

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 特許公報(B2)

(11) 特許番号

特許第6716567号
(P6716567)

(45) 発行日 令和2年7月1日 (2020.7.1)

(24) 登録日 令和2年6月12日 (2020.6.12)

(51) Int. Cl.	F 1
C07D 413/04	(2006.01) C07D 413/04 C S P
C07D 413/12	(2006.01) C07D 413/12
C07D 413/14	(2006.01) C07D 413/14
A61K 31/506	(2006.01) A61K 31/506
A61K 31/42	(2006.01) A61K 31/42

請求項の数 27 (全 145 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2017-533396 (P2017-533396)
(86) (22) 出願日	平成27年12月21日 (2015.12.21)
(65) 公表番号	特表2018-501253 (P2018-501253A)
(43) 公表日	平成30年1月18日 (2018.1.18)
(86) 國際出願番号	PCT/EP2015/080819
(87) 國際公開番号	W02016/102482
(87) 國際公開日	平成28年6月30日 (2016.6.30)
審査請求日	平成30年12月18日 (2018.12.18)
(31) 優先権主張番号	62/095,071
(32) 優先日	平成26年12月22日 (2014.12.22)
(33) 優先権主張国・地域又は機関	米国(US)

(73) 特許権者	508020155 ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピ ア B A S F S E ドイツ連邦共和国 67056 ルートヴ ィヒスハーフェン・アム・ライン カール 一ボッシュ・シュトラーセ 38 C a r l - B o s c h - S t r a s s e 38, 67056 L u d w i g s h a f e n a m R h e i n, G e r m a n y
(74) 代理人	110002572 特許業務法人平木国際特許事務所

最終頁に続く

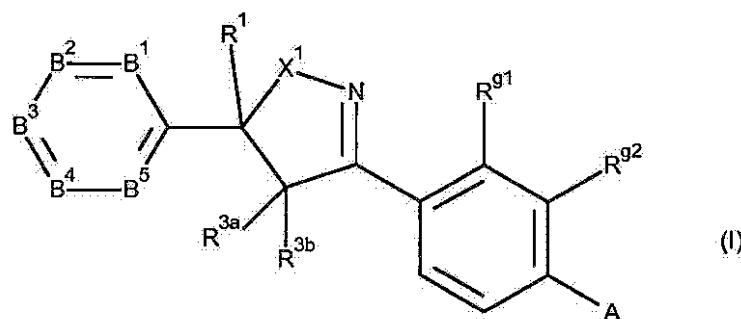
(54) 【発明の名称】 縮合環系により置換されているアゾリン化合物

(57) 【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式Iのアゾリン化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的又は獣医学的に許容される塩

【化 1】



10

{式中、

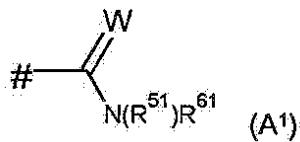
X¹は、0であり、Aは、基A¹又は基A²であり、

ここで、

A¹は、次式

20

【化2】



[式中、

#は、式(I)の芳香族環への結合を表し、

Wは、O及びSから選択される]

の基であり、

A²は、基-C(R^{7a})(R^{7b})-N(R⁵²)-C(=O)-R⁶²であり、

10

B¹、B²、B³、B⁴及びB⁵は、独立して、N及びCR²からなる群から選択され、ただし、B¹、B²、B³、B⁴及びB⁵のうち、最大で1つは、Nであることを条件とし、

R⁹¹及びR⁹²は、一緒にになって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂CH₂-、-CH₂S(O)_pCH₂-、-S(O)_pCH₂S(O)_p-、-OCH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂O-、-OCH₂CH₂CH₂-、-CH₂OCH₂CH₂-、-CH₂CH₂OCH₂-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂OCH₂-、-CH₂OCH₂O-、-S(O)_pCH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂S(O)_p-、-CH₂S(O)_pCH₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)_pCH₂-、-S(O)_pCH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂S(O)_pCH₂-、-CH₂S(O)_pCH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂CH₂O-、-OCH₂S(O)_pCH₂-、-CH₂OCH₂S(O)_p-及び-CH₂S(O)_pCH₂O-から選択される架橋基を形成しており、

ここで、pは、0、1又は2であり、

20

上記の基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロゲン化メチル、ヒドロキシル、メトキシ及びハロゲン化メトキシから選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、かつ又は上記の基の1若しくは2個のCH₂基は、C=O基で置換されていてもよく、

R¹は、C₁-ハロアルキルであり、

各R²は、独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₂-ハロアルコキシ及びC₁～C₂-ハロアルキルからなる群から選択され、

R^{3a}及びR^{3b}は、互いに独立して、水素及びハロゲンから選択され、

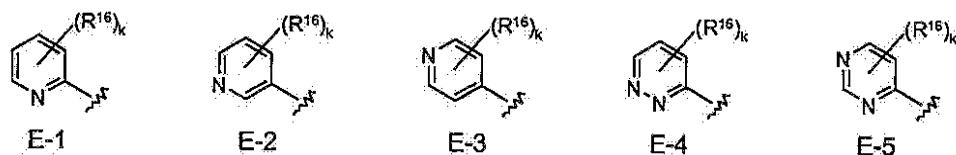
R^{7a}及びR^{7b}は、互いに独立して、水素、シアノ、メチル及びC₁-ハロアルキルから選択され、

R⁵¹及びR⁵²は、互いに独立して、水素、C₁～C₃-アルキル、C₂～C₃-アルケニル、C₂～C₃-アルキニル、C₁～C₆-アルコキシメチル及びCH₂-CNからなる群から選択され、

