

界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分をさらに含み、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を任意選択的にさらに含む請求項1または2に記載の組成物。

#### 【請求項4】

前記少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤が、アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミブリド、アクリナトリン、アフイドピロベン、アミドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス-メチル、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ビフェントリン、ビフェナゼート、ビストリフルロン、ボレート、ブプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カルゾール、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリリン、シクロキサブリド、シフルメトフェン、シフルトリリン、ベータ-シフルトリリン、シハロトリリン、ガンマ-シハロトリリン、ラムダ-シハロトリリン、サイパーメトリン、アルファ-サイパーメトリン、ゼータ-サイパーメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジエルドリン、ジフルベンズロン、ジメフルトリリン、ジメハイポ、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキサゾール、フェンプタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリリン、フェンバレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルシリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルフェンスルホン、フルオルピラム、フルピラジフロン、フルバリネット、タウ-フルバリネット、ホノホス、ホルメタネット、ホスチアゼート、ハロフェノジド、ヘプタフルトリリン、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ヒドラメチルノン、イミダクロブリド、インドキサカルブ、殺虫剤石鹼、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メペルフルトリノン、メタフルミゾン、メタルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メチオジカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリノン、モノクロトホス、モノフルオロトリノン、ニコチノン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオン-メチル、ペルメトリノン、ホレート、ホサロン、ホスマット、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリノン、プロパルギット、プロトリフェンビュート、ピフルブミド、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピロパルギット、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロ

10

20

30

40

50

ビン、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフェン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルプロホス、スルホキサフロル、テブフェノジド、テブフェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テルブホス、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ - ナトリウム、チオキサザフェン、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタ - エンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウィルスおよび昆虫病原性真菌類からなる群から選択される、請求項3に記載の組成物。

10

#### 【請求項 5】

前記少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物または剤が、アバメクチン、アセタミブリド、アクリナトリン、アフィドピロベン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ビフェントリン、ブプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、サイパー - メトリン、アルファ - サイパー - メトリン、ゼータ - サイパー - メトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフェンブロックス、エトキサゾール、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルフェンスルホン、フルピプロール、フルピラジフロン、フルバリネット、ホルメタネット、ホスチアゼート、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロブリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メペルフルトリン、メタフルミゾン、メチオジカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノフルオロトリン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ピフルブミド、ピメトロジン、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリミノストロビン、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフロル、テブフェノジド、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ - ナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタ - エンドトキシン、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) の全菌株および核多核体病ウィルスの全菌株からなる群から選択される、請求項4に記載の組成物。

20

#### 【請求項 6】

前記化合物が、処理前の種子の約 0.0001 ~ 1 重量 % の量で存在する、請求項 1 または 2 に記載の組成物を含む、処理済み種子。

30

#### 【発明の詳細な説明】

##### 【技術分野】

##### 【0001】

本発明は、農学的および非農学的使用に適したある特定の複素環式アミドおよびそれらの組成物、ならびに農学的環境および非農学的環境の両方における寄生線虫を防除するためのそれらの使用の方法に関する。

##### 【背景技術】

##### 【0002】

植物寄生線虫の防除は、高い作物効率を達成する際に極めて重要である。線虫に誘導された根損傷は、作物収率および品質のかなりの低下をもたらし、それにより、消費者にと

40

50

つて費用の増加をもたらし得る。線虫寄生虫での駆虫剤への耐性の広範な発生のせいで、線虫は、利用可能な化学療法剤にもかかわらず、家畜に問題を引き起こし続けている。

**【発明の概要】**

**【発明が解決しようとする課題】**

**【0003】**

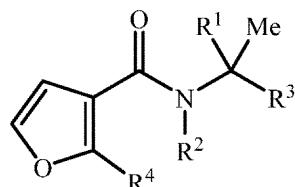
より有効、より安価、より少ない毒性で、環境的により安全であるか、または異なる作用様式を有する新たな化合物に対して必要性が継続してある。

**【課題を解決するための手段】**

**【0004】**

本発明は、式1の化合物（すべての立体異性体を含む）およびそれらを含有する組成物、ならびに寄生線虫を防除するためのそれらの使用に関する：

**【化1】**



1

10

20

(式中、

R<sup>1</sup>は、Hまたはメチルであり；

R<sup>2</sup>は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup>は、それが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、C<sub>1</sub>またはBrであり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはS i R<sup>a</sup> R<sup>b</sup> R<sup>c</sup>であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

但し、(i) R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>がHである場合、R<sup>3</sup>は、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキニル、シクロプロピル、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、非置換C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、またはC<sub>1</sub>もしくはBrで置換されたC<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキル以外であり；(ii) R<sup>1</sup>がメチルである場合、R<sup>3</sup>は、エチル以外であり；および(iii) R<sup>1</sup>が、Hであり、かつR<sup>2</sup>がメチルである場合、R<sup>3</sup>は、エチル以外であることを条件とする)。

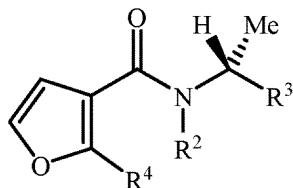
**【0005】**

本発明はまた、式1aの化合物およびそれらを含有する組成物、ならびに寄生線虫を防除するためのそれらの使用に関する：

30

40

## 【化2】



1a

10

(式中、

R<sup>2</sup>は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup>は、それが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、C1、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはS i R<sup>a</sup> R<sup>b</sup> R<sup>c</sup>であり；

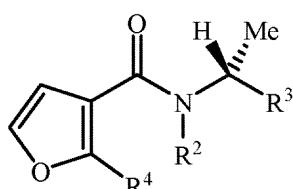
R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである)

## 【0006】

本発明はまた、式1aの化合物およびそれらを含有する組成物、ならびに寄生線虫を防除するためのそれらの使用に関する：

## 【化3】

30



1a

(式中、

40

R<sup>2</sup>は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup>は、それが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、C1、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>ア

50

ルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニル、またはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルであり；

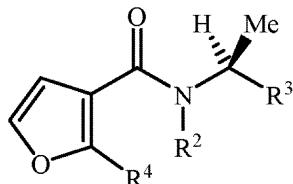
但し、(i) R<sup>2</sup>がHである場合、R<sup>3</sup>は、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキニル、シクロプロピル、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>SC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、非置換C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、またはC<sub>1</sub>もしくはBrで置換されたC<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキル以外であり；および(ii) R<sup>2</sup>がメチルである場合、R<sup>3</sup>は、エチル以外であることを条件とする)。

【0007】

10

本発明はまた、式1bの化合物およびそれらを含有する組成物、ならびに寄生線虫を防除するためのそれらの使用に関する：

【化4】



1b

20

(式中、

R<sup>2</sup>は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup>は、それが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、C<sub>1</sub>、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

30

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

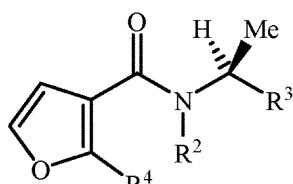
R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである)。

【0008】

40

本発明はまた、式1bの化合物およびそれらを含有する組成物、ならびに寄生線虫を防除するためのそれらの使用に関する：

【化5】



1b

50

(式中、

$R^2$  は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個の $R^5$ で置換された、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ アルキルカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ アルコキシカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ アルキルチオもしくは $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルであり；

$R^3$  は、それが、非置換であるか、または少なくとも1個の $R^6$ で置換された、 $C_2 \sim C_{16}$ アルキル、 $C_2 \sim C_{16}$ アルケニル、 $C_2 \sim C_{16}$ アルキニルまたは $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

$R^4$  は、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

各 $R^5$ は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニルまたは $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルであり；

各 $R^6$ は、独立して、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

$R^a$ 、 $R^b$ および $R^c$ はそれぞれ、独立して、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

但し、(i)  $R^2$ がHである場合、 $R^3$ は、 $C_2 \sim C_3$ アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ アルキニル、シクロプロピル、-CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>SCH<sub>3</sub>、非置換C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、またはC<sub>1</sub>もしくはBrで置換されたC<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルキル以外であり；および(ii)  $R^2$ がメチルである場合、 $R^3$ は、エチル以外である)。

#### 【0009】

本発明はまた、式1、式1aまたは式1bの化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とを含む組成物を提供する。一実施形態において、本発明はまた、式1、式1aまたは式1bの化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とを含む組成物を提供する。寄生線虫を防除するための組成物であって、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を任意選択的にさらに含む組成物を提供する。

#### 【0010】

本発明は、寄生線虫を防除する方法であって、寄生線虫またはその環境を、生物学的有効量の式1、式1aまたは式1bの化合物（例えば、本明細書で記載される組成物としての）と接触させるステップを含む方法を提供する。本発明はまた、寄生線虫またはその環境が、生物学的有効量の式1、式1aまたは式1bの化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とを含む組成物であって、生物学的有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を任意選択的にさらに含む組成物と接触させられるような方法に関する。

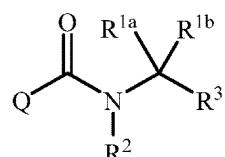
#### 【0011】

本発明はまた、種子を寄生線虫から保護する方法であって、種子を、生物学的有効量の式1、式1aまたは式1bの化合物（例えば、本明細書で記載される組成物としての）と接触させるステップを含む方法を提供する。本発明はまた、処理された種子に関する。

#### 【0012】

本発明はまた、寄生線虫を防除する方法であって、寄生線虫またはその環境を、生物学的有効量の式2

#### 【化6】



(式中、

Qは、フラン、チオフェンまたはチアゾール環がそれを通して式2の残部に結合されている炭素原子に隣接する炭素原子にてR<sup>4</sup>で置換されたフラン、チオフェンまたはチアゾールであり；

R<sup>1a</sup>は、それぞれが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>1b</sup>は、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sup>1a</sup>およびR<sup>1b</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された3～6員シクロアルキル環を形成し；

R<sup>2</sup>は、H；またはそれぞれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup>は、それぞれが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；但し、R<sup>4</sup>がMeである場合、R<sup>3</sup>は、非置換C<sub>2</sub>アルキル以外であり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、またはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>はそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである)の化合物と接触させるステップを含む方法を提供する。

### 【0013】

本発明はまた、寄生線虫またはその環境が、生物学的有効量の式2の化合物と、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とを含む組成物であって、生物学的有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物もしくは剤を任意選択的にさらに含む組成物と接触させられるような方法に関する。 30

### 【0014】

本発明はまた、種子を寄生線虫から保護する方法であって、種子を、生物学的有効量の式2の化合物(例えば、本明細書で記載される組成物としての)と接触させるステップを含む方法を提供する。本発明はまた、処理された種子に関する。

### 【発明を実施するための形態】

### 【0015】

本明細書で使用される場合、用語「含む(comprises)」、「含む(comprising)」、「含む(includes)」、「含む(including)」、「有する(has)」、「有する(having)」、「含有するcontains)」、「含有する(containing)」、「で特徴付けられる(characterized by)」、またはそれらの任意の他の変形は、明確に示される任意の制限を受けて、非排他的な包含に及ぶことが意図される。例えば、要素のリストを含む組成物、混合物、プロセスもしくは方法は、それらの要素のみに必ずしも限定されないが、明確にリストされないか、またはそのような組成物、混合物、プロセスもしくは方法に固有の他の要素を含んでもよい。

### 【0016】

移行句「からなる(consisting of)」は、明記されていないあらゆる要素、ステップ、または原料を除外する。特許請求の範囲における場合、そのようなものは

10

20

30

40

50

、それらと通常関係がある不純物を除いて列挙されるもの以外の材料の包含に対して特許請求の範囲をクローズする。句「からなる」が、前文の直後よりもむしろ、請求項の本体の条項に現れる場合、それは、その条項に示される要素のみを限定し、他の要素は、全体として請求項から排除されない。

#### 【0017】

移行句「本質的に～からなる」は、文字通りに開示されたものに加えて、材料、ステップ、特色、成分または要素を含む組成物または方法を定義するために使用されるが、但し、これらの追加の材料、ステップ、特色、成分または要素が、特許請求された本発明の基本的および新規な特徴に実質的に影響を与えないことを条件とする。用語「から本質的になる」は、「含む」と「からなる」との間の中間の立場を占める。

10

#### 【0018】

出願人らが、発明またはその一部を、「含む（comprising）」などの開放端用語で定義している場合、（特に述べられない限り）この記載が、用語「から本質的になる」または「からなる」を使用してそのような発明をまた記載していると解釈されるべきであることが容易に理解されるはずである。

#### 【0019】

さらに、それとは反対に明確に述べられない限り、「または」は、包括的な「または」を意味し、排他的な「または」を意味しない。例えば、条件A「または」Bは、以下のいずれか1つによって満たされる：Aが真であり（または存在し）かつBが偽である（または存在しない）；Aが偽であり（または存在せず）かつBが真である（または存在する）；ならびにAおよびBの両方ともが真である（または存在する）。

20

#### 【0020】

また、本発明の要素または成分に先行する不定冠詞「a」および「a n」は、要素または成分の場合（すなわち、出現）の数に関して非限定的であることが意図される。したがって、「a」および「a n」は、1つまたは少なくとも1つを含むと読み取られるべきであり、要素または成分の単数語形は、その数が明白に単数であると意味されない限り複数も含む。

#### 【0021】

本開示および特許請求の範囲で使用される場合、用語「線虫」は、線形動物門（Phylum Nematoda）の生物を意味する。一般に定義されるとおりに、「寄生虫」は、「宿主」と記載される別の生物（例えば、植物、動物またはヒト）内で生きもしくは成長するか、またはそれを常食とする。本開示および特許請求の範囲で言及されるとおりに、「寄生線虫」は、特に、植物、動物（特に脊椎動物）またはヒトの組織を傷害しもしくは損傷し、またはそれらの他の形態の疾患を引き起こす線虫である。

30

#### 【0022】

寄生虫「感染」は、植物、ヒトまたは動物に危険を及ぼす数の寄生虫の存在を意味する。存在は、環境内、例えば、ヒト家屋もしくは動物小屋内、または周囲地所もしくは構造物内、農業作物もしくは他の種類の植物上、動物用床敷内、動物の皮膚もしくは毛皮上などであり得る。言及される感染が動物内、例えば、血液または他の内部組織内である場合、用語感染は、別に述べられない限り、その用語が当技術分野で一般に理解されるとおりの用語「感染」と同義語であることも意図される。

40

#### 【0023】

本開示および特許請求の範囲で言及されるとおりに、用語「殺寄生虫の」および「殺寄生虫的に」は、線虫からの植物、動物またはヒトの保護を与えるための寄生線虫に対する観察可能な効果を意味する。殺寄生虫効果は、典型的には標的寄生線虫の出現または活動の減少に関連する。線虫に対するこのような効果には、壊死、死、成長の遅延、移動性の減少または宿主植物、動物もしくはヒト上もしくは内に残存する能力の低下、摂取の減少および繁殖の阻害が含まれる。寄生線虫に対するこれらの効果は、植物、動物またはヒトの寄生虫侵入または感染の防除（予防、減少または排除）を与える。したがって、寄生線虫の「防除」は、線虫に対する殺寄生虫効果の達成を意味する。寄生線虫を防除するため

50

の化合物の適用の文脈における表現「殺寄生虫的有効量」および「生物学的有効量」は、寄生線虫を防除するのに十分である化合物の量を意味する。

#### 【0024】

用語「農学的な」は、食物および纖維のためなどの農作物の生産を意味し、大豆および他のマメ科植物、穀物（例えば、小麦、オート麦、大麦、ライ麦、米、メイズ／トウモロコシ）、葉物野菜（例えば、レタス、キャベツ、および他のアブラナ科アブラナ属の作物）、結果野菜（例えば、トマト、コショウ、ナス、十字花植物およびウリ科植物）、ジャガイモ、サツマイモ、ブドウ、綿、果樹（例えば、ナシ状果、核果および柑橘類）、小果（例えば、ベリーおよびサクランボ）ならびに他の特産作物（例えば、キャノーラ、ヒマワリおよびオリーブ）の成長を含む。 10

#### 【0025】

用語「非農学的」は、農作物以外、例えば、園芸作物（例えば、田畠で成長させられない温室植物、苗床植物または観賞植物）、居住の、農業の、商業のおよび工業構造物、芝生（例えば、芝農場、牧場、ゴルフコース、芝土、スポーツフィールドなど）、木製品、貯蔵製品、農森林管理および植物管理、公衆衛生（すなわち、ヒト）および動物健康（例えば、家畜化された動物、例えば、ペット、家畜および家禽、家畜化されていない動物、例えば、野生生物）用途を意味する。

#### 【0026】

非農学的用途には、保護されるべき動物に、典型的には獣医学使用のために製剤化された組成物の形態で、殺寄生虫的有効（すなわち、生物学的有効）量の本発明の化合物を投与することによって、動物を寄生線虫から保護することが含まれる。 20

#### 【0027】

上の列挙において、単独、または複合語、例えば、「ハロアルキル」でのいずれかで使用される、用語「アルキル」には、直鎖または分岐アルキル、例えば、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、または種々のブチル、ペンチルもしくはヘキシリ異性体が含まれる。「アルケニル」には、直鎖もしくは分岐アルケン、例えば、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、ならびに種々のブテニル、ペンテニルおよびヘキセニル異性体が含まれる。「アルケニル」にはまた、ポリエン、例えば、1,2-プロパジエニルおよび2,4-ヘキサジエニルが含まれる。「アルキニル」には、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニルならびに種々のブチニル、ペンチニルおよびヘキシニル異性体などの直鎖もしくは分岐アルキンが含まれる。「アルキニル」にはまた、2,5-ヘキサジイニルなどの複数の三重結合からなる部分が含まれ得る。 30