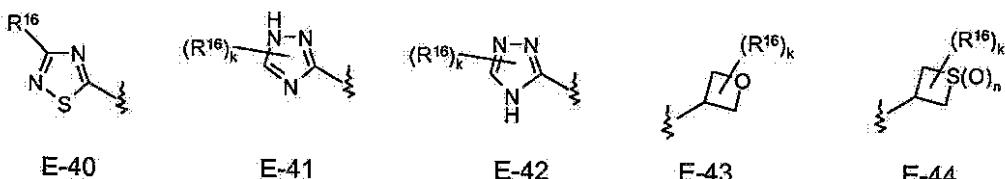
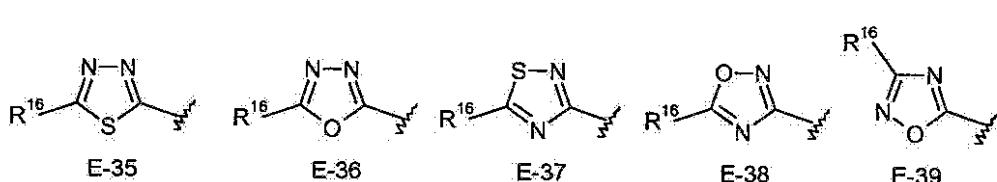
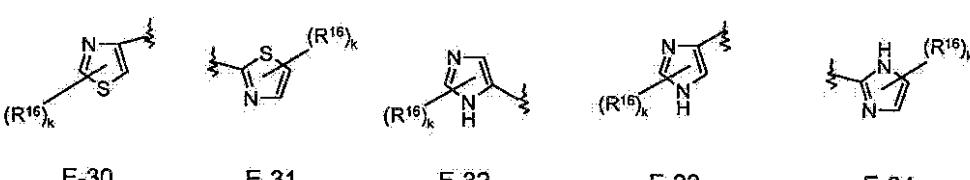
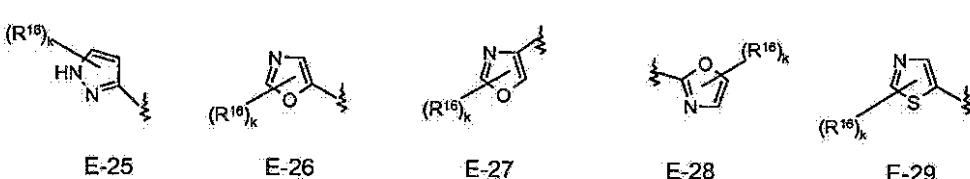
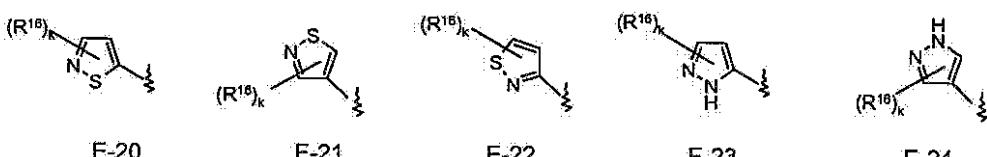
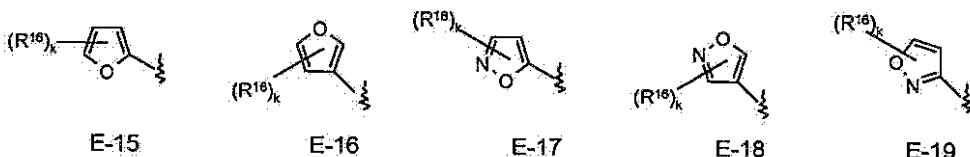
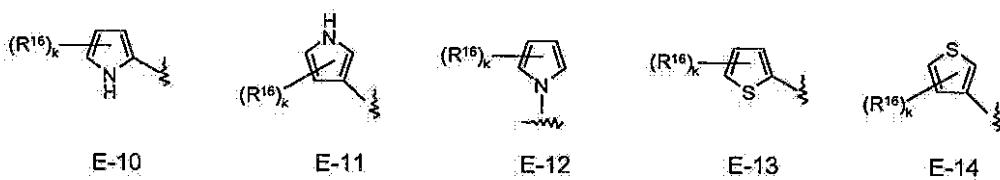
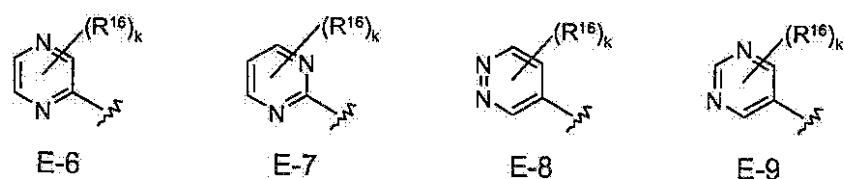
30

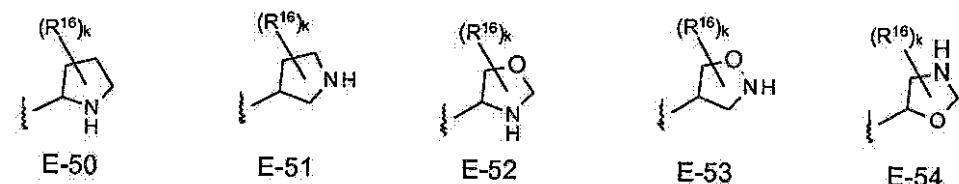
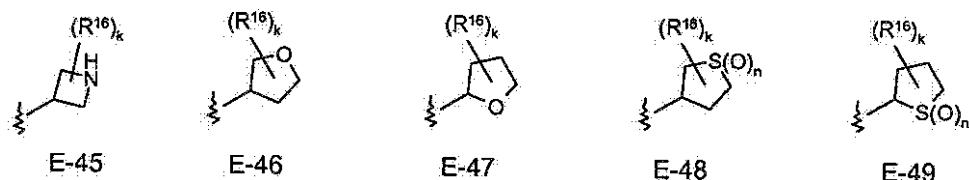
R⁶¹は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1又は2個の基R⁸¹を有するC₁～C₆-アルキル、1個の基R⁸¹を有するC₁～C₆-ハロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、C₂～C₆-ハロアルケニル、C₂～C₆-アルキニル、1又は2個のCN置換基で置換されていてもよいC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、-N(R^{101a})R^{101b}、-CH=NOR⁹¹、1、2、3、4、又は5個の置換基R¹⁶で置換されていてもよいフェニル、及び環E-1～E-63

【化3】

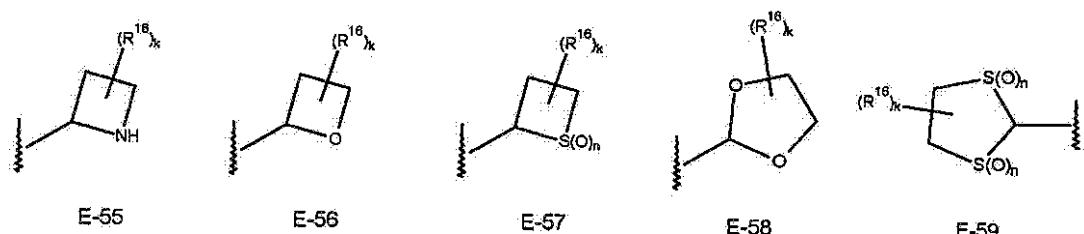


40

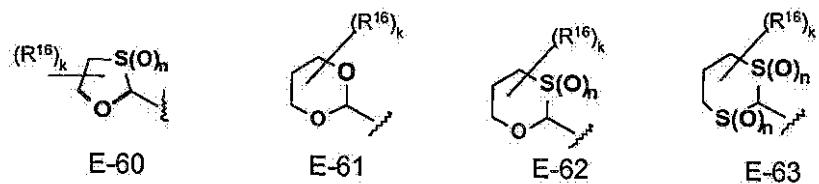




10



20



30

[ここで、環E-1～E-63において、ジグザグの線は、分子の残部への結合点を表し、
kは、0、1、2又は3であり、
nは、0、1又は2であり、
R¹⁶は、以下に定義する通りである]

から選択される複素環式環からなる群から選択され、

R⁶²は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1又は2個の基R⁸²で置換されているC₁～C₆-アルキル、1個の基R⁸²を有するC₁～C₆-ハロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、C₂～C₆-ハロアルケニル、C₂～C₆-アルキニル、C₂～C₆-ハロアルキニル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、-N(R¹⁰²a)R¹⁰²b、-C(=O)N(R¹¹²a)R¹¹²b、-CH=NOR⁹²、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環からなる群から選択され、