#### 【0028】

「アルコキシ」には、例えば、メトキシ、エトキシ、n-プロピルオキシ、イソプロピルオキシならびに種々のブトキシ、ペントキシおよびヘキシリオキシ異性体が含まれる。

#### 【0029】

「シクロアルキル」には、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシリが含まれる。用語「シクロアルキルアルキル」は、アルキル部分上のシクロアルキル置換を意味する。「シクロアルキルアルキル」の例には、シクロプロピルメチル、シクロペンチルエチル、および直鎖または分岐アルキル基に結合した他のシクロアルキル部分が含まれる。 40

#### 【0030】

用語「ハロゲン」には、単独もしくは「ハロアルキル」などの複合語でのいずれかで、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で使用される場合、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素が含まれる。さらに、「ハロアルキル」などの複合語で使用される場合、または「ハロゲンで置換されたアルキル」などの記載で使用される場合、前記アルキルは、同じまたは異なるてもよいハロゲン原子で部分または完全置換されていてよい。「ハロアルキル」または「ハロゲンで置換されたアルキル」の例には、F<sub>3</sub>C-、C<sub>1</sub>CH<sub>2</sub>-、CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>-およびCF<sub>3</sub>CCl<sub>2</sub>-が含まれる。

#### 【0031】

用語「アルキルチオ」には、直鎖または分岐アルキルチオ部分、例えば、メチルチオ、エチルチオならびに種々のプロピルチオ、ブチルチオ、ペンチルチオおよびヘキシリチオ異性体が含まれる。「アルキルスルフィニル」には、アルキルスルフィニル基の両方のエナンチオマーが含まれる。「アルキルスルフィニル」の例には、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})^-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})^-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})^-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})^-$ ならびに種々のブチルフルフィニル、ペンチルスルフィニルおよびヘキシリスルフィニル異性体が含まれる。「アルキルスルホニル」の例には、 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ ならびに種々のブチルスルホニル、ペンチルスルホニルおよびヘキシリスルホニル異性体が含まれる。本明細書で使用される場合の化学略語 $\text{S}(\text{O})$ および $\text{S}(=\text{O})$ は、スルフィニル部分を表す。<sup>10</sup>本明細書で使用される場合の化学略語 $\text{SO}_2$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$ および $\text{S}(=\text{O})_2$ は、スルホニル部分を表す。

## 【0032】

「アルキルカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})$ 部分に結合した直鎖または分岐アルキル部分を意味する。本明細書で用いられるような化学略語 $\text{C}(\text{O})$ および $\text{C}(=\text{O})$ は、カルボニル部分を表す。「アルキルカルボニル」の例には、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ および $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ が含まれる。

## 【0033】

「アルコキシカルボニル」は、 $\text{C}(=\text{O})_2$ 部分に結合した直鎖または分岐アルキル部分を意味する。本明細書で使用される場合の化学略語 $\text{CO}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$ および $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ は、オキシカルボニル部分を表す。「アルコキシカルボニル」の例には、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ および $\text{C}(\text{O})\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$ が含まれる。<sup>20</sup>

## 【0034】

置換基中の炭素原子の合計数は、「 $\text{C}_{i \sim j}$ 」接頭辞によって示される。例えば、 $\text{C}_{1 \sim 6}$ アルキルは、メチル、エチル、ならびに種々のプロピル、ブチル、ペンチルおよびヘキシリ異性体を表す。

## 【0035】

本明細書で使用される場合、別に示されない限り、以下の定義が適用されるものとする。<sup>30</sup>用語「任意選択的に置換された」は、語句「置換されたまたは非置換の」と、または用語「(非)置換の」と交換可能に使用される。表現「1~4個の置換基で任意選択的に置換された」は、置換基がまったく存在しないか(すなわち、非置換であるか)、または1、2、3もしくは4個の置換基が存在する(利用可能な結合位置の数で限定される)ことを意味する。別に示されない限り、任意選択的に置換された基は、その基のそれぞれの置換可能な位置で置換基を有していてよく、それぞれの置換は他から独立している。

## 【0036】

芳香族および非芳香族複素環式環および環系の調製を可能にするための多種多様な合成方法が当技術分野で公知であり；広範な概説については、全8巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R.Katritzky and C.W.Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984および全12巻のComprehensive Heterocyclic Chemistry II, A.R.Katritzky, C.W.Rees and E.F.V.Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996を参照されたい。<sup>40</sup>

## 【0037】

式1、式1aまたは式1bから選択される化合物は、2つ以上の形態で存在してもよく、したがって、式1、式1aまたは式1bは、式1、式1aまたは式1bが表す化合物の結晶および非結晶形態をすべて含む。非結晶性形態には、ワックスおよびゴムなどの固体である実施形態、ならびに溶液および溶融物などの液体である実施形態が含まれる。結晶性形態には、本質的に単一の結晶型を表す実施形態、および多形体(すなわち、異なる結<sup>50</sup>

晶型)の混合物を表す実施形態が含まれる。用語「多形体」は、異なる結晶形態で結晶化することができる化合物の特定の結晶形態を意味し、これらの形態は、結晶格子で分子の異なる配置および/または立体配座を有する。多形体は同じ化学組成を有することができるが、それらは格子内で弱く、または強く結合していることができる共結晶化水または他の分子の存在または非存在のために組成が異なることができる。多形体は、結晶の形状、密度、硬度、色、化学的安定性、融点、吸湿性、懸濁性、溶出速度および生物学的利用率のような化学的、物理的および生物学的特性が相違することができる。当業者は、式1、式1aまたは式1bで表される化合物の多形体が、式1、式1aまたは式1bで表される同じ化合物の別の多形体または多形体の混合物に対して有益な効果(例えば、有用な处方物の調製の好適性、改善された生物学的性能)を示し得ることを理解する。式1、式1aまたは式1bで表される化合物の特定の多形体の調製および単離は、例えば、選択される溶媒および温度を使用する結晶化を含む、当業者に公知の方法によって達成することができる。  
10

## 【0038】

発明の概要で記載されたとおりの本発明の実施形態には、以下に記載されるものが含まれる。以下の実施形態では、式1、式1aまたは式1bの化合物への言及には、実施形態でさらに定義されない限り、発明の概要で明記された置換基の定義が含まれる。

## 【0039】

実施形態1. 式1aの化合物。

## 【0040】

実施形態2. 式1bの化合物。

## 【0041】

実施形態3. R<sup>2</sup>が、Hである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0042】

実施形態4. R<sup>3</sup>が、それぞれが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0043】

実施形態4a. R<sup>3</sup>が、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>ハロアルキルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0044】

実施形態4b. R<sup>3</sup>が、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはシクロプロピルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0045】

実施形態c. R<sup>3</sup>が、イソプロピル、s-ブチル、t-ブチル、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>またはシクロプロピルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0046】

実施形態4d. R<sup>3</sup>が、t-ブチルまたはシクロプロピルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0047】

実施形態4e. R<sup>3</sup>が、イソプロピルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0048】

実施形態4f. R<sup>3</sup>が、s-ブチルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0049】

実施形態4g. R<sup>3</sup>が、t-ブチルである、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0050】

実施形態4h. R<sup>3</sup>が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>である、式1、式1aまたは式1bの化合物。

## 【0051】

実施形態4i. R<sup>3</sup>が、シクロプロピルである、式1、式1aまたは式1bの化合物  
50

。

## 【0052】

実施形態5 . R<sup>3</sup> が、イソプロピルである、式1の化合物。

## 【0053】

実施形態5 a . R<sup>3</sup> が、s-ブチルである、式1の化合物。

## 【0054】

実施形態5 b . R<sup>3</sup> が、t-ブチルである、式1の化合物。

## 【0055】

実施形態5 c . R<sup>3</sup> が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> である、式1の化合物。

## 【0056】

実施形態5 d . R<sup>3</sup> が、シクロプロピルである、式1の化合物。

## 【0057】

実施形態6 . R<sup>3</sup> が、イソプロピルである、式1 a の化合物。

## 【0058】

実施形態6 a . R<sup>3</sup> が、s-ブチルである、式1 a の化合物。

## 【0059】

実施形態6 b . R<sup>3</sup> が、t-ブチルである、式1 a の化合物。

## 【0060】

実施形態6 c . R<sup>3</sup> が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> である、式1 a の化合物。

## 【0061】

実施形態6 d . R<sup>3</sup> が、シクロプロピルである、式1 a の化合物。

## 【0062】

実施形態7 . R<sup>3</sup> が、イソプロピルである、式1 b の化合物。

## 【0063】

実施形態7 a . R<sup>3</sup> が、s-ブチルである、式1 b の化合物。

## 【0064】

実施形態7 b . R<sup>3</sup> が、t-ブチルである、式1 b の化合物。

## 【0065】

実施形態7 c . R<sup>3</sup> が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> である、式1 b の化合物。

## 【0066】

実施形態7 d . R<sup>3</sup> が、シクロプロピルである、式1 b の化合物。

## 【0067】

実施形態8 . R<sup>4</sup> が、Cl または Br である、式1、式1 a または式1 b の化合物。

## 【0068】

実施形態8 a . R<sup>4</sup> が、Cl である、式1、式1 a または式1 b の化合物。

## 【0069】

実施形態8 b . R<sup>4</sup> が、Br である、式1、式1 a または式1 b の化合物。

## 【0070】

実施形態9 . R<sup>4</sup> が、Cl または Br である、式1の化合物。

## 【0071】

実施形態9 a . R<sup>4</sup> が、Cl である、式1の化合物。

## 【0072】

実施形態9 b . R<sup>4</sup> が、Br である、式1の化合物。

## 【0073】

実施形態10 . R<sup>4</sup> が、Cl または Br である、式1 a の化合物。

## 【0074】

実施形態10 a . R<sup>4</sup> が、Cl である、式1 a の化合物。

## 【0075】

実施形態10 b . R<sup>4</sup> が、Br である、式1 a の化合物。

## 【0076】

10

20

30

40

50

実施形態 11 . R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> または Br である、式 1 b の化合物。

【 0 0 7 7 】

実施形態 11 a . R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> である、式 1 b の化合物。

【 0 0 7 8 】

実施形態 11 b . R<sup>4</sup> が、 Br である、式 1 b の化合物。

【 0 0 7 9 】

上記の実施形態 1 ~ 11 b ならびに本明細書に記載した任意の他の実施形態を含む、本発明の実施形態は、任意の方法で組み合わせることができ、実施形態における変量の記述は、式 1 、式 1 a または式 1 b の化合物だけではなく式 1 、式 1 a または式 1 b の化合物を調製するために有用な出発化合物および中間体化合物にも関係する。さらに、上の実施形態 1 ~ 11 b ならびに本明細書に記載される任意の他の実施形態、ならびにそれらの任意の組み合わせを含む、本発明の実施形態は、本発明の組成物および方法に関係する。10

【 0 0 8 0 】

実施形態 1 ~ 11 b の組み合わせは、以下によって例証される：

実施形態 A .

R<sup>2</sup> が、 H であり；

R<sup>3</sup> が、 それぞれが、 非置換であるか、 または少なくとも 1 個の R<sup>6</sup> で置換された、 C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルまたは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> 、 Br 、 I 、 CH<sub>3</sub> 、 CF<sub>3</sub> またはシアノであり；

各 R<sup>6</sup> が、 独立して、 ハロゲン、 シアノ、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、 C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルチオ、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたは SiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；20

R<sup>a</sup> 、 R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> がそれぞれ、 独立して、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである、 式 1 a の化合物。

【 0 0 8 1 】

実施形態 B .

R<sup>2</sup> が、 H であり；

R<sup>3</sup> が、 C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> ハロアルキルであり；

R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> または Br である、 式 1 a の化合物。

【 0 0 8 2 】

実施形態 C .

R<sup>2</sup> が、 H であり；

R<sup>3</sup> が、 C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルまたはシクロプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> または Br である、 式 1 a の化合物。

【 0 0 8 3 】

実施形態 D .

R<sup>2</sup> が、 H であり；

R<sup>3</sup> が、 t - ブチルまたはシクロプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> または Br である、 式 1 a の化合物。

【 0 0 8 4 】

実施形態 E .

R<sup>2</sup> が、 H であり；

R<sup>3</sup> が、 イソプロピル、 s - ブチル、 t - ブチル、 CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> またはシクロプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、 C<sub>1</sub> または Br である、 式 1 a の化合物。

【 0 0 8 5 】

実施形態 E 1 .

R<sup>2</sup> が、 H であり；

R<sup>3</sup> が、 イソプロピル、 s - ブチル、 t - ブチル、 CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> またはシクロプロピルであり；40

R<sup>4</sup> が、C1である、式1aの化合物。

【0086】

実施形態E2.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、イソプロピル、s-ブチル、t-ブチル、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>またはシクロプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、Brである、式1aの化合物。

【0087】

実施形態F1.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、イソプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、C1である、式1aの化合物。

【0088】

実施形態F2.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、s-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、C1である、式1aの化合物。

【0089】

実施形態F3.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、t-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、C1である、式1aの化合物。

【0090】

実施形態F4.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>であり；

R<sup>4</sup> が、C1である、式1aの化合物。

【0091】

実施形態F5.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、シクロプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、C1である、式1aの化合物。

【0092】

実施形態G1.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、イソプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、Brである、式1aの化合物。

【0093】

実施形態G2.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、s-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、Brである、式1aの化合物。

【0094】

実施形態G3.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

R<sup>3</sup> が、t-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、Brである、式1aの化合物。

【0095】

実施形態G4.

R<sup>2</sup> が、Hであり；

10

20

30

40

50

$R^3$  が、  $CH_2C(CH_3)_3$  であり；  
 $R^4$  が、 Br である、式 1 a の化合物。

## 【0096】

実施形態 G 5 .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、 シクロプロピルであり；  
 $R^4$  が、 Br である、式 1 a の化合物。

## 【0097】

実施形態 H .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、 それぞれが、 非置換であるか、 または少なくとも 1 個の  $R^6$  で置換された、  $C_2 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；  
 $R^4$  が、 Cl、 Br、 I、  $CH_3$ 、  $CF_3$  またはシアノであり；  
各  $R^6$  が、 独立して、 ハロゲン、 シアノ、  $C_1 \sim C_3$  アルコキシ、  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキル、  $C_1 \sim C_3$  アルキルチオ、  $C_1 \sim C_3$  アルキルスルフィニル、  $C_1 \sim C_3$  アルキルスルホニルまたは  $SiR^aR^bR^c$  であり；  
 $R^a$ 、  $R^b$  および  $R^c$  がそれぞれ、 独立して、  $C_1 \sim C_6$  アルキルである、 式 1 b の化合物。

## 【0098】

実施形態 I .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、  $C_2 \sim C_6$  アルキルまたは  $C_3 \sim C_6$  シクロアルキルであり；  
 $R^4$  が、 Cl または Br である、 式 1 b の化合物。

## 【0099】

実施形態 J .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、  $C_3 \sim C_6$  アルキルまたはシクロプロピルであり；  
 $R^4$  が、 Cl または Br である、 式 1 b の化合物。

## 【0100】

実施形態 K .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、 t - ブチルまたはシクロプロピルであり；  
 $R^4$  が、 Cl または Br である、 式 1 b の化合物。

## 【0101】

実施形態 L .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、 イソプロピル、 s - ブチル、 t - ブチル、  $CH_2C(CH_3)_3$  またはシクロプロピルであり；  
 $R^4$  が、 Cl または Br である、 式 1 b の化合物。

## 【0102】

実施形態 M 1 .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、 イソプロピル、 s - ブチル、 t - ブチル、  $CH_2C(CH_3)_3$  またはシクロプロピルであり；  
 $R^4$  が、 Cl である、 式 1 b の化合物。

## 【0103】

実施形態 M 2 .

$R^2$  が、 H であり；  
 $R^3$  が、 イソプロピル、 s - ブチル、 t - ブチル、  $CH_2C(CH_3)_3$  またはシクロプロピルであり；

10

20

30

40

50

R<sup>4</sup> が、Br である、式1bの化合物。

【0104】

実施形態N1.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、イソプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、Cl である、式1bの化合物。

【0105】

実施形態N2.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、s-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、Cl である、式1bの化合物。 10

【0106】

実施形態N3.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、t-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、Cl である、式1bの化合物。

【0107】

実施形態N4.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> であり； 20

R<sup>4</sup> が、Cl である、式1bの化合物。

【0108】

実施形態N5.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、シクロプロピルであり；

R<sup>4</sup> が、Cl である、式1bの化合物。

【0109】

実施形態O1.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、イソプロピルであり； 30

R<sup>4</sup> が、Br である、式1bの化合物。

【0110】

実施形態O2.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、s-ブチルであり；

R<sup>4</sup> が、Br である、式1bの化合物。

【0111】

実施形態O3.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、t-ブチルであり； 40

R<sup>4</sup> が、Br である、式1bの化合物。

【0112】

実施形態O4.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub> であり；

R<sup>4</sup> が、Br である、式1bの化合物。 40

【0113】

実施形態O5.