各R⁸¹は、独立して、OH、CN、CN又はC₁-ハロアルキル置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル、-C(=O)N(R¹⁰¹c)R¹⁰¹d、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

各R⁸²は、独立して、OH、CN、CN又はC₁-ハロアルキル置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-ハロアルキ

40

50

ルスルホニル、 $-C(=O)N(R^{102c})R^{102d}$ 、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

R^{91} 及び R^{92} は、互いに独立して、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル及び C_1 ～ C_6 -ハロアルキルから選択され、

R^{101a} 、 R^{102a} 、 R^{102c} 及び R^{112a} は、互いに独立して、水素及び C_1 ～ C_6 -アルキルから選択され、

R^{101b} は、水素、 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-42の環から選択される複素環式環から選択され、

R^{102b} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 CH_2-CN 、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキルメチル、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-42の環から選択される複素環式環から選択され、

R^{101c} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_2 ～ C_3 -アルキニル及び CH_2-CN からなる群から選択され、

R^{101d} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 CH_2-CN 、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキルメチル、 C_1 ～ C_6 -アルコキシ、 C_1 ～ C_6 -ハロアルコキシ、フェニル(フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシ、 C_1 ～ C_4 -アルキルチオ及び C_1 ～ C_4 -ハロアルキルチオからなる群から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合によって置換されている)、並びに上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環からなる群から選択され、

R^{102d} 及び R^{112b} は、互いに独立して、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_6 -アルケニル、 C_2 ～ C_6 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_6 -アルキニル、 C_2 ～ C_6 -ハロアルキニル、CN置換基を場合によって有する C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル及び C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキルメチルから選択され、

R^{14a} は、水素及び C_1 ～ C_6 -アルキルからなる群から選択され、

R^{14b} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 CH_2-CN 、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ及び C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシからなる群から選択され、

各 R^{16} は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル- C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル- C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシ、 C_1 ～ C_4 -アルキルチオ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1 ～ C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1 ～ C_4 -アルキルスルホニル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1 ～ C_4 -アルキルカルボニル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノカルボニル及びジ-(C_1 ～ C_4 -アルキル)アミノカルボニルからなる群から選択され、又は

飽和環の同じ炭素原子上に存在する2個の R^{16} は、一緒になって、=O若しくは=Sを形成してもよく、又は

複素環式環の同じS若しくはSO環員上に存在する2個の R^{16} は、一緒になって、基=N(C_1 ～ C_6 -アルキル)、=NO(C_1 ～ C_6 -アルキル)、=NN(H)(C_1 ～ C_6 -アルキル)若しくは=NN(C_1 ～ C_6 -アルキル)₂を形成してもよい)。

【請求項2】

Wが0である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Aが基A¹であり、ここで、R⁵¹は水素であり、R⁶¹は請求項1で定義される通りである、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項4】

R⁶¹が、1個の基R⁸¹を有するC₁～C₂-アルキル、1個の基R⁸¹を有するC₁～C₂-ハロアルキル、1又は2個のCN置換基で置換されていてもよいC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、並びに環E-44及び環E-53から選択される複素環式環からなる群から選択され、ここで、

10

R⁸¹は、CN又はC₁～ハロアルキル置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、-C(=O)N(R^{101c})R^{101d}、及び請求項1で定義される環E-1～E-6

3、特に環E-1～E-9から選択される複素環式環からなる群から選択され、ここで、

R^{101c}は、水素及びC₁～C₄-アルキルからなる群から選択され、

R^{101d}は、水素、C₁～C₆-アルキル及びC₁～C₆-ハロアルキルからなる群から選択される、

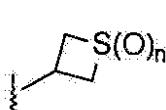
請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

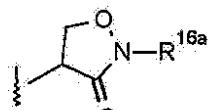
R⁶¹が、環E-44-1及び環E-53-1

【化4】

20



E-44-1



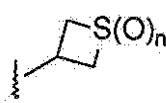
E-53-1

から選択され、

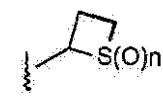
R⁸¹が、環E-44-1及び環E-57-1

【化5】

30



E-44-1



E-57-1

から選択され、

ここで、

nは、0、1又は2であり、

R^{16a}は、水素、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-ハロアルケニル、C₂～C₄-アルキニル、C₂～C₄-ハロアルキニル及びCH₂-(C₃～C₆-シクロアルキル)からなる群から選択され、特に水素及びC₁～C₄-アルキルから選択される、

40

請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

Aが基A²であり、ここで、

R^{7a}は、水素であり、

R^{7b}は、水素、CH₃、CF₃及びCNから選択され、

R⁵²は、水素及びC₁～C₃-アルキルから選択され、

R⁶²は、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1個の基R⁸²で置換されているC₁～C₄-アルキル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び請求項1で定義される式E-1～E-63の環から選択される複素環式環から選択され、ここで、

50

R^{82} は、CN、CN又はCF₃置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル、1、2又は3個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び請求項1で定義される環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

フェニル及び環E-1～E-63におけるR¹⁶は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₁～C₄-アルコキシ及びC₁～C₄-ハロアルコキシから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

10

R^{7a}及びR^{7b}が、水素であり、

R⁵²が、水素であり、

R⁶²が、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1個の基R⁸²で置換されているC₁～C₄-アルキル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、及びC₃～C₆-ハロシクロアルキルから選択され、ここで、

R⁸²は、CN、CN又はCF₃置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル及びC₁～C₆-ハロアルキルスルホニルから選択され、特にC₁～C₆-アルキルスルホニル及びC₁～C₆-ハロアルキルスルホニルから選択される、請求項6に記載の化合物。

20

【請求項8】

B¹、B³、B⁴及びB⁵がCR²であり、ここで、R²は請求項1で定義される通りであり、B²がCR²であり、ここで、R²は請求項1で定義される通りであるが、水素ではない、請求項1～7のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R²が、水素、F、Cl、Br、OCF₃及びCF₃から選択され、特に水素、F及びClから選択される、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

30

R⁹¹及びR⁹²が、一緒になって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-SCH₂CH₂-、-CH₂SCH₂-、-SCH₂S-、-OCH₂S-、-SCH₂O-、-CH₂OCH₂S(O)-、-S(O)CH₂CH₂-、-CH₂S(O)CH₂-、-CH₂CH₂S(O)₂-、-S(O)₂CH₂CH₂-、-CH₂S(O)₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)₂CH₂O-及び-OCH₂CH₂CH₂-から選択される架橋基を形成しており、特に-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-SCH₂CH₂-、-CH₂SCH₂-、-SCH₂S-、-OCH₂S-及び-SCH₂O-から選択される架橋基を形成している、請求項1～9のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項11】

R⁹¹及びR⁹²が、一緒になって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-及び-SCH₂CH₂-から選択される架橋基を形成しており、特に-CH₂CH₂O-(ここで、OはR⁹²の位置において結合している)を形成している、請求項10に記載の化合物。