R<sup>2</sup> が、H であり；

R<sup>3</sup> が、シクロプロピルであり； 50

$R^4$  が、Brである、式1bの化合物。

【0114】

実施形態P1.

$R^2$  が、Hであり；

$R^3$  が、-CR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>R<sup>6c</sup>であり；

$R^4$  が、ClまたはBrであり；

$R^{6a}$  が、H、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルケニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

$R^{6b}$  が、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルであり；

$R^{6c}$  が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたは- $CR^{7a}R^{7b}$ であり；

$R^{7a}$  が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

$R^{7b}$  が、H、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

$R^{7c}$  が、H、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルである、式1の化合物。

【0115】

実施形態P2.

$R^2$  が、Hであり；

$R^3$  が、-CR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>R<sup>6c</sup>であり；

$R^4$  が、ClまたはBrであり；

$R^{6a}$  が、H、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルケニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

$R^{6b}$  が、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルであり；

$R^{6c}$  が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたは- $CR^{7a}R^{7b}$ であり；

$R^{7a}$  が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

$R^{7b}$  が、H、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

$R^{7c}$  が、H、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルである、式1aの化合物。

【0116】

実施形態P3.

$R^2$  が、Hであり；

$R^3$  が、-CR<sup>6a</sup>R<sup>6b</sup>R<sup>6c</sup>であり；

$R^4$  が、ClまたはBrであり；

$R^{6a}$  が、H、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>3</sub>アルケニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

$R^{6b}$  が、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルであり；

$R^{6c}$  が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたは- $CR^{7a}R^{7b}$ であり；

$R^{7a}$  が、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

$R^{7b}$  が、H、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルであり；

$R^{7c}$  が、H、ハロゲン、シアノまたはC<sub>1</sub>～C<sub>2</sub>アルキルである、式1bの化合物。

【0117】

10

20

30

40

50

## 実施形態 Q 1 .

( i ) 1 b と 1 a の比が、少なくとも 5 5 : 4 5 であり；かつ

R<sup>2</sup> が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも 1 個の R<sup>5</sup> で置換された、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup> が、それが、非置換であるか、または少なくとも 1 個の R<sup>6</sup> で置換された、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキニルまたは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup> が、C<sub>1</sub>、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub> またはシアノであり；

10

各 R<sup>5</sup> が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルフィニルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルホニルであり；

各 R<sup>6</sup> が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたは SiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである、式 1 a の化合物および式 1 b の化合物、ならびに

( ii ) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分を含む、組成物。

20

## 【 0 1 1 8 】

## 実施形態 Q 2 .

( i ) 1 b と 1 a の比が、少なくとも 6 5 : 3 5 であり；かつ

R<sup>2</sup> が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも 1 個の R<sup>5</sup> で置換された、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup> が、それが、非置換であるか、または少なくとも 1 個の R<sup>6</sup> で置換された、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキニルまたは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；

30

R<sup>4</sup> が、C<sub>1</sub>、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub> またはシアノであり；

各 R<sup>5</sup> が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルフィニルまたは C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルホニルであり；

各 R<sup>6</sup> が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたは SiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである、式 1 a の化合物および式 1 b の化合物、ならびに

( ii ) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも 1 種の追加の成分を含む、組成物。

40

## 【 0 1 1 9 】

## 実施形態 Q 3 .

( i ) 1 b と 1 a の比が、少なくとも 7 5 : 2 5 であり；かつ

R<sup>2</sup> が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも 1 個の R<sup>5</sup> で置換された、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルチオもしくは C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup> が、それが、非置換であるか、または少なくとも 1 個の R<sup>6</sup> で置換された、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~ C<sub>16</sub> アルキニルまたは C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub>

50

$R^6$  シクロアルキルであり；

$R^4$  が、C<sub>1</sub>、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub> またはシアノであり；

各  $R^5$  が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルホニルであり；

各  $R^6$  が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルである、式1a の化合物および式1b の化合物、ならびに

(i) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、組成物。

#### 【0120】

実施形態Q4.

(i) 1b と 1a の比が、少なくとも 85 : 15 であり；かつ

$R^2$  が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個の  $R^5$  で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルスルホニルであり；

$R^3$  が、それが、非置換であるか、または少なくとも1個の  $R^6$  で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；

$R^4$  が、C<sub>1</sub>、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub> またはシアノであり；

各  $R^5$  が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルホニルであり；

各  $R^6$  が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルである、式1a の化合物および式1b の化合物、ならびに

(i) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、組成物。

#### 【0121】

実施形態Q5.

(i) 1b と 1a の比が、少なくとも 95 : 5 であり；かつ

$R^2$  が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個の  $R^5$  で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub> アルキルスルホニルであり；

$R^3$  が、それが、非置換であるか、または少なくとも1個の  $R^6$  で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub> アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキルであり；

$R^4$  が、C<sub>1</sub>、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub> またはシアノであり；

各  $R^5$  が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルホニルであり；

各  $R^6$  が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；

10

20

30

40

50

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである、式1aの化合物および式1bの化合物、ならびに

(i i) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、組成物。

#### 【0122】

実施形態Q6.

(i) 1bと1aの比が、少なくとも97:3であり；かつ

R<sup>2</sup>が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

10 R<sup>3</sup>が、それが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>が、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

各R<sup>5</sup>が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

20 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである、式1aの化合物および式1bの化合物、ならびに

(i i) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、組成物。

#### 【0123】

実施形態Q7.

(i) 1bと1aの比が、少なくとも99:1であり；かつ

R<sup>2</sup>が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

30 R<sup>3</sup>が、それが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>が、Cl、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

各R<sup>5</sup>が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

40 R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである、式1aの化合物および式1bの化合物、ならびに

(i i) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、組成物。

#### 【0124】

実施形態Q8.

(i) 1bと1aの比が、本質的に100:0であり；かつ

50 R<sup>2</sup>が、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置

換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホオニルであり；

R<sup>3</sup>が、それぞれが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>が、C1、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；

各R<sup>5</sup>が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

各R<sup>6</sup>が、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup>であり；

R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>およびR<sup>c</sup>がそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルである、式1aの化合物および式1bの化合物、ならびに

(i) 界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、組成物。

#### 【0125】

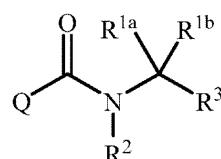
実施形態R1.

土壤中にすむ線虫を防除する方法であって、線虫またはその環境を、式2、

#### 【化7】

10

20



2

(式中、

30

Qは、フラン、チオフェンまたはチアゾール環が式2の残部にそれを通して結合している炭素原子に隣接する炭素原子においてR<sup>4</sup>で置換された、フラン、チオフェンまたはチアゾール環であり；

R<sup>1a</sup>は、それぞれが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、HまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルであり；

R<sup>1a</sup>およびR<sup>1b</sup>は、それらが結合している炭素原子と一緒にになって、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された3～6員のシクロアルキル環を形成し；

R<sup>2</sup>は、H；またはそれが、非置換であるか、もしくは少なくとも1個のR<sup>5</sup>で置換された、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキニル、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルキルカルボニル、C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルチオもしくはC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルスルホニルであり；

R<sup>3</sup>は、それぞれが、非置換であるか、または少なくとも1個のR<sup>6</sup>で置換された、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>～C<sub>16</sub>アルキニルまたはC<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキルであり；

R<sup>4</sup>は、C1、Br、I、CH<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>またはシアノであり；但し、R<sup>4</sup>がMeである場合、R<sup>3</sup>は、非置換C<sub>2</sub>アルキル以外であり；

各R<sup>5</sup>は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルコキシ、C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>シクロアルキル、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルチオ、C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルフィニルまたはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>アルキルスルホニルであり；

40

50

各 R<sup>6</sup> は、独立して、ハロゲン、シアノ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルコキシ、C<sub>3</sub> ~ C<sub>6</sub> シクロアルキル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルチオ、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルフィニル、C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub> アルキルスルホニルまたはSiR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>R<sup>c</sup> であり；

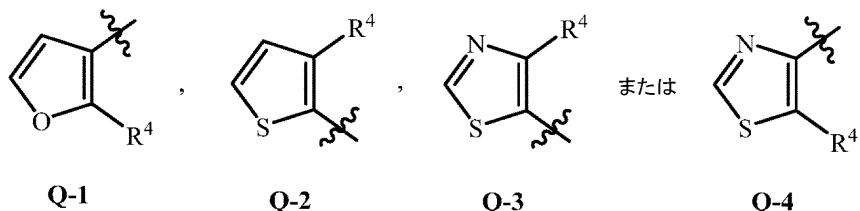
R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup> および R<sup>c</sup> はそれぞれ、独立して、C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルである）  
から選択される生物学的有効量の化合物と接触させるステップを含む方法。

【0126】

実施形態 R<sub>2</sub> .

Q が、

【化8】



からなる群から選択される、実施形態 R<sub>1</sub> の方法。

【0127】

実施形態 R<sub>3</sub> .

Q が、Q - 1 である、実施形態 R<sub>1</sub> の方法。

【0128】

具体的実施形態には、（化合物番号は、索引表 A ~ C 2 を意味する）：

化合物 9 ;

化合物 11 ;

化合物 26 ;

化合物 40 ;

化合物 43 ;

化合物 78 ;

化合物 80 ; および

化合物 84

からなる群から選択される、式 1a および式 1b の化合物が含まれる。

【0129】

具体的実施形態には、（化合物番号は索引表 A ~ C 2 を意味する）：

化合物 9 ;

化合物 11 ;

化合物 26 ;

化合物 40 ;

化合物 43 ;

化合物 78 ;

化合物 80 ; および

化合物 84

からなる群から選択される、式 1b の化合物がさらに含まれる。

【0130】

注目すべきは、本発明の化合物が有利な代謝パターンおよび / または土壤残留パターンで特徴付けられ、一連の農学的および非農学的寄生線虫を防除する活性を示すことである。

【0131】

特に注目すべきは、寄生線虫防除スペクトルおよび経済的重要性の理由のために、寄生線虫を防除することによって寄生線虫により引き起こされる損傷または傷害からの農作物

10

20

30

40

50

の保護が本発明の実施形態であることである。本発明の化合物は、植物でのそれらの有利な転位置特性または浸透移行性のために、式1、式1aもしくは式1bの化合物、または化合物を含む組成物と直接接觸しない葉面または他の植物部位も保護する。

#### 【0132】

また、本発明の実施形態として注目に値するのは、先行実施形態のみならず、本明細書に記載される任意の他の実施形態のいずれかの化合物、およびその任意の組み合わせ、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む組成物であって、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を任意選択的にさらに含む組成物である。

#### 【0133】

本発明の実施形態としてさらに注目に値るのは、先行実施形態のみならず、本明細書に記載される任意の他の実施形態の化合物、およびその任意の組み合わせ、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む、寄生線虫を防除するための組成物であって、少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を任意選択的にさらに含む組成物である。本発明の実施形態は、寄生線虫を防除する方法であって、寄生線虫またはその環境を、生物学的有効量の先行実施形態のいずれかの化合物（例えば、本明細書に記載される組成物としての）と接觸させるステップを含む方法をさらに含む。

#### 【0134】

本発明の実施形態は、土壤ドレンチ液体処方物の形態での、先行実施形態のいずれかの化合物を含む組成物も含む。本発明の実施形態は、寄生線虫を防除する方法であって、土壤を、生物学的有効量の先行実施形態のいずれかの化合物を含む土壤ドレンとしての液体組成物と接觸させるステップを含む方法をさらに含む。

#### 【0135】

本発明の実施形態は、生物学的有効量の先行実施形態のいずれかの化合物および噴射剤を含む、寄生線虫を防除するための噴霧組成物も含む。本発明の実施形態は、生物学的有効量の先行実施形態のいずれかの化合物、1種以上の食物材料、任意選択的に誘引物質、および任意選択的に保湿剤を含む、寄生線虫を防除するための餌組成物をさらに含む。

#### 【0136】

本発明の実施形態は、寄生線虫から種子を保護する方法であって、種子を、生物学的有効量の先行実施形態のいずれかの化合物と接觸させるステップを含む方法も含む。

#### 【0137】

本発明の実施形態は、寄生線虫を防除する方法であって、寄生線虫またはその環境を、生物学的有効量の式1、式1a、式1bまたは式2の化合物（例えば、本明細書に記載される組成物としての）と接觸させるステップを含む方法も含み、但し、本方法は、治療による人体または動物体の医療処置の方法ではないことを条件とする。

#### 【0138】

本発明はまた、寄生線虫またはその環境が、生物学的有効量の式1、式1a、式1bまたは式2の化合物、ならびに界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分を含む組成物であって、生物学的有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を任意選択的にさらに含む組成物と接觸させられるような方法に関し、但し、本方法は、治療による人体または動物体の医療処置の方法ではないことを条件とする。

#### 【0139】

スキーム1～3に記載されるとおりの以下の方法および変形の1つ以上を使用して、式1、式1a、式1bおよび式2の化合物を調製することができる。以下の式2～式8bの化合物におけるQ、R<sup>1a</sup>、R<sup>1b</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>は、別に注記されない限り、本発明の概要で上に定義されたとおりである。室温は、約20～25である。

#### 【0140】

式2の化合物は、スキーム1に示されるとおりに、LGが脱離基、例えば、ハロゲンで

10

20

30

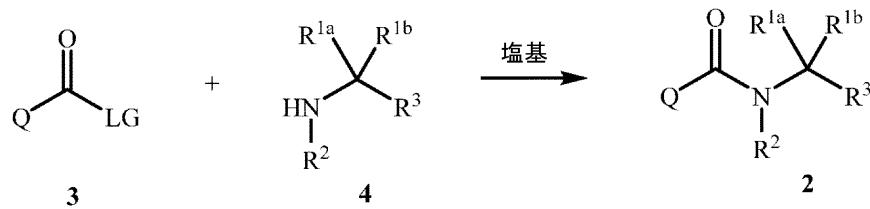
40

50

ある、式3の化合物と、式4のアミンとの反応によって調製することができる。LGがハロゲンである場合、反応は、典型的には塩基の存在下および適当な溶媒で行われる。適当な塩基には、アミン、例えば、トリエチルアミン、ピリジンおよびピコリン、無機金属塩、例えば、炭酸ナトリウムおよび炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウムおよび炭酸水素カリウム、水酸化ナトリウムおよびナトリウムエトキシドを含めて、炭酸塩、炭酸水素塩、水酸化物およびアルコキシドが含まれる。適当な溶媒の選択は、選択されるLG、塩基、および反応条件に依存する。典型的な溶媒には、脂肪族炭化水素、例えば、ヘキサン、シクロヘキサンおよびヘプタン、芳香族炭化水素、例えば、トルエンおよびキシレン、ハロゲン化炭化水素、例えば、ジクロロメタン、ジクロロエタンおよびジメトキシエタン、エーテル、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンおよびジメトキシエタン、エステル、例えば、酢酸エチル、アミド、例えば、DMF、DMACおよびN-メチルピロリドン、ニトリル、例えば、アセトニトリル、ケトン、例えば、アセトンおよびMEK、ならびに極性プロトン溶媒、例えば、エタノールおよび水が含まれる。

【化9】

### スキーム1

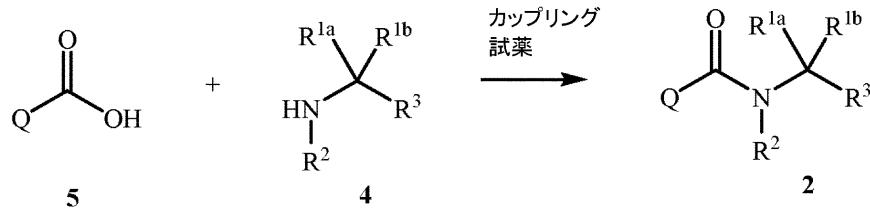


【0141】

式2の化合物は、スキーム2に示されるとおりに、式5の化合物と式4のアミンとの反応によっても調製することができる。この方法では、アミドカップリング試薬、例えば、HATU (1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-1H-1,2,3-トリアゾロ[4,5-b]ピリジニウム3-オキシドヘキサスルオロホスフェート)、EDC (1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド)が使用される。これらのアミドカップリングのための反応条件は、当技術分野で公知である。

【化10】

### スキーム2



【0142】

式1の化合物は、式2の化合物のサブセットであり、式2の化合物の調製のために上に記載された仕方で調製することができる。

【0143】

式1aおよび式1bのエナンチオマー構造は、スキーム1およびスキーム2に記載されたものと同様の方法および条件によってスキーム3に示されるとおりに調製することができる。例えば、スキーム3に示されるとおりに、式6のフランと式7aまたは式7bのいずれかのキラルアミンとのカップリングにより、それぞれ、式8aまたは式8bの化合物が生成される。式7aおよび式7bのアミンは、商業的に入手可能であるか、または公知の方法による対応するラセミアミンのキラル分割によって調製することができる。