【請求項12】

40

R⁹¹及びR⁹²が、一緒になって、-CH₂CH₂O-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-SCH₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)-、-CH₂S(O)CH₂-、-CH₂CH₂S(O)₂-、-CH₂S(O)₂CH₂-及び-CH₂CH₂S(O)₂CH₂O-から選択される架橋基を形成している、請求項10に記載の化合物。

【請求項13】

R¹がCF₃である、請求項1～12のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項14】

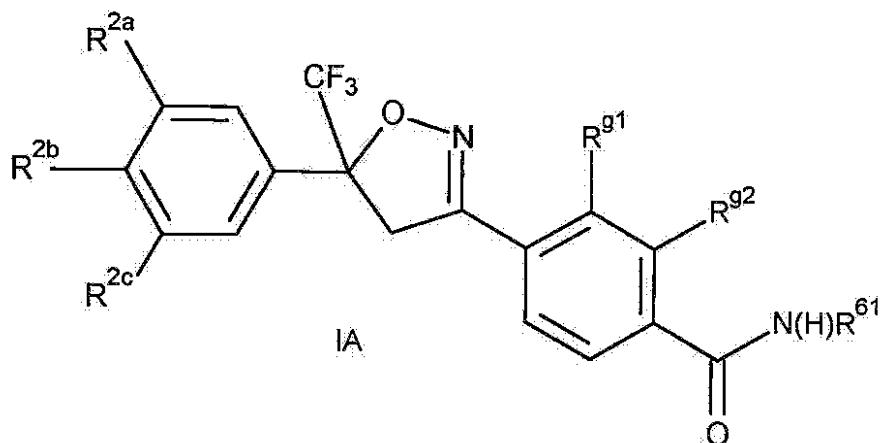
R^{3a}及びR^{3b}が、互いに独立して、水素又はフッ素であり、特に水素である、請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項15】

請求項1～3及び8～14のいずれか1項に記載の化合物であって、式IAの化合物、並びにそ

50

のN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩
【化6】



10

〔式中、

 R^{g1} 及び R^{g2} は、請求項1又は10～12のいずれか1項で定義される通りであり、 R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、 R^{61} は、 $CH_2-C(O)-N(H)-R^{101d}$

〔式中、

20

R^{101d} は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1又は2個のフッ素原子で置換されている $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 CH_2-CN 、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル及び $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルメチルからなる群から選択される]である}。

【請求項16】

請求項1～4及び8～14のいずれか1項に記載の化合物であって、

 R^{g1} 及び R^{g2} が、請求項1又は10～12のいずれか1項で定義される通りであり、 R^{2a} が、CIであり、 R^{2b} が、Fであり、 R^{2c} が、CIであり、 R^{61} が、 $-CH_2-R^{81}$

〔式中、

30

R^{81} は、請求項1又は5で定義される環E-5、E-6、E-7、E-19、E-25、E-27、E-44-1及びE-57-1から選択され、ここで、環E-5、E-6、E-7、E-19、及びE-27は、非置換であり(k は0である)、又は1若しくは2個の置換基 R^{16} を有し(k は1又は2である)、ここで、

各 R^{16} は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ -アルキニルから選択され、

ここで、環E-25は、1位の窒素原子上に1個の R^{16} 置換基を有し、1又は2個のさらなる置換基 R^{16} を場合によって有し、ここで、

40

R^{16} は、上記で定義した通りであるが、E-25の1位に結合している R^{16} は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニル又は $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルホニルではない]である、請求項15で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩。

【請求項17】

請求項1～3及び8～14のいずれか1項に記載の化合物であって、

 R^{g1} 及び R^{g2} が、請求項1又は10～12のいずれか1項で定義される通りであり、 R^{2a} が、CIであり、 R^{2b} が、Fであり、 R^{2c} が、CIであり、

50

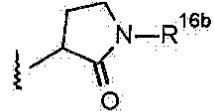
R^{61} が、請求項1又は5で定義される環E-2、E-4、E-6、E-8、E-9、E-44-1、E-46、E-51及びE-53-1から選択され、ここで、環E-2、E-4、E-6、E-8、E-9、及びE-46は、非置換であり(k は0である)、又は1若しくは2個の置換基 R^{16} を有し(k は1又は2である)、ここで、

各 R^{16} は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル、及び $C_2 \sim C_3$ -アルキニルから選択され、

ここで、環E-51は、式E-51-1

【化7】

10



E-51-1

[式中、

R^{16b} は、水素、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル及び $C_2 \sim C_3$ -アルキニルからなる群から選択される]

の環である、請求項15で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩。

20

【請求項18】

請求項1~3及び8~14のいずれか1項に記載の化合物であって、

R^{91} 及び R^{92} が、請求項1又は10~12のいずれか1項で定義される通りであり、

R^{2a} が、CIであり、 R^{2b} が、Fであり、 R^{2c} が、CIであり、

R^{61} が、1又は2個のフッ素原子で置換されていてもよい $C_2 \sim C_4$ -アルキル、シクロプロピル、 $C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルキル、 $CH_2-(C_3 \sim C_5$ -ハロシクロアルキル)、 $CH_2-(1\text{-シアノ}-C_3 \sim C_5$ -シクロアルキル)、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 CH_2-CN 及び $-CH=NR^{91}$ (式中、 R^{91} は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル及び $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルから選択される)から選択される、請求項15で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩。

30

【請求項19】

請求項1~3及び8~14のいずれか1項に記載の化合物であって、

R^{91} 及び R^{92} が、請求項1又は10~12のいずれか1項で定義される通りであり、

R^{2a} が、CIであり、 R^{2b} が、Fであり、 R^{2c} が、CIであり、

R^{61} が、 $N(H)R^{101b}$

[式中、

R^{101b} は、 $-C(O)-N(H)R^{14b}$ 、並びに請求項1で定義される環E-1及び環E-7から選択され、

ここで、

R^{14b} は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル及びシクロプロピルから選択され、環E-1及び環E-7において、

k は、0、1又は2であり、

各 R^{16} は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ -アルキニルから選択される]

40

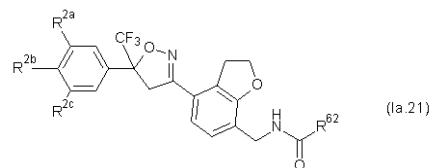
である、請求項15で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩。

【請求項20】

50

請求項1及び6~14のいずれか1項に記載の化合物であって、式(Ia.21)の化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩

【化8】



{式中、

R⁶²は、請求項1、6又は7のいずれか1項で定義される通りであり、R^{2a}、R^{2b}及びR^{2c}は、互に独立して、請求項1、8又は9のいずれか1項で定義される通りのR²の意味のうちの1つを有する}。