10

20

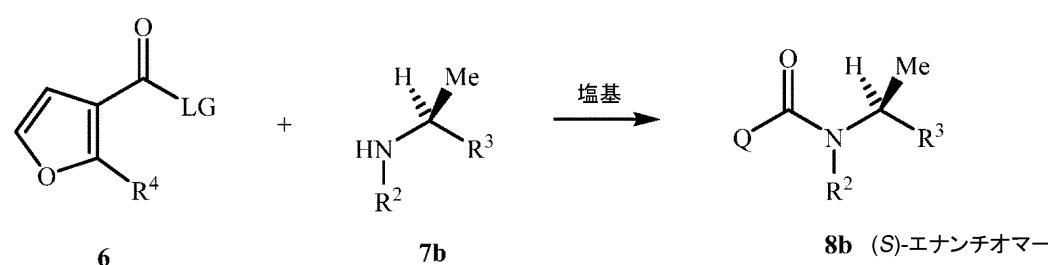
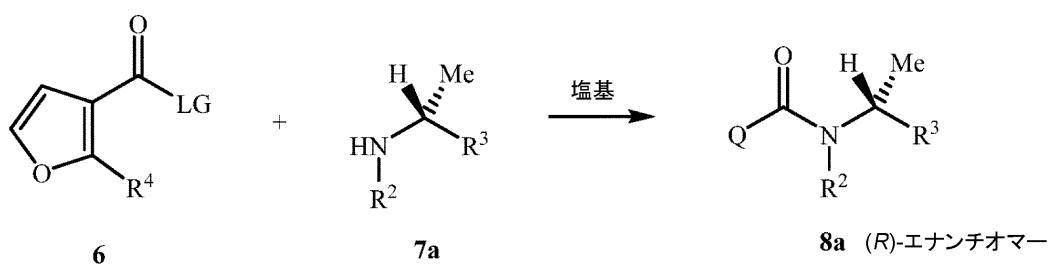
30

40

50

## 【化11】

スキーム3



## 【0144】

代わりに、式1の化合物は、ラセミ混合物として調製することができ、式1aおよび式1bの化合物は、キラルカラムクロマトグラフィーによってそれらのそれぞれのエナンチオマーに分離することができる。広範なキラル化合物が、この種の分離のために存在する。

## 【0145】

R2が、H以外である、式1、式1a、式1bおよび式2の化合物は、適切に置換されたアルキル、アシリルまたは他の試薬との反応によって、R<sup>2</sup>が、Hである、それらのそれぞれの類似物から調製することもできる。

## 【0146】

式1、式1a、式1bまたは式2の化合物を調製するための上に記載されたいいくつかの試薬および反応条件は、中間体に存在するある特定の官能基とは適合していなくてもよいことが認識される。これらの場合に、保護／脱保護シーケンスまたは官能基相互変換の合成への組み込みが、所望の生成物を得る際に助けとなる。保護基の使用および選択は、化学合成の当業者に明らかである（例えば、Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991を参照されたい）。当業者であれば、一部の場合には、任意の個別のスキームに記載されている試薬を導入した後に、式1の化合物の合成を完了するために、詳述されていない追加のルーチン的な合成ステップの実施が必要となる場合があることを認識するであろう。当業者はまた、上のスキームに例証されたステップの組み合わせを、式1、式1a、式1bまたは式2の化合物を製造するために提示された特定のシーケンスで暗示されるもの以外の順序で行うことが必要であってもよいことを認識する。

## 【0147】

当業者はまた、さらに、本明細書に記載される式1、式1a、式1bまたは式2の化合物およびそれらの中間体を、様々な求電子性、求核性、ラジカル、有機金属、酸化、および還元反応に供して置換基を付加する、または既存の置換基を変更することができることを認識する。

## 【0148】

さらなる詳細な説明なしに、先行の記載を使用する当業者は、本発明を最大限に用いることができると考えられる。したがって、以下の合成実施例は、単に例証的なものであり、何であれ決して本開示を限定するものではないと解釈されるべきである。以下の合成実施例におけるステップは、合成変換全般における各ステップの手順を例証し、各ステップ

10

20

30

40

50

のための出発原料は、その手順が他の実施例またはステップに記載されている特定の調製実験によって必ずしも調製されていなくてもよい。<sup>1</sup>H NMRスペクトルは、テトラメチルシランからのppm低磁場で報告され；「s」は、一重項を意味し、「d」は、二重項を意味し、「dd」は、二重項の二重項を意味し、「brs」は、幅広の一重項を意味する。室温は、約20~25である。「DMF」は、N,N-ジメチルホルムアミドである。

### 【実施例】

#### 【0149】

##### 合成実施例1

2-クロロ-N-[ (1S) - 1-シクロプロピルエチル] - 3-フランカルボキサミドおよび2-クロロ-N-[ (1R) - 1-シクロプロピルエチル] - 3-フランカルボキサミド(化合物11、44および45)の調製

ステップA：2-クロロ-3-フランカルボン酸の調製

ジイソプロピルアミン(10.3g、102mmol)のTHF(20mL)中溶液に、ヘキサン中2.5M n-BuLi(6.5g、102mmol)を-78で添加し、反応混合物を-40にゆっくりと加温した。次いで、THF(20mL中3-フランカルボン酸(5g、41mmol)を添加し、30分間攪拌した。THF(20mL)中ヘキサクロロエタン(10.60g、45.68mmol)を-78でゆっくりと添加し、反応混合物を16時間攪拌した。TLC分析(DCM中5%MeOH)は、反応の完了を示した。反応混合物を0に冷却し、1N HClでクエンチし、酢酸エチルで抽出した(3x)。合わせた有機層をブラインで洗浄し、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させ、得られた粗生成物を溶媒洗浄で精製して、茶色の固体として2.8gの表題生成物を得た。<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, 400MHz)：10.2(br s, 1H), 7.33(d, 1H), 6.81(d, 1H). 質量スペクトル：(M+1)=145.

#### 【0150】

ステップB：2-クロロ-N-[ (1S) - 1-シクロプロピルエチル] - 3-フランカルボキサミドおよび2-クロロ-N-[ (1R) - 1-シクロプロピルエチル] - 3-フランカルボキサミドの調製

2-クロロ-3-フランカルボン酸(1g、6.84mmol)のDCM(25mL)中溶液に、-メチルシクロプロパンメタナミン塩酸塩(1:1)(0.75g、6.16mmol)、EDC-HCl(2g、10.27mmol)、DMAP(0.83g、6.84mmol)を添加し、反応混合物を室温で6時間攪拌し、その時間後、TLC分析(石油エーテル中50%酢酸エチル)は、反応の完了を示した。反応混合物を水でクエンチし、酢酸エチルで抽出した(3x)。合わせた有機相を水、ブラインで洗浄し、次いで、Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させ、粗生成物を、20%酢酸エチル/石油エーテル溶出させたシリカゲルカラム上で精製して、白色固体として0.7gの表題化合物を得た。<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, 400MHz)：7.31(d, 1H), 6.82(d, 1H), 6.19(br s, 1H), 3.6(m, 1H), 1.57(d, 3H), 0.93(m, 1H), 0.53(m, 2H), 0.49(m, 1H), 0.27(m, 1H). 質量スペクトル：(M+1)=214.

#### 【0151】

1Sおよび1R異性体は、キラル分取HPLCにより分離し、-21.5および+21.2の旋光度[α](c 0.5、クロロホルム)を有する2つの立体異性体を得た。

#### 【0152】

##### 合成実施例2

2-クロロ-N-(1,2,2-トリメチルプロピル)-3-フランカルボキサミド(化合物27)の調製

ステップA：2-クロロ-3-フランカルボニルクロリドの調製

窒素雰囲気下、2-クロロ-3-フランカルボン酸(1.0g、6.8mmol)を、

100 mL の無水ジクロロメタンに懸濁させた。次いで、オキサリルクロリド (0.98 mL、11.4 mmol)、続いて1滴のDMFを添加した。反応混合物を一晩攪拌し、その後、溶媒を減圧下で除去して、852 mg (76%) の黄褐色油を得た。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 500 MHz) : δ 7.37 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.89 ppm (d, J = 2.2 Hz, 1H).

#### 【0153】

原液をジクロロメタン中で調製して [75 mg / 5 mL]、さらなる反応で使用した。

#### 【0154】

ステップB：2-クロロ-N-(1,2,2-トリメチルプロピル)-3-フランカルボキサミドの調製

2-クロロ-3-フランカルボニルクロリド (100 mg、0.61 mmol) の無水ジクロロメタン 6.6 mL 中溶液に、3-アミノ-2,2-ジメチルブタン (90 μL、0.67 mmol) を窒素雰囲気下で添加した。次いで、トリエチルアミン (136 μL、0.98 mmol) を添加し、混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、この溶液を水で洗浄し、Celite (登録商標) 存在の下で濃縮し、クロマトグラフィー (0~20% EtOAc : ヘキサン) により精製して、黄褐色油として 64 mg (46%) の表題化合物を得た。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 500 MHz) : δ 7.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.12 - 6.20 (m, 1H), 4.05 (dq, J = 9.5, 6.8 Hz, 1H), 1.15 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.84 - 1.06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z [M+H]<sup>+</sup> : 230.3.

#### 【0155】

合成実施例 2 a

2-クロロ-N-[ (1S) - 1,2,2-トリメチルプロピル]-3-フランカルボキサミド (化合物 40) の調製

ステップA：2-クロロ-N-[ (1S) - 1,2,2-トリメチルプロピル]-3-フランカルボキサミドの調製

2-クロロ-3-フランカルボニルクロリド (75 mg、0.46 mmol) の無水ジクロロメタン 5 mL 中溶液に、(S)-(+) - 3-アミノ-2,2-ジメチルブタン (67 μL、0.50 mmol) を窒素雰囲気下で添加した。次いで、トリエチルアミン (188 μL、1.35 mmol) を添加し、混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、溶液を水で洗浄し、Celite (登録商標) の存在下で濃縮し、クロマトグラフィー (0~20% EtOAc : ヘキサン) により精製して、白色固体として 33 mg (31%) の表題化合物を得た。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 500 MHz) : δ 7.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.12 - 6.20 (m, 1H), 4.05 (dq, J = 9.5, 6.8 Hz, 1H), 1.15 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.84 - 1.06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z [M+H]<sup>+</sup> : 230.4. [+] + 10.7° (c 3.65, メタノール).

#### 【0156】

合成実施例 2 b

2-クロロ-N-[ (1R) - 1,2,2-トリメチルプロピル]-3-フランカルボキサミド (化合物 41) の調製

ステップA：2-クロロ-N-[ (1R) - 1,2,2-トリメチルプロピル]-3-フランカルボキサミドの調製

2-クロロ-3-フランカルボニルクロリド (75 mg、0.46 mmol) の無水ジクロロメタン 5 mL 中溶液に、(R)-(+) - 3-アミノ-2,2-ジメチルブタン (67 μL、0.50 mmol) を窒素雰囲気下で添加した。次いで、トリエチルアミン (188 μL、1.35 mmol) を添加し、混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、この溶液を水で洗浄し、セライト (登録商標) の存在下で濃縮し、クロマトグラフィー (0~20% EtOAc : ヘキサン) により精製して、白色固体として 38 mg (36%) の表

10

20

30

40

50

題化合物を得た。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 500 MHz) : 7.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.12 - 6.20 (m, 1H), 4.05 (dq, J = 9.5, 6.8 Hz, 1H), 1.15 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.84 - 1.06 ppm (s, 9H). LC/MS m/z [M + H]<sup>+</sup> : 230.3. [ ] - 9.09° (c 3.85, メタノール).

### 【0157】

先行スキーム 1 ~ 3 および合成実施例 1、2、2a および 2b に記載されたとおりの方法および変形により調製された式 1、式 1a、式 1b または式 2 の具体的な化合物を以下の索引表に示す。以下の略語が使用されてもよい：Cmpd は化合物を意味し、t は第三級であり、Me はメチルであり、Et はエチルである。構造フラグメント中の「-」は、分子の残部へのフラグメントの結合点を示す。略語「Ex.」は「実施例」を表し、その化合物がどの実施例において調製されるかを示す数字が後に続く。

10

### 【0158】

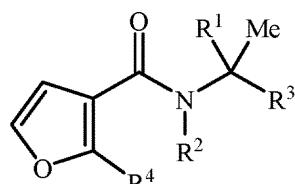
「MS」と表題された欄は、質量スペクトルデータを含む。「MP」と表題された欄は、融点範囲データを含む。単一の欄が「MS / MP」と表題されている場合、範囲（例えば、120 ~ 122）からなるこの欄へのエントリーは、融点範囲を表し、一方で単一の数字（例えば、208.1）からなるこの欄へのエントリーは、質量スペクトルデータを表す。質量スペクトルデータについて、報告される数値は、最大同位体存在度（すなわち、M）を有する分子へのH<sup>+</sup>（分子量 1）付加により形成された実測分子イオンの分子量である。報告された質量スペクトルピークは、大気圧化学イオン化（AP<sup>+</sup>）を使用して質量分析法により実測した。

20

### 【0159】

索引表 A

### 【化 12】



30

### 【0160】

### 【表 1】

R<sup>4</sup>が Me である。

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	MS	MP
1	H	H	-CH(Me)Et		75-78
2	H	Me	シクロプロピル	208.1	
3	H	H	メチル		80-83
4	H	H	イソプロピル		68-71
5	H	H	プロピル	*	*
6	H	H	シクロプロピル		64-68
7	Me	H	シクロプロピル		78-82
80	H	H	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>		104-108

40

### 【0161】

【表2】

 $R^4$ がClである。

<u>化合物番号</u>	<u>R<sup>1</sup></u>	<u>R<sup>2</sup></u>	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>	<u>MP</u>
8	Me	H	シクロプロピル		62-63
9	H	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (シクロプロピル)	242.1	
10	Me	H	イソプロピル	230.3	
11 (実施例1)	H	H	シクロプロピル		82-86
12	Me	H	-CH <sub>2</sub> OMe	*	*
13	H	H	-CH <sub>2</sub> OMe		55-56
14	Me	H	-CH <sub>2</sub> SMe		59-60
15	Me	H	-CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me		100-101
16	H	H	エチル		85-86
17	H	H	プロピル	*	*
18	Me	H	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>	*	*
19	H	H	-CH <sub>2</sub> CH(Me) <sub>2</sub>	230.3	
20	H	H	シクロペンチル	242.4	
21	H	H	シクロヘキシル	256.4	
22	H	H	1-メチルシクロプロピル	228.3	
23	H	H	シクロブチル	228.3	
24	H	H	-CF <sub>3</sub>	242.3	
25	Me	H	-CH <sub>2</sub> S(O)Me		134-135
26	H	H	イソプロピル		81-84
27 (実施例2)	H	H	t-ブチル	230.4	
28	H	H	-CH <sub>2</sub> SMe	234.3	
29	H	H	ペンチル	244.4	
30	H	H	4-メチルペンチル	258.4	
31	H	Me	シクロプロピル	229.2	
78	H	H	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>	244.3	

【0162】

【表3】

 $R^4$ がBrである。

<u>化合物番号</u>	<u>R<sup>1</sup></u>	<u>R<sup>2</sup></u>	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>	<u>MP</u>
32	H	H	シクロプロピル		54-57
33	H	H	イソプロピル		58-59
34	H	H	プロピル	*	*
35	H	H	t-ブチル	*	*

【0163】

10

20

30

40

【表4】

R<sup>4</sup>がCNである。

<u>化合物番号</u>	<u>R<sup>1</sup></u>	<u>R<sup>2</sup></u>	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>
79	H	H	-C(Me) <sub>2</sub> Et	235.2
97	H	H	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>	*
98	H	H	-CH <sub>2</sub> CH(Me) <sub>2</sub>	*

【0164】

10

【表5】

R<sup>4</sup>がIである。

<u>化合物番号</u>	<u>R<sup>1</sup></u>	<u>R<sup>2</sup></u>	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>	<u>MP</u>
83	H	H	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>		68-72
88	H	H	t-ブチル	322.4	

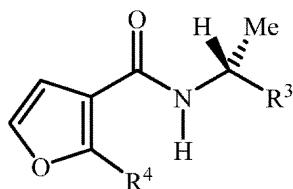
\* <sup>1</sup>H NMR データについては索引表 D を参照されたい。

【0165】

20

索引表 B - 1

【化13】



【0166】

30

【表6】

R<sup>4</sup>がMeである。

<u>化合物番号</u>	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MP</u>	<u>旋光度</u>
36	シクロプロピル	70-73	
39	t-ブチル	63-64	
84	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>	130-134	-30.35 (c 0.1、クロロホルム)
96	イソプロピル	51-55	

【0167】

40

【表7】

 $R^4$ がClである。

化合物番号	<u>R</u> <sup>3</sup>	<u>MS</u>	<u>MP</u>	旋光度
41 (実施例2b)	t-ブチル	230.3		-9.09 (c 3.85、メタノール)
45 (実施例1)	シクロプロピル		144-148	-21.5 (c 0.1、クロロホルム)
75	イソプロピル	216.1		-20.0 (c 0.1、クロロホルム)
76	エチル		64-65	

10

【0168】

【表8】

 $R^4$ がBrである。

化合物番号	<u>R</u> <sup>3</sup>	<u>MS</u>	旋光度
38	t-ブチル	89-90	
74	シクロプロピル	70-73	

20

【0169】

【表9】

 $R^4$ がIである。

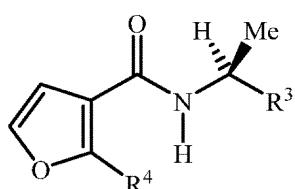
化合物番号	<u>R</u> <sup>3</sup>	<u>MS</u>	<u>MP</u>	旋光度
86	t-ブチル	322.1		-12.66 (c 0.4、クロロホルム)
102	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>		94-98	-22.8 (c 0.25、クロロホルム)