【請求項21】

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Hであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、メチル、エチル、n-ブロピル、シクロプロピル、-CH₂CF₃、-CH₂SCH₃、-CH₂SCH₂CH₃、-CH₂S(O)CH₃、-CH₂S(O)CH₂CH₃、-CH₂S(O)₂CH₃、-CH₂S(O)₂CH₂CH₃、-CH₂OCH₃及び-CH₂CH₂OCH₃からなる群から選択されるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、Hであり、R⁶²が、メチル、エチル、n-ブロピル、シクロプロピル、-CH₂CF₃、-CH₂SCH₃、-CH₂SCH₂CH₃、-CH₂S(O)CH₃、-CH₂S(O)CH₂CH₃、-CH₂S(O)₂CH₃、-CH₂S(O)₂CH₂CH₃、-CH₂OCH₃及び-CH₂CH₂OCH₃からなる群から選択されるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、メチル、エチル、n-ブロピル、シクロプロピル、-CH₂CF₃、-CH₂SCH₃、-CH₂SCH₂CH₃、-CH₂S(O)CH₃、-CH₂S(O)CH₂CH₃、-CH₂S(O)₂CH₃、-CH₂S(O)₂CH₂CH₃、-CH₂OCH₃及び-CH₂CH₂OCH₃からなる群から選択される、請求項20に記載される化合物。

【請求項22】

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₂CH₂CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₂S(O)₂CH₂CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₂S(O)₂CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Fであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、シクロプロピルであるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Hであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₂CH₂CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Hであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Hであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₂S(O)₂CH₂CH₃であるか、又は

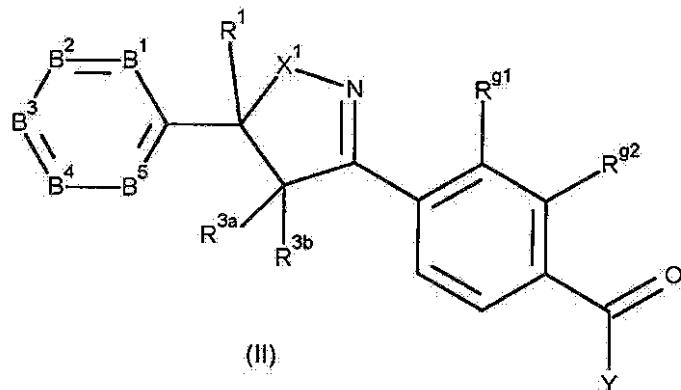
R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Hであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、-CH₂S(O)₂CH₃であるか、又は

R^{2a}が、CIであり、R^{2b}が、Hであり、R^{2c}が、CIであり、R⁶²が、シクロプロピルである、請求項21に記載される化合物。

【請求項23】

式IIの化合物

【化 9】



10

[式中、

$B^1, B^2, B^3, B^4, B^5, X^1, R^1, R^{3a}, R^{3b}, R^{g1}$ 及び R^{g2} は、請求項1及び8~19のいずれか1項で定義される通りであり、

Yは、水素及びOR¹⁷

(式中、

R^{17} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル及び $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルから選択される)から選択される]。

【請求項 2 4】

20

請求項1～22のいずれか1項で定義される、少なくとも1種の式1の化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的若しくは獣医学的に許容される塩と、少なくとも1種の不活性な液体及び/又は固体の農業的又は獣医学的に許容される担体とを含む農業用又は獣医用組成物。

【請求項 25】

無脊椎有害生物を駆除するための、請求項1～22のいずれか1項で定義される化合物、その立体異性体及び/又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩の使用（ただし、使用はヒトの治療を含まない）。

【請求項 26】

無脊椎有害生物による寄生又は感染から動物を治療又は保護するための、請求項1～22のいずれか1項で定義される化合物、その立体異性体及び/又は獣医学的に許容される塩の使用（ただし、動物はヒトではない）。

【請求項 27】

植物繁殖材料及び/又はそれから生育する植物を無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から保護する方法であって、植物繁殖材料を、殺有害生物有効量の、請求項1～22のいずれか1項で定義される、少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩で処理することを含む、方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

[0 0 0 1]

40

本発明は、無脊椎有害生物、特に節足有害生物及び線虫を駆除又は防除するのに有用な縮合環系により置換されているアゾリン化合物に関する。本発明はまた、これらの化合物を使用することにより無脊椎有害生物を防除する方法、並びに上記化合物を含む植物繁殖材料、並びに上記化合物を含む農業用組成物及び獣医用組成物に関する。

【背景技术】

〔 0 0 0 2 〕

無脊椎有害生物、特に節足動物及び線虫は、生育中及び収穫済みの作物に被害を与え、木造住宅及び商業建築物を襲うことによって、食糧供給や所有物に多大な経済的損失をもたらす。多くの殺有害生物剤が知られているが、標的有害生物は上記薬剤に対する抵抗性を発現し得るため、無脊椎有害生物、特に昆虫、クモ形類及び線虫を駆除するための新た

50

な薬剤が引き続き必要とされている。

【0003】

関連する化合物は、特許文献1 (WO 2013/026929)、特許文献2 (WO 2012/163959)、特許文献3 (WO 2012/007426)、特許文献4 (WO 2011/067272)、特許文献5 (WO 2010/149506)、特許文献6 (WO 2010/020522)、特許文献7 (WO 2009/080250)、特許文献8 (EP-A-1731512)、特許文献9 (JP-A-2007091708)、及び特許文献10 (JP-A-2008133273)に記載されている。しかしながら、これらの文献は、本発明において特許請求されている特有の置換基及び置換基の配置を有する化合物を記載していない。

【先行技術文献】

【特許文献】

10

【0004】

【特許文献1】国際公開第2013/026929号

【特許文献2】国際公開第2012/163959号

【特許文献3】国際公開第2012/007426号

【特許文献4】国際公開第2011/067272号

【特許文献5】国際公開第2010/149506号

【特許文献6】国際公開第2010/020522号

【特許文献7】国際公開第2009/080250号

【特許文献8】欧州特許出願公開第1731512号明細書

【特許文献9】特開2007-091708号公報

20

【特許文献10】特開2008-133273号公報

【発明の概要】

【0005】

本発明の目的は、良好な殺有害生物活性、特に殺虫活性を有し、且つ多くの様々な無脊椎有害生物、とりわけ、防除が困難な節足有害生物及び/又は線虫に対する広い活性スペクトルを示す化合物を提供することである。

【0006】

さらに、本発明の目的は、持続性、生体内蓄積性、及び/又は有毒性が、従来技術の化合物よりも少ない化合物を提供することである。特に、従来技術のイソオキサゾリン殺虫剤は、土壤中において、高い持続性を示し、したがって、そこに蓄積する。

30

【0007】

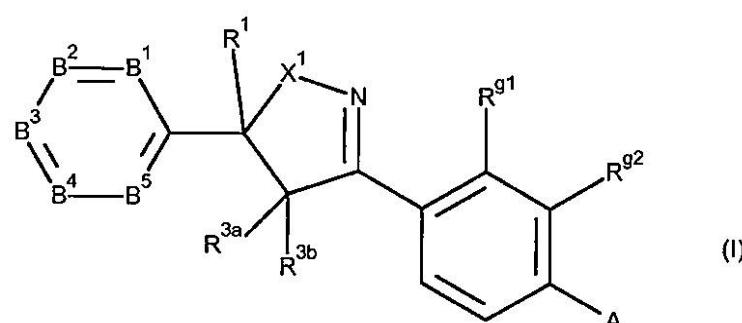
これらの目的は、以下の式Iのアゾリン化合物、それらの立体異性体、それらのN-オキシド、及びそれらの塩、特にそれらの農業的又は獣医学的に許容される塩によって達成し得ることが見いだされた。