30

【0170】

索引表B-2

【化14】



【0171】

【表10】

 $R^4$ がMeである。

化合物番号	<u>R</u> <sup>3</sup>	<u>MS</u>	<u>MP</u>	旋光度
37	シクロプロピル		70-73	
85	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>		132-136	+23.62 (c 0.25、クロロホルム)
94	t-ブチル	213.4		
101	イソプロピル		53-54	

40

【0172】

【表 1 1】

R<sup>4</sup>がClである。

化合物番号	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>	<u>MP</u>	旋光度
40 (実施例 2a)	t-ブチル	230.4		+10.7 (c 3.65、メタノール)
43	イソプロピル	*	*	+22.0 (c 0.1、クロロホルム)
44 (実施例 1)	シクロプロピル		81-85	+21.2 (c 0.1、クロロホルム)
77	エチル		64-65	

10

【0 1 7 3】

【表 1 2】

R<sup>4</sup>がBrである。

化合物番号	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>	旋光度
42	t-ブチル	90-91	
73	シクロプロピル	71-75	

【0 1 7 4】

20

【表 1 3】

R<sup>4</sup>がIである。

化合物番号	<u>R<sup>3</sup></u>	<u>MS</u>	<u>MP</u>	旋光度
87	t-ブチル	322.1		+19.2 (c 0.5、クロロホルム)
103	-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>3</sub>		92-96	+11.2 (c 0.25、クロロホルム)

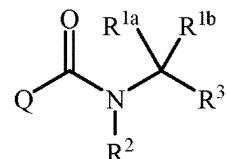
\* <sup>1</sup>H NMR データについては索引表 D を参照されたい。

【0 1 7 5】

30

索引表 C - 1

【化 1 5】



【0 1 7 6】

【表 1 4】

 $R^2$ がHである。

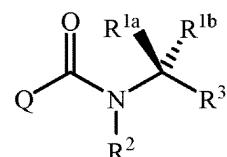
化合物番号	Q	<u>R<sup>1a</sup></u>	<u>R<sup>1b</sup></u>	<u>R<sup>3</sup></u>	MS/MP
46	2-メチル-3-フラニル	シクロプロピル	H	シクロプロピル	110-115
47	2-メチル-3-フラニル	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		シクロプロピル	*
48	3-メチル-2-チエニル	Me	H	イソプロピル	84-88
49	3-フルオロ-2-チエニル	Me	H	シクロプロピル	72-76
50	3-ブロモ-2-チエニル	Me	H	シクロプロピル	41-44
51	2-クロロ-3-フラニル	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		シクロプロピル	82-83
52	3-メチル-2-チエニル	シクロプロピル	H	シクロプロピル	121-125
53	2-クロロ-3-フラニル	エチル	H	シクロプロピル	74-77
54	2-クロロ-3-フラニル	エチル	H	-CH <sub>2</sub> OMe	54-55
55	5-ヨード-2-メチル-4-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	337.3
56	5-ヨード-4-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	323.3
57	2-クロロ-4-ヨード-5-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	357.2
58	3-メチルチオ-2-チエニル	メチル	H	シクロプロピル	242.3
59	2-ブロモ-5-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	277.2
60	2-メチル-5-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	211.3
61	5-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	197.3
62	5-クロロ-4-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	231.3
63	5-ブロモ-4-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	275.2
64	3-メトキシ-2-チエニル	メチル	H	シクロプロピル	60-62
65	3-(トリフルオロメチル)-2-チエニル	メチル	H	シクロプロピル	65-68
66	2-クロロ-3-フラニル	シクロプロピル	H	トリフルオロメチル	101-106
67	2-メチル-3-フラニル	エチル	H	シクロプロピル	76-80
68	3-クロロ-2-チエニル	シクロプロピル	H	シクロプロピル	160-164
69	2-チエニル	メチル	H	シクロプロピル	143-146
70	4-メチル-5-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	211.4
71	4-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	197.3
72	5-(トリフルオロメチル)-4-チアゾリル	メチル	H	シクロプロピル	265.3
82	4-メチル-5-チアゾリル	メチル	H	t-ブチル	114-118
89	3-(1,1-ジメチルエチル)-2-チエニル	メチル	H	イソプロピル	67-68
90	3-(1,1-ジメチルエチル)-2-チエニル	メチル	H	t-ブチル	68-69
93	5-ブロモ-4-チアゾリル	メチル	メチル	-CH <sub>2</sub> OMe	293.2
99	2-メチル-3-フラニル	t-ブチル	H	t-ブチル	285.1

\* <sup>1</sup>H NMR データについては索引表 D を参照されたい。

## 【0177】

索引表 C - 2

## 【化16】



## 【0178】

10

20

30

40

【表15】

 $R^2$ がHである。

化合物番号	$\Omega$	$R^{1a}$	$R^{1b}$	$R^3$	MS/MP	旋光度
81	4-メチル-5-チアゾリル	Me	H	<i>t</i> -ブチル	125-129	+33.9 (c 0.1, クロロホルム)
91	3-(1,1ジメチルエチル)-2-チエニル	H	Me	<i>t</i> -ブチル	42-43	-33.1 (c 0.8, クロロホルム)
92	3-(1,1ジメチルエチル)-2-チエニル	Me	H	<i>t</i> -ブチル	54-55	+17.3 (c 0.79, クロロホルム)
95	3-シアノ-2-チエニル	Me	H	<i>t</i> -ブチル	237.3	+26.4 (c 0.78, クロロホルム)
100	4-メチル-3-チエニル	Me	H	<i>t</i> -ブチル	210.3	-35.1 (c 0.77, クロロホルム)

10

【0179】

索引表D

【0180】

【表16】

化合物番号	$^1H$ NMR データ a
5	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.26 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 5.44 (br s, 1H), 4.15 (m, 1H), 2.58 (s, 3H), 1.50 (m, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.20 (d, 3H), 0.93 (t, 3H).
12	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.29 (d, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.50 (br s, 1H), 3.41 (s, 3H), 3.41 (s, 2H), 1.45 (s, 6H).
17	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.31 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.00 (br s, 1H), 4.18 (m, 1H), 1.5 (m, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.22 (d, 1H), 0.95 (t, 3H).
18	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.31 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 6.20 (br s, 1H), 1.85 (s, 2H), 1.50 (s, 6H), 1.02 (s, 9H).
34	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.45 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.05 (br s, 1H), 4.18 (m, 1H), 1.50 (m, 2H), 1.30 (m, 2H), 1.23 (d, 3H), 0.95 (t, 3H).
35	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.46 (s, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.22 (br s, 1H), 4.07 (m, 1H), 1.17 (d, 3H), 0.97 (d, 6H).
43	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.32 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.25 (br s, 1H), 4.06 (m, 1H), 1.79 (m, 1H), 1.17 (d, 3H), 0.96 (d, 6H).
47	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.08 (s, 1H), 6.23 (s, 1H), 6.00 (br s, 1H), 2.42 (s, 3H), 1.35 (m, 1H), 0.60 (m, 2H), 0.50 (m, 2H), 0.28 (m, 2H), 0.02 (m, 2H).
97	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.46 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 5.24 (br s, 1H), 4.13 (m, 1H), 1.49-1.42 (m, 2H), 1.24-1.19 (m, 3H), 0.95 (s, 9H).
98	$^1H$ NMR ( $CDCl_3$ ) $\delta$ 7.42 (s, 1H), 6.59 (br s, 1H), 4.24-4.20 (m, 1H), 1.63 (m, 1H), 1.55-1.44 (m, 1H), 1.35-1.28 (m, 1H), 1.21 (d, 3H), 0.92-0.91 (m, 6H).

20

a  $^1H$  NMR データは、テトラメチルシランからの低磁場 ppm 単位である。カップリングは、(s)-一重項、(br s)-広幅一重項、(d)-二重項、(t)-三重項、(m)-多重項、(dd)-二重項の二重項、(dt)-三重項の二重項、(br)-広幅。

【0181】

本発明の化合物は一般に、キャリアとして働く、界面活性剤、固体希釈剤および液体希釈剤からなる群から選択される少なくとも1種の追加の成分とともに、組成物、すなわち、処方物中の寄生線虫防除活性成分として使用される。処方物または組成物成分は、活性成分の物理的特性、適用様式ならびに土壤タイプ、湿気および温度などの環境因子と一致するように選択される。

40

【0182】

有用な処方物には、液体組成物および固体組成物の両方が含まれる。液体組成物には、溶液（乳化性濃縮物を含む）、懸濁液、エマルジョン（マイクロエマルジョンおよび/またはサスペンションを含む）などが含まれ、これは、任意選択的にゲルに増粘され得る。水性液体組成物の一般的なタイプは、可溶性濃縮物、カプセル懸濁液、濃縮エマルジョン、マイクロエマルジョンおよびサスペンションである。非水性液体組成物の一般的なタイプは、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、分散性濃縮物および油分散液であ

50

る。

### 【0183】

固体組成物の一般的なタイプは、水分散性（「湿潤性」）または水溶性であり得る、粉剤（dust）、粉末、顆粒、ペレット、小粒、芳香錠、錠剤、充填フィルム（種子コーティングを含む）などである。フィルム形成溶液または流動性懸濁液から形成されたフィルムおよびコーティングは、種子処理用に特に有用である。活性成分は、（マイクロ）カプセル化し、懸濁液または固体处方物にさらに形成することができ；あるいはまた有効成分の处方物全体をカプセル化する（または「オーバーコーティングする」）ことができる。カプセル化は、活性成分の放出を制御するか、または遅延させることができる。乳化性顆粒は、乳化性濃縮物处方物と乾燥顆粒处方物の両方の利点を兼ね備える。高強度組成物は、さらなる处方物用の中間体として主に使用される。10

### 【0184】

噴霧可能な处方物は、典型的には、噴霧の前に適当な媒体中で增量される。このような液体および固体处方物は、噴霧媒体、通常は水に容易に希釈されるように処方される。噴霧量は、1ヘクタール当たり約1～数千リットルの範囲であり得るが、より典型的には1ヘクタール当たり約10～数百リットルの範囲である。噴霧可能な处方物は、空中もしくは地上散布による葉面処理のために、または植物の生育培地への散布のために水または別の適当な媒体とタンク混合することができる。液体および乾燥处方物は、植え付け中に、細流かんがいシステムへ直接計量供給するかまたは畝間へ計量供給することができる。液体および固体处方物は、浸透吸収によって成長中の根および他の地下植物部位ならびに／または群葉を保護するために、植え付け前の種子処理として作物および他の望ましい植生の種子上へ適用することができる。20

### 【0185】

处方物は典型的には、合計100重量パーセントになる以下のおよその範囲内で、有効量の活性成分、希釈剤、および界面活性剤を含有する。

### 【0186】

#### 【表17】

	重量パーセント		
	活性成分	希釈剤	界面活性剤
水分散性および水溶性 顆粒、錠剤 および粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸濁液、 エマルジョン、溶液 (乳化性濃縮物を含む)	1-50	40-99	0-50
粉剤	1-25	70-99	0-5
顆粒およびペレット	0.001-95	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

### 【0187】

固体希釈剤には、クレー、例えば、ベントナイト、モンモリロナイト、アタバランジアイトおよびカオリン、石膏、セルロース、二酸化チタン、酸化亜鉛、デンブン、デキストリン、糖類（例えば、ラクトース、スクロース）、シリカ、タルク、雲母、珪藻土、尿素、炭酸カルシウム、炭酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびに硫酸ナトリウムが含まれる。典型的な固体希釈剤は、Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jers4050

eyに記載されている。

### 【0188】

液体希釈剤には、例えば、水、N,N-ジメチルアルカンアミド（例えば、N,N-ジメチルホルムアミド）、リモネン、ジメチルスルホキシド、N-アルキルピロリドン（例えば、N-メチルピロリドン）、アルキルホスフェート（例えば、トリエチルホスフェート）、エチレンギリコール、トリエチレンギリコール、プロピレンギリコール、ジプロピレンギリコール、ポリプロピレンギリコール、プロピレンカーボネート、ブチレンカーボネート、パラフィン（例えば、白色鉱油、ノルマルパラフィン、イソパラフィン）、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、グリセリン、グリセロールトリアセテート、ソルビトール、トリアセチン、芳香族炭化水素、脱芳香族化脂肪族化合物、アルキルベンゼン、アルキルナフタレン、ケトン、例えば、シクロヘキサン、2-ヘプタノン、イソホロンおよび4-ヒドロキシ-4-メチル-2-ペントノン、アセテート、例えば、イソアミルアセテート、ヘキシリニアセテート、ヘプチルアセテート、オクチルアセテート、ノニルアセテート、トリデシルアセテートおよびイソボルニルアセテート、他のエステル、例えば、アルキル化乳酸エステル、二塩基性酸エステルアルキルおよび-ブチロラクトン、ならびに直鎖、分岐、飽和または不飽和であり得るアルコール、例えば、メタノール、エタノール、n-ブロパノール、イソプロピルアルコール、n-ブタノール、イソブチルアルコール、n-ヘキサノール、2-エチルヘキサノール、n-オクタノール、デカノール、イソデシルアルコール、イソオクタデカノール、セチルアルコール、ラウリルアルコール、トリデシルアルコール、オレイルアルコール、シクロヘキサノール、テトラヒドロフルシリアルアルコール、ジアセトンアルコール、およびベンジルアルコールが含まれる。液体希釈剤にはまた、飽和または不飽和脂肪酸（典型的には、C<sub>6</sub>～C<sub>22</sub>）のグリセロールエステル、例えば、植物種子および果実油（例えば、オリーブ、ヒマ、亜麻仁、ゴマ、トウモロコシ（メイズ）、落花生、ヒマワリ、グレープシード、紅花、綿実、大豆、ココナツおよびパーム核）、動物源油（例えば、牛脂、豚脂、ラード、肝油、魚油）、ならびにそれらの混合物が含まれる。  
10

液体希釈剤にはまた、アルキル化（例えば、メチル化、エチル化、ブチル化）脂肪酸であって、脂肪酸が植物源および動物源からのグリセロールエステルの加水分解によって得られてもよく、蒸留によって精製され得る脂肪酸が含まれる。典型的な液体希釈剤は、Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950に記載されている。  
20

### 【0189】

本発明の固体および液体組成物は、1種以上の界面活性剤をしばしば含む。液体に添加される場合、界面活性剤（surfactant）（「界面活性剤（surface-active agent）」としても知られる）は一般に、液体の表面張力を、変性し、ほとんどの場合低下させる。界面活性剤分子中の親水性および親油性基の性質に依存して、界面活性剤は、湿潤剤、分散剤、乳化剤または消泡剤として有用であり得る。  
30

### 【0190】

界面活性剤は、非イオン性、アニオン性またはカチオン性界面活性剤として分類することができる。本組成物に有用な非イオン性界面活性剤には、限定されないが、アルコールアルコキシレート、例えば、（分岐または直鎖であってよい）天然および合成アルコールをベースとし、アルコールと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物とから調製されるアルコールアルコキシレート；アミンエトキシレート、アルカノールアミドおよびエトキシ化アルカノールアミド；アルコキシ化トリグリセリド、例えば、エトキシ化大豆油、ヒマシ油および菜種油；アルキルフェノールアルコキシレート、例えば、オクチルフェノールエトキシレート、ノニルフェノールエトキシレート、ジノニルフェノールエトキシレートおよびドデシルフェノールエトキシレート（フェノール類と、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物とから調製される）；エチレンオキシドまたはプロピレンオキシドから調製されるブロックポリマー、および末端ブロックがプロピレンオキシドから調製される  
40

逆ブロックポリマー；エトキシル化脂肪酸；エトキシル化脂肪酸エステルおよび油；エトキシル化メチルエステル；エトキシル化トリスチリルフェノール（エチレンオキシド、ブロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物から調製されるものを含む）；脂肪酸エスエル、グリセロールエステル、ラノリンベース誘導体、ポリエトキシレートエステル、例えば、ポリエトキシル化ソルビタン脂肪酸エステル、ポリエトキシル化ソルビトール脂肪酸エステルおよびポリエトキシル化グリセロール脂肪酸エステル；他のソルビタン誘導体、例えば、ソルビタンエステル；ポリマー界面活性剤、例えば、ランダムコポリマー、ブロックコポリマー、アルキッドペグ（ポリエチレングリコール）樹脂、グラフトまたは櫛形ポリマーおよび星形ポリマー；ポリエチレングリコール（ペグ）；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル；シリコーンベース界面活性剤；ならびに糖誘導体、例えば、スクロースエステル、アルキルポリグリコシドおよびアルキル多糖類が含まれる。  
【0191】