【0008】

したがって、第1の態様において、本発明は、式Iのアゾリン化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的又は獣医学的に許容される塩に関する:

【0009】

【化1】



{式中、

X¹は、0又はCH₂であり、

40

50

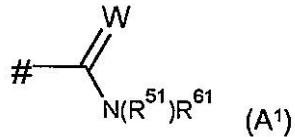
Aは、基A¹又は基A²であり、

ここで、

A¹は、次式

【0 0 1 0】

【化2】



10

[式中、

#は、式(I)の芳香族環への結合を表し、

Wは、O及びSから選択される]

の基であり、

A²は、基-C(R^{7a})(R^{7b})-N(R⁵²)-C(=O)-R⁶²であり、

B¹、B²、B³、B⁴及びB⁵は、独立して、N及びCR²からなる群から選択され、ただし、B¹、B²、B³、B⁴及びB⁵のうち、最大で1つは、Nであることを条件とし、

R⁹¹及びR⁹²は、一緒にになって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂CH₂-、-CH₂S(O)_pCH₂-、-S(O)_pCH₂S(O)_p-、-OCH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂O-、-OCH₂CH₂CH₂-、-CH₂OCH₂CH₂-、-CH₂CH₂OCH₂-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂OCH₂-、-OCH₂CH₂O-、-S(O)_pCH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂S(O)_p-、-CH₂S(O)_pCH₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)_pCH₂-、-S(O)_pCH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂S(O)_pCH₂-、-CH₂S(O)_pCH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂OCH₂-、-OCH₂S(O)_pCH₂-、-CH₂OCH₂S(O)_p-及び-CH₂S(O)_pCH₂O-から選択される架橋基を形成しており、

ここで、pは、0、1又は2であり、

上記の基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロゲン化メチル、ヒドロキシル、メトキシ及びハロゲン化メトキシから選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、かつ/又は上記の基の1若しくは2個のCH₂基は、C=O基で置換されていてもよく、

R¹は、C₁-ハロアルキルであり、

各R²は、独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₂-ハロアルコキシ及びC₁～C₂-ハロアルキルからなる群から選択され、

R^{3a}及びR^{3b}は、互いに独立して、水素及びハロゲンから選択され、

R^{7a}及びR^{7b}は、互いに独立して、水素、シアノ、メチル及びC₁-ハロアルキルから選択され、

R⁵¹及びR⁵²は、互いに独立して、水素、C₁～C₃-アルキル、C₂～C₃-アルケニル、C₂～C₃-アルキニル、C₁～C₆-アルコキシメチル及びCH₂-CNからなる群から選択され、

R⁶¹は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1又は2個の基R⁸¹を有するC₁～C₆-アルキル、1個の基R⁸¹を有するC₁～C₆-ハロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、C₂～C₆-アルキニル、C₂～C₆-アルコキシアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、-N(R^{101a})R^{101b}、-CH=NOR⁹¹、1、2、3、4、又は5個の置換基R¹⁶で置換されていてもよいフェニル、及び環E-1～E-63

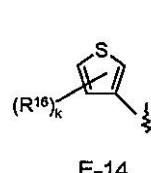
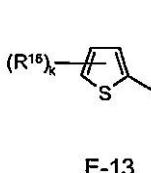
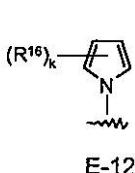
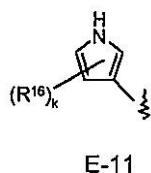
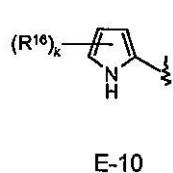
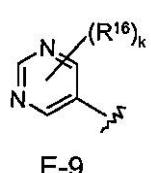
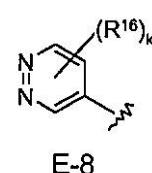
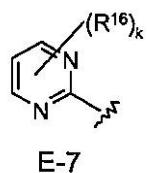
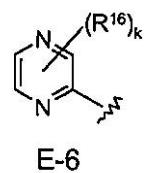
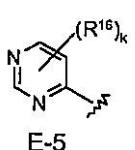
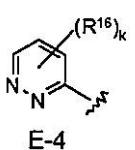
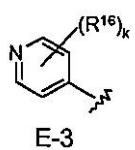
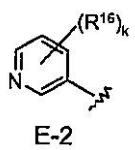
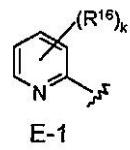
【0 0 1 1】

20

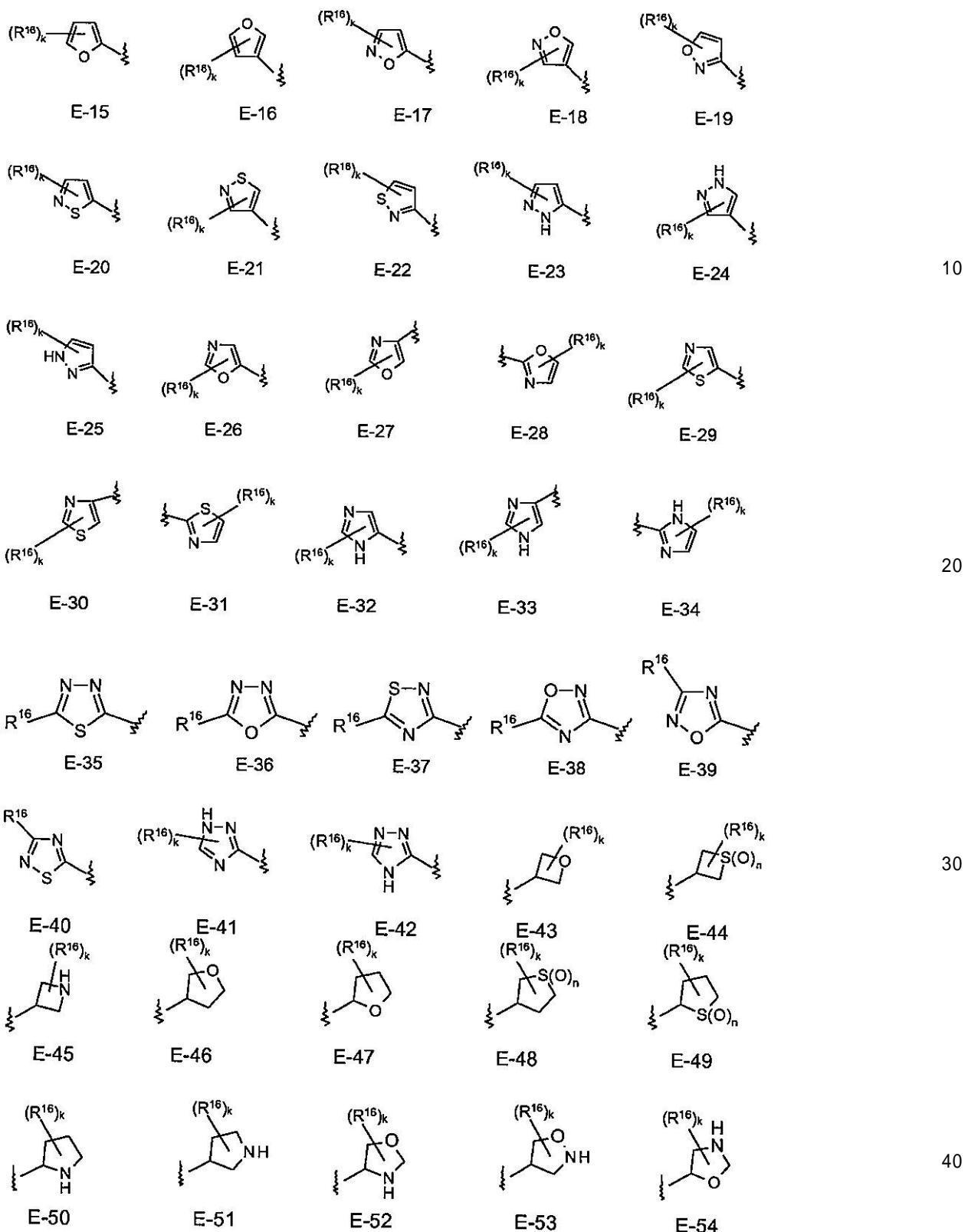
30

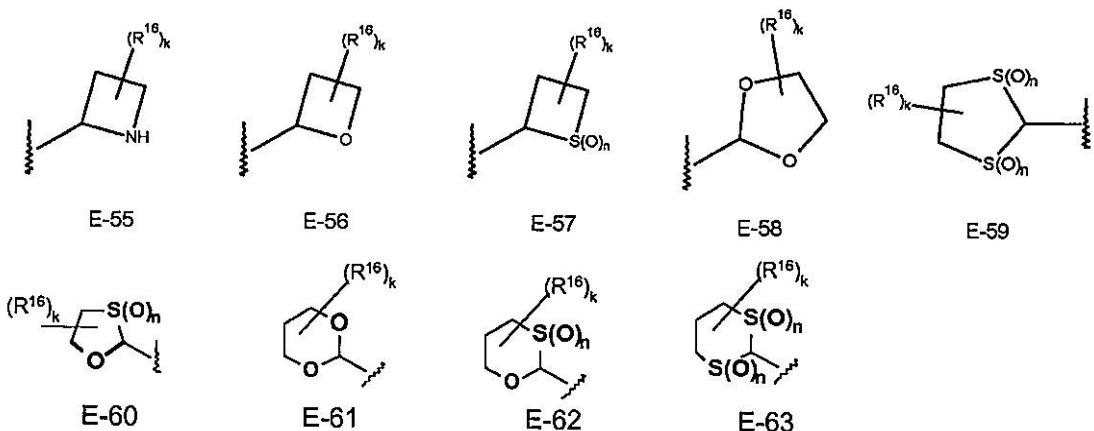
40

【化3】



10





10

[ここで、環E-1～E-63において、ジグザグの線は、分子の残部への結合点を表し、
 kは、0、1、2又は3であり、
 nは、0、1又は2であり、
 R¹⁶は、以下に定義する通りである]

から選択される複素環式環からなる群から選択され、

R⁶²は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1又は2個の基R⁸²で置換されているC₁～C₆-アルキル、1個の基R⁸²を有するC₁～C₆-ハロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、C₂～C₆-ハロアルケニル、C₂～C₆-アルキニル、C₂～C₆-ハロアルキニル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、-N(R^{102a})R^{102b}、-C(=O)N(R^{112a})R^{112b}、-CH=NOR⁹²、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環からなる群から選択され、

各R⁸¹は、独立して、OH、CN、CN又はC₁-ハロアルキル置換基を場合によって有するC₃～C₈-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル、-C(=O)N(R^{101c})R^{101d}、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

各R⁸²は、独立して、OH、CN、CN又はC₁-ハロアルキル置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル、-C(=O)N(R^{102c})R^{102d}、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

R⁹¹及びR⁹²は、互いに独立して、水素、C₁～C₆-アルキル及びC₁～C₆-ハロアルキルから選択され、

R^{101a}、R^{102a}、R^{102c}及びR^{112a}は、互いに独立して、水素及びC₁～C₆-アルキルから選択され、

R^{101b}は、水素、-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-42の環から選択される複素環式環から選択され、

R^{102b}は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、CH₂-CN、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-アルキニル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキルメチル、C₃～C₆-ハロシクロアルキルメチル、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶

40

50

で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-42の環から選択される複素環式環から選択され、

R^{101c}は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₂～C₃-アルキニル及びCH₂-CNからなる群から選択され、

R^{101d}は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-アルキニル、CH₂-CN、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキルメチル、C₃～C₆-ハロシクロアルキルメチル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、フェニル(フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-ハロアルケニル、C₂～C₄-アルキニル、C₂～C₄-ハロアルキニル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-ハロアルコキシ、C₁～C₄-アルキルチオ及びC₁～C₄-ハロアルキルチオからなる群から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合によって置換されている)、並びに上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環からなる群から選択され、

R^{102d}及びR^{112b}は、互いに独立して、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、C₂～C₆-ハロアルケニル、C₂～C₆-アルキニル、C₂～C₆-ハロアルキニル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキルメチル及びC₃～C₆-ハロシクロアルキルメチルから選択され、

R^{14a}は、水素及びC₁～C₆-アルキルからなる群から選択され、

R^{14b}は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-アルキニル、CH₂-CN、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキルメチル、C₁～C₄-アルコキシ及びC₁～C₄-ハロアルコキシからなる群から選択され、

各R¹⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-ハロアルケニル、C₂～C₄-アルキニル、C₂～C₄-ハロアルキニル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-ハロアルコキシ、C₁～C₄-アルキルチオ、C₁～C₄-ハロアルキルチオ、C₁～C₄-アルキルスルフィニル、C₁～C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄-アルキルスルホニル、C₁～C₄-ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄-アルキルカルボニル、C₁～C₄-ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、C₁～C₄-アルキルアミノカルボニル及びジ-(C₁～C₄-アルキル)アミノカルボニルからなる群から選択され、又は

飽和環の同じ炭素原子上に存在する2個のR¹⁶は、一緒になって、=O若しくは=Sを形成してもよく、又は

複素環式環の同じS若しくはSO環員上に存在する2個のR¹⁶は、一緒になって、基=N(C₁～C₆-アルキル)、=NO(C₁～C₆-アルキル)、=NN(H)(C₁～C₆-アルキル)若しくは=NN(C₁～C₆-アルキル)₂を形成してもよい}。

【0012】

本発明はまた、本明細書で定義される少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩と、少なくとも1種の不活性な液体及び/又は固体の農業的に許容される担体とを含む農業用組成物を提供する。

【0013】

本発明はまた、本明細書で定義される少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその獣医学的に許容される塩と、少なくとも1種の不活性な液体及び/又は固体の獣医学的に許容される担体とを含む獣医用組成物を提供する。