有用なアニオン界面活性剤には、限定されないが、アルキルアリールスルホン酸およびそれらの塩；カルボキシル化アルコールまたはアルキルフェノールエトキシレート；ジフェニルスルホン酸塩誘導体；リグニンおよびリグニン誘導体、例えば、リグノスルホン酸塩；マレイン酸もしくはコハク酸またはそれらの無水物；オレフィンスルホン酸塩；リン酸エステル、例えば、アルコールアルコキシレートのリン酸エステル、アルキルフェノールアルコキシレートのリン酸エステルおよびスチリルフェノールエトキシレートのリン酸エステル；タンパク質ベース界面活性剤；サルコシン誘導体；スチリルフェノールエーテル硫酸塩；油および脂肪酸の硫酸塩およびスルホン酸塩；エトキシル化アルキルフェノールの硫酸塩およびスルホン酸塩；アルコールの硫酸塩；エトキシル化アルコールの硫酸塩；アミンおよびアミドのスルホン酸塩、例えば、N,N-アルキルタウリン塩；ベンゼン、クメン、トルエン、キシレン、ならびにドデシルおよびトリデシルベンゼンのスルホン酸塩；縮合ナフタレンのスルホン酸塩；ナフタレンおよびアルキルナフタレンのスルホン酸塩；分別石油のスルホン酸塩；スルホスクシナミン酸塩；ならびにスルホコハク酸塩およびそれらの誘導体、例えば、ジアルキルスルホコハク酸塩が含まれる。  
【0192】

有用なカチオン界面活性剤には、限定されないが、アミドおよびエトキシル化アミド；アミン、例えば、N-アルキルプロパンジアミン、トリプロピレントリアミンおよびジプロピレンテトラアミン、ならびに（アミンと、エチレンオキシド、プロピレンオキシド、ブチレンオキシドまたはそれらの混合物とから調製される）エトキシル化アミン、エトキシル化ジアミンおよびプロポキシル化アミン；アミン塩、例えば、アミン酢酸塩およびジアミン塩；第四級アンモニウム塩、例えば、第四級塩、エトキシル化第四級塩およびジ第四級塩；ならびにアミンオキシド、例えば、アルキルジメチルアミンオキシドおよびビス-(2-ヒドロキシエチル)-アルキルアミンオキシドが含まれる。  
【0193】

非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物または非イオン性界面活性剤とカチオン性界面活性剤との混合物もまた、本組成物に有用である。非イオン性、アニオン性およびカチオン性界面活性剤ならびにそれらの推奨される使用は、McCUTCHEON'S DIVISION, THE MANUFACTURING CONFECTIoner Publishing Co. によって発行されたMcCUTCHEON'S EMULSIFIERS AND DETERGENTS, ANNUAL AMERICAN AND INTERNATIONAL EDITIONS; SISELY AND WOOD, ENCYCLOPEDIA OF SURFACE ACTIVE AGENTS, CHEMICAL PUBL. CO., INC., NEW YORK, 1964; およびA.S. DAVIDSON AND B. MILWIDSKY, SYNTHETIC DETERGENTS, SEVENTH EDITION, JOHN WILEY AND SONS, NEW YORK, 1987を含む様々な発行された参考文献に開示されている。  
【0194】

本発明の組成物はまた、処方助剤として当業者に公知の、処方補助剤および添加剤を含有してもよい（それらのいくつかは、固体希釈剤、液体希釈剤または界面活性剤としてもまた機能すると考えられ得る）。このような処方補助剤および添加剤は、pH（緩衝剤）、処理中の発泡（消泡剤、例えば、ポリオルガノシロキサン）、活性成分の沈降（懸濁化剤）、粘度（チキソトロピック増粘剤）、容器中の微生物増殖（抗菌剤）、製品凍結（不凍剤）、色（染料／顔料分散液）、洗脱（フィルム形成剤または粘着剤）、蒸発（蒸発遅延剤）および他の処方属性を制御し得る。フィルム形成剤には、例えば、ポリ酢酸ビニル、ポリ酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルアルコール、ポリビニルアルコールコポリマーおよびワックスが含まれる。処方補助剤および添加剤の例には、McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. によって発行されたMcCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions；およびPCT出願国際公開第03/02422 2号パンフレットにリストされたものが含まれる。

#### 【0195】

式1、式1a、式1bまたは式2の化合物および任意の他の活性成分は典型的には、活性成分を溶媒に溶解させることによって、または液体もしくは乾燥希釈剤中で粉碎することによって本組成物中に組み込まれる。乳化性濃縮物などの、溶液は、成分を単に混合することによって調製することができる。乳化性濃縮物としての使用が意図された液体組成物の溶媒が水混和性である場合、乳化剤が典型的には、水での希釈時に活性含有溶媒を乳化させるために添加される。2,000 μmまでの粒子直径を有する、活性成分スラリーは、3 μmよりも下の平均直径を有する粒子を得るために媒体ミルを使用して湿式ミリングすることができる。水性スラリーは、完成懸濁液濃縮物にすることができる（例えば、米国特許第3,060,084号明細書を参照されたい）か、または噴霧乾燥によってさらに処理して水分散性顆粒を形成することができる。乾燥処方物は通常、2～10 μm範囲の平均粒子直径をもたらす、乾式ミリング法を必要とする。粉剤および粉末は、ブレンドし、そして通常（例えば、ハンマーミルまたは流体エネルギーミルを用いて）粉碎することによって調製することができる。顆粒およびペレットは、あらかじめ形成された顆粒状キャリア上へ活性材料を噴霧することによって、または凝集技術によって調製することができる。Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48、Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57およびそれ以降のページ、ならびに国際公開第91/13546号パンフレットを参照されたい。ペレットは、米国特許第4,172,714号明細書に記載されているとおりに調製することができる。水分散性および水溶性顆粒は、米国特許第4,144,050号明細書、米国特許第3,920,442号明細書および獨国特許第3,246,493号明細書に教示されたとおりに調製することができる。錠剤は、米国特許第5,180,587号明細書、米国特許第5,232,701号明細書および米国特許第5,208,030号明細書に教示されたとおりに調製することができる。フィルムは、英国特許第2,095,558号明細書および米国特許第3,299,566号明細書に教示されたとおりに調製することができる。

#### 【0196】

調合物の技術分野に関するさらなる情報については、T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture", Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress 50

on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133 を参照されたい。また、米国特許第3,235,361号明細書、第6欄16行～第7欄19行まで、および実施例10～41；米国特許第3,309,192号明細書、第5欄43行～第7欄62行まで、ならびに実施例8、12、15、39、41、52、53、58、132、138～140、162～164、166、167および169～182；米国特許第2,891,855号明細書、第3欄66行～第5欄17行および実施例1～4；Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96；Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；ならびにDevelopments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000を参照されたい。

## 【0197】

以下の実施例において、すべての処方物は、従来法で調製される。化合物番号は、索引表中の化合物を意味する。さらなる詳細な説明なしに、先行の記載を使用する当業者は、本発明をその最大限に用いることができると考えられる。したがって、以下の実施例は、単に例証的なものであり、何であれ決して本開示を限定するものではないと解釈されるべきである。パーセンテージは、他に示される場合を除いて重量による。

## 【0198】

## 【表18】

実施例A高強度濃縮物

化合物 9	98.5%
シリカエアロゲル	0.5%
合成非晶質微細シリカ	1.0%

## 【0199】

## 【表19】

実施例B湿潤性粉末

化合物 11	65.0%
デシルフェノールポリエチレングリコールエーテル	2.0%
リグノスルホン酸ナトリウム	4.0%
シリコアルミン酸ナトリウム	6.0%
モンモリロナイト(焼成)	23.0%

## 【0200】

## 【表20】

実施例C顆粒

化合物 26	10.0%
アタパルガイト顆粒(低揮発性物質、0.71/0.30 mm; U.S.S. No. 25-50 シープ)	90.0%

## 【0201】

10

20

30

40

50

【表 2 1】

実施例D押出しペレット

化合物 40	25.0%
無水硫酸ナトリウム	10.0%
粗リグニンスルホン酸カルシウム	5.0%
アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム	1.0%
カルシウム/マグネシウムベントナイト	59.0%

10

【0 2 0 2】

【表 2 2】

実施例E乳化性濃縮物

化合物 43	10.0%
ポリオキシエチルソルビトールヘキサオレエート	20.0%
C <sub>6</sub> -C <sub>10</sub> 脂肪酸メチルエステル	70.0%

20

【0 2 0 3】

【表 2 3】

実施例Fマイクロエマルジョン

化合物 78	5.0%
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	30.0%
アルキルポリグリコシド	30.0%
モノオレイン酸グリセリル	15.0%
水	20.0%

30

【0 2 0 4】

【表 2 4】

実施例G種子処理

化合物 80	20.00%
ポリビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー	5.00%
モンantan酸ワックス	5.00%
リグノスルホン酸カルシウム	1.00%
ポリオキシエチレン/ポリオキシプロピレンブロックコポリマー	1.00%
ステアリルアルコール (POE 20)	2.00%
ポリオルガノシラン	0.20%
着色剤 赤色染料	0.05%
水	65.75%

40

【0 2 0 5】

【表 2 5】

実施例H

<u>肥料スティック</u>			
化合物 84	2.5%		
ピロリドン-スチレンコポリマー	4.8%		
トリスチリルフェニル 16-エトキシレート	2.3%		
タルク	0.8%		
トウモロコシデンプン	5.0%		
緩効性肥料	36.0%		10
カオリン	38.0%		
水	10.6%		

【0206】

【表 2 6】

実施例I

<u>懸濁液濃縮物</u>			
化合物 9	35%		20
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%		
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%		
スチレンアクリルポリマー	1.0%		
キサンタンガム	0.1%		
プロピレングリコール	5.0%		
シリコーン系消泡剤	0.1%		
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン	0.1%		
水	53.7%		

【0207】

【表 2 7】

実施例J

<u>水中エマルジョン</u>			
化合物 11	10.0%		
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%		
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%		
スチレンアクリルポリマー	1.0%		
キサンタンガム	0.1%		40
プロピレングリコール	5.0%		
シリコーン系消泡剤	0.1%		
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン	0.1%		
芳香族石油系炭化水素	20.0		
水	58.7%		

【0208】

【表 2 8】

実施例K油分散液

化合物 26	25%
ポリオキシエチレンソルビトールヘキサオレエート	15%
有機変性ベントナイトクレー	2.5%
脂肪酸メチルエステル	57.5%

【0209】

10

【表 2 9】

実施例Lサスペンション

化合物 40	10.0%
イミダクロプリド	5.0%
ブチルポリオキシエチレン/ポリプロピレンブロックコポリマー	4.0%
ステアリン酸/ポリエチレングリコールコポリマー	1.0%
スチレンアクリルポリマー	1.0%
キサンタンガム	0.1%
プロピレングリコール	5.0%
シリコーンベース消泡剤	0.1%
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン	0.1%
芳香族石油系炭化水素	20.0%
水	53.7%

【0210】

30

したがって、これらの本化合物および組成物は、農作物を寄生線虫から保護するために農学的に、およびまた他の園芸作物および植物を植食性寄生線虫から保護するために非農学的に有用である。この有用性には、遺伝子工学（すなわち、トランスジェニック）によって導入された、または有利な形質を与えるために突然変異生成によって変性された遺伝物質を有する作物および他の植物（すなわち、農学的および非農学的の両方の）を保護することが含まれる。このような形質の例には、除草剤への耐性、植食性有害生物（例えば、昆虫、ダニ、アブラムシ、クモ、線虫、カタツムリ、植物病原性真菌類、細菌およびウイルス）に対する抵抗性、改善された植物成長、高温もしくは低温、低いもしくは高い土壤湿気、および高い塩分濃度などの不利な生育条件の増加した耐性、増加した開花もしくは結果、より大きい収穫収量、より急速な成熟、収穫産物のより高い品質および／もしくは栄養価、または収穫産物の改善された貯蔵もしくは加工特性が含まれる。トランスジェニック植物は、多形質を発現させるように変性することができる。遺伝子工学または突然変異生成によって与えられる形質を有する植物の例には、殺虫性のバチルス・チューリングンシス (*Bacillus thuringiensis*) 毒素を発現させるトウモロコシ、綿、大豆およびジャガイモの変種、例えば、YIELD GARD (登録商標)、KNOCKOUT (登録商標)、STARLINK (登録商標)、BOLLGARD (登録商標)、NUCOTN (登録商標) およびNEWLEAF (登録商標)、INVICTA RR2 PRO (商標)、ならびにトウモロコシ、綿、大豆および菜種の除草剤耐性変種、例えば、ROUNDUP READY (登録商標)、LIBERTY LINK (登録商標)、IMI (登録商標)、STS (登録商標) およびCLEARFIELD (登録商標)、ならびにグリホサート除草剤に対する抵抗性を与えるためのN-アセチルトランスクフェラーゼ (GAT) を発現させる作物、またはアセト乳酸シンターゼ (ALS) を

40

50

阻害する除草剤に対する抵抗性を与えるH R A遺伝子を有する作物が含まれる。本化合物および組成物は、遺伝子工学によって導入された、または突然変異生成によって変性された形質と相乗的に相互作用し、このようにして形質の表現型発現または有効性を高め得るか、または本化合物および組成物の寄生線虫防除有効性を増加させ得る。特に、本化合物および組成物は、寄生線虫に対して毒性があるタンパク質または他の天然産物の表現型発現と相乗的に作用して、これらの有害生物の相加超の(greater-than-additive)防除を与える。

## 【0211】

本発明の組成物はまた、植物栄養物、例えば、窒素、リン、カリウム、硫黄、カルシウム、マグネシウム、鉄、銅、ホウ素、マンガン、亜鉛、およびモリブデンから選択される少なくとも1種の植物栄養物を含む肥料組成物を任意選択的に含むことができる。注目すべきは、窒素、リン、カリウム、硫黄、カルシウムおよびマグネシウムから選択される少なくとも1種の植物栄養物を含む少なくとも1種の肥料組成物を含む組成物である。少なくとも1種の植物栄養物をさらに含む本発明の組成物は、液体もしくは固体の形態であり得る。注目すべきは、顆粒、小スティックまたは錠剤の形態での固体処方物である。肥料組成物を含む固体調合物は、本発明の化合物または組成物を処方成分と一緒に肥料組成物と混合し、次いで造粒または押出などの方法によって処方物を調製することによって調製することができる。代わりに、固体処方物は、揮発性溶媒中の本発明の化合物または組成物の溶液または懸濁液を、寸法安定性混合物、例えば、顆粒、小スティックまたは錠剤の形態での事前調製された肥料組成物上に噴霧し、次いで溶媒を蒸発させることによって調製することができる。10

## 【0212】

本発明の化合物は、植物(例えば、群葉、果実、茎、根または種子)、または動物およびヒト(例えば、血管系もしくは消化系、または他の組織)の内部で生きもしくは成長し、またはそれらを常食とし、したがって、生育および貯蔵農学的作物、森林、温室作物、観賞および苗床作物を損傷し、または動物およびヒト健康を苦しめる広域スペクトルの寄生線虫に対して活性を示すことができる。特に関心のある作物は、結果野菜、例えば、ナス科およびウリ科作物、プランテーション作物、例えば、バナナおよびコーヒー、根作物、例えば、ジャガイモ、タマネギおよびニンジン、ならびに農作物、例えば、タバコ、落花生、綿、サトウキビおよび大豆である。20

## 【0213】

本発明の化合物は、エノプリス目(*Enopliaida*)、ニセハリセンチュウ目(*Dorylaeimida*)、カンセンチュウ目(*Rhabditida*)、エンチュウ目(*Strongyliida*)、カイチュウ目(*Ascarida*)、ギヨウチュウ目(*Oxyurida*)、センビセンチュウ目(*Spirurida*)、ハリセンチュウ目(*Tylenchida*)およびヨウセンチュウ目(*Aphelenchida*)の経済的に重要なメンバー、例えば、限定されないが、経済的に重要な農業有害生物、例えば、ネコブセンチュウ属(*Meloidogyne*)のネコブ線虫、シストセンチュウ属および(*Heterodera*)およびグロボデラ属(*Globodera*)のシスト線虫、ネグサレスセンチュウ属(*Pratylenchus*)のネグサレ線虫、ロチレンクルス属(*Rotylenchulus*)のニセフクロ線虫、ネモグリセンチュウ目(*Radopholus*)のネモグリセンチュウ、ベロノライムス属(*Belonolaimus*)の刺毛線虫、ヘリコチレンクス属(*Helicotylenchus*)およびスクテロネマ属(*Scutellonema*)のラセン線虫、チレンクルス属(*Tylenchulus*)のミカンネ線虫、トリコドルス属(*Trichodorus*)およびパラトリコドルス属(*Paratrichodorus*)のユミハリ線虫、キシフェネマ属(*Xiphinema*)のオオハリ線虫、チレンコルヒンクス属(*Tylenchorhynchus*)のイシユク線虫、ロンギドルス属およびパラロンギドルス属(*Paralongidorus*)のハリ線虫、ホプロライムス属(*Hoplolaimus*)のヤリ線虫、ワセンチュウ科(*Criconematidae*)のワ線虫、ジチレンクス属(*Ditylenchus*304050

) およびアングイナ属 (*Anguina*) のクキ線虫、アフェレンコイデス属 (*Aphelenchooides*) およびラジナフェレンクス属 (*Rhadinaphelenchus*) のハノクキ線虫；ならびに動物およびヒト健康寄生虫（すなわち、経済的に重要な回虫、例えば、ウマにおける普通円虫 (*Strongylus vulgaris*)、イヌにおける犬回虫 (*Toxocara canis*)、ヒツジにおける捻転胃虫 (*Hemonchus contortus*)、イヌにおける犬糸状虫 (*Dirofilaria immitis*) など）を含めて、線形動物門のアデノフォリア綱 (*Adenophorea*) および双腺綱 (*Secernentea*) の両方のメンバーに対して活性を有することができる。

## 【0214】

10

注目すべきは、サツマイモネコブ線虫 (*Meloidogyne incognita*) を防除するための本発明の化合物の使用である。当業者は、すべての化合物が、すべての成長段階のすべての線虫に対して等しく有効であるわけではないことを十分理解する。

## 【0215】

本発明の化合物は、動物およびヒト健康を苦しめる寄生虫（すなわち、経済的に重要な吸虫および条虫）（例えば、ウマにおける葉状条虫 (*Anoplocephala perfoliata*)、反芻動物における肝蛭虫 (*Fasciola hepatica*) など）を含めて、扁形動物門 (*Platyhelminthes*)、条虫綱 (*Cestoda*)（条虫）および吸虫綱（吸虫）のメンバーに対して活性を有することができる。

## 【0216】

20

本発明の化合物はまた、殺虫剤、殺真菌剤、抗線虫剤、殺菌剤、ダニ駆除剤、除草剤、除草剤解毒剤、成長調整物質、例えば昆虫脱皮阻害剤および発根刺激剤など、不妊化剤、情報物質、忌避剤、誘引物質、フェロモン、摂食刺激剤、他の生物学的に活性な化合物または昆虫病原性細菌、さらにより幅広いスペクトルの農学的および農学的有用性を与える多成分殺有害生物剤を形成するためのウィルスまたは真菌類を含む1種以上の他の生物学的に活性な化合物または剤と混合することができる。したがって、本発明はまた、式1、式1aまたは式1bの化合物および有効量の少なくとも1種の追加の生物学的に活性な化合物または剤を含む組成物に関し、界面活性剤、固体希釈剤または液体希釈剤の少なくとも1種をさらに含むことができる。本発明の混合物について、他の生物学的に活性な化合物もしくは剤を、式1、式1aもしくは式bの化合物を含む、本化合物と一緒に処方してプレミックスを形成することができるか、または他の生物学的に活性な化合物もしくは剤を、式1、式1aもしくは式bの化合物を含む、本化合物とは別個に処方し、そして適用前に2つの処方物を（例えば噴霧タンク中で）一緒に組み合わせるか、もしくは、代わりに、連続して適用することができる。

## 【0217】

30

本発明の化合物をそれと処方することができるような生物学的に活性な化合物または剤の例は、例えば、アバメクチン、アセフェート、アセキノシル、アセタミブリド、アクリナトリン、アフィドピロペン ([ (3S, 4R, 4aR, 6S, 6aS, 12R, 12aS, 12bS) - 3 - [(シクロプロピルカルボニル)オキシ] - 1, 3, 4, 4a, 5, 6, 6a, 12, 12a, 12b - デカヒドロ - 6, 12 - ジヒドロキシ - 4, 6a, 12b - トリメチル - 11 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2H, 11H - ナフト [2, 1 - b] ピラノ [3, 4 - e] ピラン - 4 - イル] メチルシクロプロパンカルボキシレ - ト)、アミドフルメト、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、アジンホス - メチル、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ビフェントリン、ビフェナゼート、ビストリフルロン、ボレート、ブロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルボフラン、カルタップ、カルゾール、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルフルアズロン、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、クロマフェノジド、クロフェンテジン、クロチアニジン、シアントラニリプロール (3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロ - 2 - ピリジニル) - N - [4 - シアノ - 2 - メチル - 6 - [(メチルアミノ)カルボニル]フェニル] - 1H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド)、シクラニリプロール (3 - ブロモ - N -

40

50

[ 2 - プロモ - 4 - クロロ - 6 - [ [ ( 1 - シクロプロピルエチル ) アミノ ] カルボニル ] フェニル ] - 1 - ( 3 - クロロ - 2 - ピリジニル ) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド ) 、シクロプロトリン、シクロキサブリド ( ( 5 S , 8 R ) - 1 - [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル ) メチル ] - 2 , 3 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - 9 - ニトロ - 5 , 8 - エポキシ - 1 H - イミダゾ [ 1 , 2 - a ] アゼピン ) 、シフルメトフェン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、サイバーメトリン、アルファ - サイバーメトリン、ゼータ - サイバーメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジアフェンチウロン、ダイアジノン、ジエルドリン、ジフルベンズロン、ジメフルトリン、ジメハイポ、ジメトエート、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレレート、エチプロール、エトフエンプロックス、エトキサゾール、フェンブタチンオキシド、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フィプロニル、フロメトキン ( 2 - エチル - 3 , 7 - ジメチル - 6 - [ 4 - ( トリフルオロメトキシ ) フェノキシ ] - 4 - キノリニルメチルカーボネート ) 、フロニカミド、フルベンジアミド、フルシリネート、フルフェネリム、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン ( メチル ( E ) - 2 - [ [ 2 - クロロ - 4 - ( トリフルオロメチル ) フェノキシ ] メチル ] - - ( メトキシメチレン ) ベンゼンアセテート ) 、フルフェンスルホン ( 5 - クロロ - 2 - [ ( 3 , 4 , 4 - トリフルオロ - 3 - ブテン - 1 - イル ) スルホニル ] チアゾール ) 、フルヘキサフォン、フルオピラム、フルピプロール ( f l u p i p r o l e ) ( 1 - [ 2 , 6 - ジクロロ - 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] - 5 - [ ( 2 - メチル - 2 - プロペン - 1 - イル ) アミノ ] - 4 - [ ( トリフルオロメチル ) スルフィニル ] - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボニトリル ) 、フルピラジフロン ( 4 - [ [ ( 6 - クロロ - 3 - ピリジニル ) メチル ] ( 2 , 2 - ジフルオロエチル ) アミノ ] - 2 ( 5 H ) - フラノン ) 、フルバリネート、タウ - フルバリネート、ホノホス、ホルメタネート、ホスチアゼート、ハロフェノジド、ヘプタフルトリン ( [ 2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - ( メトキシメチル ) フェニル ] メチル 2 , 2 - ジメチル - 3 - [ ( 1 Z ) - 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - 1 - プロペン - 1 - イル ] シクロプロパンカルボキシレ - ト ) 、ヘキサフルムロン、ヘキシチアゾックス、ヒドラメチルノン、イミダクロプリド、インドキサカルブ、殺虫剤石鹼、イソフェンホス、ルフェヌロン、マラチオン、メペルフルトリン ( [ 2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - ( メトキシメチル ) フェニル ] メチル ( 1 R , 3 S ) - 3 - ( 2 , 2 - ジクロロエテニル ) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレ - ト ) 、メタフルミゾン、メタアルデヒド、メタミドホス、メチダチオン、メチオジカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシクロル、メトキシフェノジド、メトフルトリン、メトフルトリン、モノクロトホス、モノフルオロトリン ( m o n o f l u o r o t h r i n ) ( [ 2 , 3 , 5 , 6 - テトラフルオロ - 4 - ( メトキシメチル ) フェニル ] メチル 3 - ( 2 - シアノ - 1 - プロペン - 1 - イル ) - 2 , 2 - ジメチルシクロプロパンカルボキシレ - ト ) 、ニコチン、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、ノビフルムロン、オキサミル、パラチオン、パラチオン - メチル、ペルメトリン、ホレート、ホサロン、ホスマット、ホスファミドン、ピリミカーブ、プロフェノホス、プロフルトリン、プロバルギット、プロトリフェンビュート、ピフルブミド ( 1 , 3 , 5 - トリメチル - N - ( 2 - メチル - 1 - オキソプロピル ) - N - [ 3 - ( 2 - メチルプロピル ) - 4 - [ 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 - メトキシ - 1 - ( トリフルオロメチル ) エチル ] フェニル ] - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド ) 、ピメトロジン、ピラフルプロール、ピレトリン、ピリダベン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、ピリミノストロビン ( メチル ( E ) - 2 - [ [ 2 - [ ( 2 , 4 - ジクロロフェニル ) アミノ ] - 6 - ( トリフルオロメチル ) - 4 - ピリミジニル ] オキシ ] メチル ] - - ( メトキシメチレン ) ベンゼンアセテート ) 、ピリプロール、ピリプロキシフェン、ロテノン、リアノジン、シラフルオフェン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルプロホス、スルホキサフロル ( N - [ メチルオキシド [ 1 - [ 6 - ( トリフルオロメチル ) - 3 - ピリジニル ] エチル ] - - 4 - スルファニリデン ] シアナミド ) 、テブフェノジド、テブ

10

20

30

40

50

フェンピラド、テフルベンズロン、テフルトリン、テルブホス、テトラクロルビンホス、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン（[2,3,5,6-テトラフルオロ-4-(メトキシメチル)フェニル]メチル2,2,3,3-テトラメチルシクロプロパンカルボキシレート）、テトラニリプロール、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、チオキサザフェン（3-フェニル-5-(2-チエニル)-1,2,4-オキサジアゾール）、トルフェンピラド、トラロメトリン、トリアザメート、トリクロルホン、トリフルメゾピリム（2,4-ジオキソ-1-(5-ピリミジニルメチル)-3-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-2H-ピリド[1,2-a]ピリミジニウム内塩）、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）デルタ-エンドトキシン、昆虫病原性細菌、昆虫病原性ウィルスおよび昆虫病原性真菌類などの殺虫剤である。  
10

## 【0218】

特に注目すべきは、アバメクチン、アセタミブリド、アクリナトリン、アフィドピロペン、アミトラズ、アベルメクチン、アザジラクチン、ベンフラカルブ、ベンスルタップ、ビフェントリン、ブプロフェジン、カズサホス、カルバリル、カルタップ、クロラントラニリプロール、クロルフェナピル、クロルピリホス、クロチアニジン、シアントラニリプロール、シクラニリプロール、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ガンマ-シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、サイバーメトリン、アルファ-サイバーメトリン、ゼータ-サイバーメトリン、シロマジン、デルタメトリン、ジエルドリン、ジノテフラン、ジオフェノラン、エマメクチン、エンドスルファン、エスフェンバレート、エチプロール、エトフェンプロックス、エトキサゾール、フェニトロチオン、フェノチオカルブ、フェノキシカルブ、フェンバレート、フィプロニル、フロメトキン、フロニカミド、フルベンジアミド、フルフェノクスロン、フルフェノキシストロビン、フルフェンスルホン、フルピプロール（f l u p i p r o l e）、フルピラジフロン、フルバリネット、ホルメタネット、ホスチアゼート、ヘプタフルトリン、ヘキサフルムロン、ヒドラメチルノン、イミダクロブリド、インドキサカルブ、ルフェヌロン、メペルフルトリン、メタフルミゾン、メチオジカルブ、メソミル、メトブレン、メトキシフェノジド、メトフルトリン、モノフルオロトリン（mono f lu or o t h r i n）、ニテンピラム、ニチアジン、ノバルロン、オキサミル、ビフルブミド、ビメトロジン、ビレトリン、ビリダベン、ビリダリル、ピリミノストロビン、ピリプロキシフェン、リアノジン、スピネトラム、スピノサド、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト、スルホキサフロル、テブフェノジド、テトラメトリン、テトラメチルフルトリン、チアクロブリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオスルタップ-ナトリウム、トラロメトリン、トリアザメート、トリフルメゾピリム、トリフルムロン、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）デルタ-エンドトキシン、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）の全菌株および核多核体病ウィルスの全菌株などの殺虫剤である。  
20  
30

## 【0219】

本発明の化合物と混合するための生物学的剤の一実施形態には、バチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）、およびCell Cap（登録商標）プロセスによって製造されるMVP（登録商標）およびMVP II（登録商標）バイオ殺虫剤（Cell Cap（登録商標）、MVP（登録商標）およびMVP II（登録商標）は、Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USAの商標である）などのバチルス・チューリングエンシス（*Bacillus thuringiensis*）のカプセル化デルタ-エンドトキシンなどの昆虫病原性細菌；黒きょう病菌などの昆虫病原性真菌類；ならびにバキュロウィルス、核多核体病ウィルス（NPV）、例えばアメリカタバコガ（Helicoverpa zea）多核体病ウィルス（HzNPV）、アナグラファ・ファルシフェラ（Anagrapha falcifera）多核体病ウィルス（AfNPV）などを含む昆虫病原性（天然に存在するものおよび遺伝子操作されたものの両方の）ウィルス；ならびにシディア・ボ  
40  
50

モネラ (Cydia pomonella) グラニュロシスウィルス (CPGV) などの  
グラニュロシスウィルス (GV) が含まれる。

【0220】

他の無脊椎有害生物防除活性成分が、異なる化学的分類に属するか、または式1、式1aもしくは式1bの化合物とは異なる作用部位を有するそのような組み合わせが、特に注目すべきである。ある特定の場合には、類似の防除スペクトルを有するが、異なる作用部位を有する少なくとも1種の他の無脊椎有害生物防除活性成分との組み合わせは、耐性管理のために特に有利である。したがって、本発明の組成物は、類似の防除スペクトルを有するが、異なる化学的分類に属するかまたは異なる作用部位を有する生物学的有効量の少なくとも1種の追加の無脊椎有害生物防除活性成分をさらに含むことができる。これらの追加の生物学的に活性な化合物または剤には、限定されないが、カルバメート類 メソミル、オキサミル、チオジカルブ、トリアザメート、およびオルガノホスフェート類 クロルピリホスなどのアセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤；シクロジエン類 ジエルドリンおよびエンドスルファン、ならびにフェニルビラゾール類 エチプロールおよびフィプロニルなどのGABA作動性クロライド・チャネルアンタゴニスト；ピレスロイド類 ピフェントリン、シフルトリン、ベータ-シフルトリン、シハロトリン、ラムダ-シハロトリン、サイパーメトリン、デルタメトリン、ジメフルトリン、エスフェンバレーント、メトフルトリンおよびプロフルトリンなどのナトリウム・チャネルモジュレータ；ネオニコチノイド類 アセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロブリド、ニテンピラム、ニチアジン、チアクロブリド、およびチアメトキサム、およびスルホキサフロルなどのニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アゴニスト；スピノシン類 スピネトラムおよびスピノサドなどのニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) アロステリック活性化剤；アベルメクチン類 アバメクチンおよびエマメクチンなどのクロライド・チャネル活性化剤；ジオフェノラン、メトブレン、フェノキシカルブおよびピリプロキシフェンなどの幼若ホルモン類縁体；ピメトロジンおよびフロニカミドなどの選択的同翅類摂食プロッカー；エトキサゾールなどのダニ増殖阻害剤；プロバルギットなどのミトコンドリアATPシンターゼの阻害剤；クロルフェナピルなどのプロトン勾配の途絶による酸化的リン酸化のウカプラー；ネライストキシン類似体 カルタップなどのニコチン性アセチルコリン受容体 (nAChR) チャネルプロッカー；ベンゾイル尿素類

フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロンおよびトリフルムロン、ならびにブプロフェジンなどのキチン生合成の阻害剤；シロマジンなどの双翅類脱皮搅乱物質；ジアシルヒドラジン類 メトキシフェノジドおよびテブフェノジドなどのエクジソン受容体アゴニスト；アミトラズなどのオクトパミン受容体アゴニスト；ヒドラメチルノンなどのミトコンドリア複合体I II 電子伝達阻害剤；ピリダベンなどのミトコンドリア複合体I 電子伝達阻害剤；インドキサカルブなどの電位依存性ナトリウム・チャネルプロッカー；テトロン酸およびテトラミン酸類 スピロジクロフェン、スピロメシフェンおよびスピロテトラマトなどアセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤；-ケトニトリル類 シエノピラフェンおよびシフルメトフェンなどのミトコンドリア複合体II 電子伝達阻害剤；アントラニルジアミド類、クロラントラニリプロール、シアントラニリプロールおよびシアントラニリプロール、フルベンジアミドなどのジアミド類、ならびにリアノジンなどのリアノジン受容体配位子などのリアニジン (ryanidine) 受容体モジュレータ；アザジラクチン、ビフェナゼート、ピリダリル、ピリフルキナゾンおよびトリフルメゾピリムなどの生物活性に関する標的部位が未知であるかまたはキャラクタリゼーションされていない化合物；バチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringensis) およびそれらが生み出すデルタ-エンドトキシンならびにバチルス・スファエリクス (Bacillus sphaericus) などの昆虫中腸膜の微生物搅乱物質；ならびに核多核体病ウィルス (NPV) および他の天然に存在するもしくは遺伝子操作された殺虫性ウィルスを含む生物学的剤が含まれる。

【0221】

本発明の化合物と処方することができる生物学的に活性な化合物もしくは剤のさらなる

10

20

30

40

50

例は、アシベンゾラル - S - メチル、アルジモルフ、アメトクトラジン、アミスルプロム、アニラジン、アザコナゾール、アゾキシストロビン、ベナラキシル（ベナラキシル - M を含む）、ベノダニル、ベノミル、ベンチアバルカルブ（ベンチアバルカルブ - イソプロピルを含む）、ベンゾビンジフルピル、ベトキサジン、ビナパクリル、ビフェニル、ビテルタノール、ビキサafen、プラスチサイジン - S、ボスカリド、ブロムコナゾール、ブピリメート、ブチオベート、カルボキシン、カルプロパミド、カプタホール、カプタン、カルベンダジム、クロロネブ、クロロタロニル、クロゾリネット、水酸化銅、オキシ塩化銅、硫酸銅、コウモキシストロビン、シアゾファミド、シフルフェナミド、シモキサニル、シプロコナゾール、シプロジニル、ジクロフルアニド、ジクロシメット、ジクロメジン、ジクロラン、ジエトフェンカルブ、ジフェノコナゾール、ジフルメトリム、ジメチリモール、ジメトモルフ、ジモキシストロビン、ジニコナゾール（ジニコナゾール - M を含む）、ジノカップ、ジチアノン、ジチオラン類、ドデモルフ、ドジン、エコナゾール、エタコナゾール、エジフェンホス、エノキサストロビン（エネストロプリンとしても知られる）、エポキシコナゾール、エタボキサム、エチリモール、エトリジアゾール、ファモキサドン、フェナミドン、フェナミンストロビン、フェナリモル、フェンブコナゾール、フェンフラム、フェンヘキサミド、フェノキサニル、フェンピクロニル、フェンプロピジン、フェンプロピモルフ、フェンピラザミン、酢酸フェンチン、水酸化フェンチン、フェルバム、フェリムゾン、フロメトキン、フルアジナム、フルジオキソニル、フルフェノキシストロビン、フルモルフ、フルオピコリド、フルオピラム、フルオキサストロビン、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルスルファミド、フルチアニル、フルトラニル、フルトリアフォール、フルキサピロキサド、ホルペット、フタリド（fthalide）（フタリド（phthalide）としても知られる）、フベリダゾール、フララキシル、フライメトピル、ヘキサコナゾール、ヒメキサゾール、グアザチン、イマザリル、イミベンコナゾール、イミノクタジンアルベシレート（albesilate）、イミノクタジントリアセテート、イオジカルブ（iodicarb）、イブコナゾール、イソフェタミド、イプロベンホス、イプロジオン、イプロバリカルブ、イソプロチオラン、イソピラザム、イソチアニル、カスガマイシン、クレソキシム - メチル、マンコゼブ、マンジプロパミド、マンデストロビン、マンネブ、マパニピリン、メプロニル、メチルジノカップ、メタラキシル（メタラキシル - M / メフェノキサムを含む）、メトコナゾール、メタスルホカルブ、メチラム、メトミノストロビン、メトラフェノン、ミクロブタニル、ナフチチン（nafotide）、ネオアゾジン（メタンアルソン酸鉄）、ヌアリモル、オクチリノン、オフレース、オリサストロビン、オキサジキシル、オキサチアピプロリン、オキソリソ酸、オキスピコナゾール、オキシカルボキシン、オキシテトラサイクリン、ペンコナゾール、ペンシクロン、ペンフルフェン、ペンチオピラド、ペルフラゾエート（perfurazoate）、亜リン酸（その塩、例えば、ホセチルアルミニウムを含む）、ピコキシストロビン、ピペラリン、ポリオキシン、プロベナゾール、プロクロラズ、プロシミドン、プロパモカルブ、プロピコナゾール、プロピネブ、プロキナジド、プロチオカルブ、プロチオコナゾール、ピラクロストロビン、ピラメトストロビン、ピラオキシストロビン、ピラゾホス、ピリベンカルブ、ピリブタカルブ（pyributacarb）、ピリフェノックス、ピリオフェノン、ペリソキサゾール（perisoxazole）、ピリメタニル、ピリフェノックス、ピロールニトリン、ピロキロン、キンコナゾール、キンメチオネート（quinmethionate）、キノキシフェン、キントゼン、シルチオファム、セダキサン、シメコナゾール、スピロキサミン、ストレプトマイシン、硫黄、テブコナゾール、テブフロキン、テクロフタラム（tecloftalam）、テクロフタラム（tecloftalam）、テクナゼン、テルビナフィン、テトラコナゾール、チアベンダゾール、チフルザミド、チオファネート、チオファネート - メチル、チラム、チアジニル、トルクロホス - メチル、トルプロカルブ、トリフルアニド、トリアジメホン、トリアジメノール、トリアリモール、トリアゾキシド、三塩基性硫酸銅、トリクロピリカルブ、トリデモルフ、トリフロキシストロビン、トリフルミゾール、トリモルファミドトリシクラゾール、トリフロキシストロビン、トリホリン、トリチコナゾール、ウニコナゾ 10  
20  
30  
40  
50

-ル、バリダマイシン、バリフェナレート（バリフェナールとしても知られる）、ピンクロゾリン、ジネブ、ジラムおよびゾキサミドなどの殺真菌剤；フルオピラム、スピロテトラマト、チオジカルブ、ホスチアゼート、アバメクチン、イプロジオン、フルエンスルホン、ジメチルジスルフィド、チオキサザフェン、1,3-ジクロロプロペニ（1,3-D）、メタム（ナトリウムおよびカリウム）、ダゾメット、クロロピクリン、フェナミホス、エトプロホス、カデュサホス、テルブホス、イミシヤホス、オキサミル、カルボフラン、チオキサザフェン、バチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) およびパステウリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) などの抗線虫剤；ストレプトマイシンなどの殺菌剤；アミトラズ、キノメチオナート、クロロベンジレート、シヘキサチン、ジコホール、ジエノクロル、エトキサゾール、フェナザキン、フェンブタチンオキシド、フェンプロパトリン、フェンピロキシメート、ヘキシチアゾックス、プロパルギット、ピリダベンおよびテブフェンピラドなどのダニ駆除剤である。

#### 【0222】

ある特定の場合には、本発明の化合物と、他の生物学的に活性な（特に無脊椎有害生物防除）化合物または剤（すなわち、活性成分）との組み合わせは、相加超（すなわち、相乗）効果をもたらすことができる。有効な有害生物防除を確実にしながら環境に放出される活性成分の量を減らすことは常に望ましい。無脊椎有害生物防除活性成分の相乗効果が農学的に満足できるレベルの無脊椎有害生物防除を与える散布率で現れる場合、そのような組み合わせは、作物生産コストを下げ、かつ、環境負荷を減らすのに有利であり得る。

#### 【0223】

本発明の化合物およびそれらの組成物は、無脊椎有害生物に対して毒性があるタンパク質（バチルス・チューリングンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタ-エンドトキシンなどの）を発現させるために遺伝子学的に形質転換された植物に適用することができる。そのような適用は、より幅広いスペクトルの植物保護を提供し、耐性管理のために有利であり得る。外部から適用された本発明の無脊椎有害生物防除化合物の効果は、発現された毒素タンパク質と相乗的であり得る。

#### 【0224】

これらの農業保護剤（すなわち、殺虫剤、殺真菌剤、抗線虫剤、ダニ駆除剤、除草剤および生物学的剤）についての一般的参考文献には、The Pesticide Manual, 13th Edition, C.D.S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 および The Biopesticide Manual, 2<sup>nd</sup> Edition, L.G. Coppung, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001 が含まれる。

#### 【0225】

これらの様々な混合パートナーの1つもしくは複数が使用される実施形態については、これらの様々な混合パートナー（全部で）と式1の化合物の重量比は典型的には、約1：3000～約3000：1である。約1：300～約300：1の重量比（例えば約1：30～約30：1の比）が、注目すべきである。当業者であれば、所望の範囲の生物学的活性に必要とされる有効成分の生物学的有効量を簡単な実験によって容易に決定することができる。これらの追加の成分の包含が、防除される寄生線虫のスペクトルを、式1の化合物単独によって防除されるスペクトルを越えて広げ得ることは明らかである。

#### 【0226】

寄生線虫は、感染の農学的および／または非農学的場所を含む、有害生物の環境に、保護されるべきエリアに、または防除されるべき有害生物上に直接、生物学的有効量で、典型的には組成物の形態での、本発明の1種以上の化合物を適用することによって農学的および非農学的用途において防除される。

#### 【0227】

したがって、本発明は、寄生線虫またはその環境を、生物学的有効量の本発明の化合物

10

20

30

40

50

の 1 種以上、または少なくとも 1 種のそのような化合物を含む組成物、または少なくとも 1 種のそのような化合物と、生物学的有効量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物もしくは剤とを含む組成物と接触させるステップを含む、農学的および / または非農学的用途での寄生線虫の防除方法を含む。本発明の化合物と、生物学的有効量の少なくとも 1 種の追加の生物学的に活性な化合物もしくは剤とを含む適当な組成物の例としては、追加の活性な化合物が、本発明の化合物と同じ顆粒上に、または本発明の化合物のものとは別個の顆粒上に存在する顆粒状組成物が挙げられる。

#### 【 0 2 2 8 】

本発明の化合物または組成物との接触を達成して農作物を寄生線虫から保護するために、化合物または組成物は典型的には、植え付け前に作物の種子に、作物の群葉（例えば、葉、茎、花、果実）に、または作物が植え付けられる前または後に土壤もしくは他の成長培地に適用される。

10

#### 【 0 2 2 9 】

接触の方法の一実施形態は噴霧による。代わりに、本発明の化合物を含む顆粒状組成物を、植物群葉または土壤に適用することができる。本発明の化合物はまた、土壤、苗床箱処理または移植のくぼみに液体処方物、顆粒状調合物の土壤ドレンチとして適用される本発明の化合物を含む組成物と植物を接触させることにより植物吸収によって効果的に送達することができる。土壤ドレンチ液体処方物の形態での本発明の組成物が、注目すべきである。寄生線虫またはその環境を、生物学的有効量の本発明の化合物と、または生物学的有効量の本発明の化合物を含む組成物と接触させるステップを含む寄生線虫の防除方法も注目すべきである。環境が土壤であり、組成物が土壤ドレンチ処方物として土壤に適用される方法が、さらに注目すべきである。本発明の化合物がまた、まん延の場所への局部的な適用によって有効であることが、さらに注目すべきである。接触の他の方法には、直接噴霧および残留噴霧、空中散布、ゲル、種子コーティング、マイクロカプセル化、浸透吸収、餌、耳標、ボーラス投与、噴霧器、燻蒸剤、エアロゾル、粉剤および多くのその他による本発明の化合物または組成物の適用が含まれる。接触の方法の一実施形態は、本発明の化合物または組成物を含む寸法安定性のある肥料顆粒、スティックまたは錠剤を伴う。本発明の化合物はまた、無脊椎防除デバイス（例えば、昆虫網）を製造するための材料中へ含浸させることができる。

20

#### 【 0 2 3 0 】

本発明の化合物はまた、種子を寄生線虫から保護するための種子処理に有用である。本開示および特許請求の範囲との関連で、種子の処理は、種子を、本発明の組成物として典型的には処方されている、生物学的有効量の本発明の化合物と接触させることを意味する。この種子処理は、種子を無脊椎土壤有害生物から保護し、一般にまた、発芽中の種子から成長している芽生えの土壤と接触した根および他の植物部位を保護することができる。種子処理はまた、本発明の化合物または成長中植物内の第 2 活性成分の転流によって群葉の保護を提供し得る。種子処理は、特殊化形質を発現させるために遺伝学的に形質転換された植物がそれから発芽する種子を含む、すべてのタイプの種子に適用することができる。遺伝学的に形質転換された植物の代表的な例には、バチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) 毒素などの、寄生線虫に対して毒性があるタンパク質を発現させるもの、または、グリホサートに対する抵抗性を提供する、グリホサートアセチルトランスフェラーゼなどの除草剤抵抗性を発現させるものが含まれる。

40

#### 【 0 2 3 1 】

種子処理の一方法は、種子を蒔く前に本発明の化合物（すなわち、処方組成物としての）を種子に噴霧するかまたは振りかけることによる。種子処理のために処方される組成物は一般に、フィルム形成剤または接着剤を含む。したがって、典型的には、本発明の種子コーティング組成物は、生物学的有効量の式 1、式 1 a または式 1 b の化合物、およびフィルム形成剤または接着剤を含む。種子は、流動性懸濁液濃縮物を直接種子の回転床中へ噴霧し、次に種子を乾燥させることによってコートすることができる。代わりに、湿った粉末、溶液、サスペンション、乳化性濃縮物および水中エマルジョンなどの他の処方

50

物タイプを、種子上に噴霧することができる。この方法は、種子上にフィルムコーティングを適用するのに特に有用である。様々なコーティング機および方法が、当業者に利用可能である。適当な方法には、P. Kosters et al, Seed Treatment: Progress and Prospects, 1994 B C P C Mongraph No. 57、およびそれにリストされている参考文献にリストアップされたものが含まれる。

#### 【0232】

処理済み種子は典型的には、種子の100 kg当たり約0.1 g～1 kg（すなわち、処理前の種子の約0.0001～1重量%）の量で本発明の化合物を含む。種子処理のために処方される流動性懸濁液は典型的には、約0.5～約70%の活性成分、約0.5～約30%のフィルム形成接着剤、約0.5～約20%の分散剤、0～約5%の増粘剤、0～約5%の顔料および/または染料、0～約2%の消泡剤、0～約1%の保存剤、および0～約75%の揮発性液体希釈剤を含む。10

#### 【0233】

農学的施用について、有効防除に必要とされる施用率（すなわち、「生物学的有効量」）は、防除される線虫の種、線虫の生活環、その大きさ、場所、時節、宿主作物または動物、摂食行動、交尾行動、周囲湿気、温度などに依存する。通常の状況下で、1ヘクタール当たり約0.01～2 kgの活性成分の施用率が、農学的生態系で線虫を防除するのに十分であるが、0.0001 kg / 1ヘクタール程度に少ない施用量が十分であり得るか、または8 kg / 1ヘクタール程度に多い施用率が必要とされ得る。非農学的施用について、有効使用率は、約1.0～50 mg / 平方メートルの範囲であるが、0.1 mg / 平方メートル程度に少ない使用率が十分であり得るか、または150 mg / 平方メートル程度に多い使用率が必要とされ得る。当業者であれば、所望される寄生線虫防除レベルに必要な生物学的有効量を容易に決定することができる。20

#### 【0234】

以下の試験は、具体的な有害生物に対する本発明の化合物の防除効力を実証する。「防除効力」は、著しく低下した摂食をもたらす、寄生線虫成長の阻害（死亡を含む）を表す。しかしながら、本化合物によって与えられる有害生物防除保護は、これらの種に限定されない。

#### 【0235】

##### 本発明の生物学的実施例

###### 試験 A

接触および/または浸透性手段によるサツマイモネコブ線虫（*Meloidogyne incognita*）の防除を、砂土壌混合物およびキュウリ実生で充填した小さく開いた容器からなる試験ユニットで評価した。30

#### 【0236】

試験化合物を、50%アセトンおよび50%水を含有する溶液を使用して処方した。試験化合物を、500 ppmの活性成分の濃度で試験ユニットの土壌に直接施用した。各試験を3回再現した。処理後、試験ユニットを1時間乾燥させ、その後、約400匹の第2段階の幼若（J2）幼虫および800個の卵を土壌中にピペットで入れた。試験ユニットを27℃に保持し、7日間必要に応じて水やりした。40

#### 【0237】

殺線虫効力は、未処理対照と比較する場合に観察される根瘤形成の量によって決定した。虫瘤形成なしは、100%線虫防除を示す。未処理対照で見られるものと等しい虫瘤形成は、0%防除を示す。線虫防除評価なしは、有意な植物毒性を示す化合物に与えた。

#### 【0238】

500 ppmの濃度で試験した化合物の中で、以下は、植物保護の良好なレベル（溶媒処理対照と比較して、根瘤形成の50%以上の低下）を与える、有意な植物毒性をまったく示さなかった：1、2、3、4、5、6、7、8、10、11、12、14、16、17、18、19、20、21、22、23、24、26、27、29、30、32、33、50

3 4、 3 5、 3 6、 3 7、 3 9、 4 0、 4 2、 4 3、 4 5、 4 6、 4 7、 4 8、 5 0、 5  
2、 5 3、 5 6、 5 8、 6 0、 6 2、 6 3、 6 5、 6 7、 7 0、 7 2、 7 4、 7 5、 7 7  
、 8 0、 8 9、 9 0、 9 2、 9 5、 9 6、 1 0 1 および 1 0 3。

---

フロントページの続き

(72)発明者 ジョージ・フィリップ・ラーム

アメリカ合衆国デラウェア州19808. ウィルミントン. フェアヒルドライヴ148

(72)発明者 アンドリュー・ジョン・ディアンジェリス

アメリカ合衆国デラウェア州19810. ウィルミントン. ボーディン・ドライヴ2912

(72)発明者 マシュー・ジェームズ・キャンベル

アメリカ合衆国メリーランド州21911. ライジング・サン. ジョセフ・ビグス・ハイウェイ7  
91

審査官 三上 晶子

(56)参考文献 特表2009-511447(JP,A)

英国特許第01241589(GB,B)

Database REGISTRY, 2015年 5月12日, RN 1701528-49-5, 1700320-26-8, 1698964-67-8  
, 1698570-55-6, 1694846-02-0, 1692807-87-6, 1692425-54-9, 1692225-40-3, 1690245-08-1,  
1691768-89-4, Retrieved from STN international [online] ;retrieved on 1 October 2020  
Database REGISTRY, 2016年 2月, RN 1858737-26-4, Retrieved from STN international  
[online] ;retrieved on 1 October 2020

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C07D201/00 - 519/00

A01N 1/00 - 65/48

A01P 1/00 - 23/00

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