【0014】

本発明はまた、無脊椎有害生物を防除する方法であって、有害生物、それらの食糧供給(餌供給源)、それらの生息地若しくはそれらの繁殖地、若しくは有害生物が成長中であるか若しくは成長し得る栽培植物、植物繁殖材料(種子等)、土壤、領域、材料若しくは環境、又は有害生物の攻撃若しくは寄生から保護すべき材料、栽培植物、植物繁殖材料(種子

10

20

30

40

50

等)、土壤、表面若しくは空間を、殺有害生物有効量の、本明細書で定義される式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩で処理することを含む、方法を提供する。特定の実施形態では、方法は、ヒト又は動物体を治療するためのものではなく、すなわち、食糧供給、生息地、繁殖地、領域、材料、環境、土壤、表面、又は空間は、ヒト又は動物体ではない。

【0015】

本方法は、特に、無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から植物を保護するのに役立ち、それゆえ、植物を、殺有害生物有効量の、上記で定義した少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩で処理することを含む。本方法は、特に、無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から植物繁殖材料及び/又はそこから生育する植物を保護するのに役立ち、それゆえ、植物繁殖材料を、殺有害生物有効量の、上記で定義した少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩で処理することを含む。

10

【0016】

本発明はまた、本明細書で定義される少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩を含む植物繁殖材料、特に種子に関する。

【0017】

本発明はさらに、寄生生物(無脊椎有害生物)による寄生又は感染から動物を治療又は保護する方法であって、殺寄生生物/殺有害生物有効量の、本明細書で定義される式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその獣医学的に許容される塩と動物とを接触させることを含む、方法に関する。「本発明の化合物I、その塩又は獣医用組成物と動物とを接触させる」とは、それを動物に適用又は投与することを意味する。

20

【0018】

本発明は、さらに、医薬品としての使用のための、とりわけ、動物を寄生生物(無脊椎有害生物)による寄生又は感染から治療又は保護するための医薬品としての使用のための、本明細書で定義される式Iの化合物、その立体異性体及び/又はその獣医学的に許容される塩に関する。

【0019】

「立体異性体」という用語は、エナンチオマー又はジアステレオマー(後者は、分子中に2個以上の不斉中心があることにより存在する)等の光学異性体、及び幾何異性体(シス/トランス異性体)の両方を包含する。

30

【0020】

置換パターンに依存して、式Iの化合物は1つ以上の不斉中心を有することがあり、この場合、この化合物は、エナンチオマー又はジアステレオマーの混合物として存在する。不斉中心の1つは、基R¹を有するイソオキサゾリン又はピロリン環の炭素環原子である。本発明は、純粋なエナンチオマー又はジアステレオマー及びそれらの混合物と、化合物Iの純粋なエナンチオマー若しくはジアステレオマー又はその混合物の本発明による使用の両方を提供する。適切な式Iの化合物には、可能性のあるすべての幾何学的な立体異性体(シス/トランス異性体)及びそれらの混合物も含まれる。

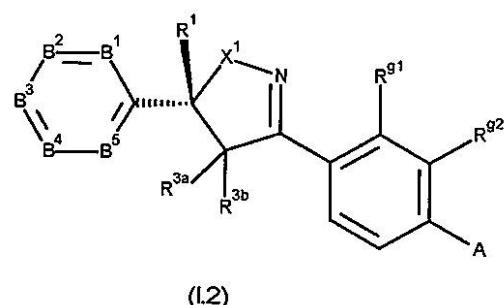
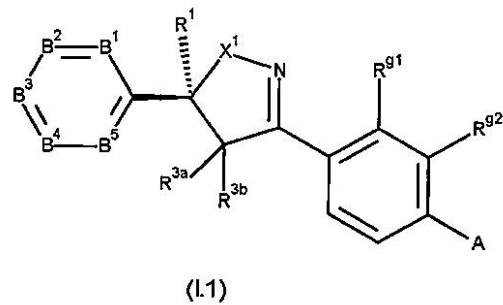
40

【0021】

特定の実施形態において、化合物Iは、化合物I.1及びI.2の混合物の形態において存在する：

【0022】

【化4】



10

【0023】

ここで、化合物I.1は、化合物I.1及びI.2の総重量に基づいて、50重量%を超える量、特に、少なくとも70重量%の量、特には、少なくとも90重量%の量において存在する。

【0024】

N-オキシドという用語は、少なくとも1つの窒素原子が酸化形態(NOとして)で存在する、化合物Iの形態に関する。より正確には、N-オキシドは、N-オキシド部分に酸化されている少なくとも1個の第三級窒素原子を有する本発明の化合物すべてに関する。化合物IのN-オキシドは、特に、適切な酸化剤、例えばペルオキソカルボン酸、又は他の過酸化物で、例えば、イソオキサゾリン/ピロリン部分の環窒素原子及び/又は基A中に存在する任意の窒素含有複素環式基の環窒素原子を酸化することにより調製することができる。当業者は、本発明の化合物がN-オキシドを形成し得るかどうか、及びどの位置で本発明の化合物がN-オキシドを形成し得るかを知っている。

20

【0025】

本発明の化合物は非晶質であってもよく、又は1種以上の異なる結晶状態(多形体)で存在していてもよく、これらは、異なる巨視的特性(安定性等)を有するか、又は異なる生物的特性(活性等)を示すことがある。本発明には、式Iの非晶質化合物及び結晶質化合物の両方、結晶状態が異なるそれぞれの化合物Iの混合物、並びにその非晶質又は結晶質の塩が含まれる。

【0026】

式Iの化合物の塩は、好ましくは農業的及び獣医学的に許容される塩である。それらは慣用的な方法、例えば式Iの化合物が塩基性官能基を有する場合、該化合物と対象とする陰イオン(アニオン)の酸とを反応させることにより、又は酸性の式Iの化合物と適切な塩基とを反応させることによって形成することができる。

30

【0027】

適切な農業的に許容される塩は、とりわけ、これらの陽イオン(カチオン)の塩又はそれらの酸の酸付加塩であり、その陽イオン及び陰イオンは、それぞれ、本発明による化合物の作用に対していくかなる悪影響も及ぼすものではない。適切な陽イオンは特に、アルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウム及びバリウムのイオン、並びに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン、並びにアンモニウム(NH⁴+)及び置換アンモニウム(1個から4個の水素原子がC₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ヒドロキシアルキル、C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル、ヒドロキシ-C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル、フェニル又はベンジルにより置きかえられている)である。置換アンモニウムイオンの例には、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチルアンモニウム、ビス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、及びベンジルトリエチルアンモニウムが含まれ、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C₁～C₄-アルキル)スルホニウム、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C₁～C₄-アルキル)スルホキ

40

50

ソニウムがある。

【0028】

有用な酸付加塩の陰イオンは、主として塩化物イオン、臭化物イオン、フッ化物イオン、硫酸水素イオン、硫酸イオン、リン酸二水素イオン、リン酸水素イオン、リン酸イオン、硝酸イオン、炭酸水素イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオロリン酸イオン、安息香酸イオン、並びにC₁～C₄-アルカン酸の陰イオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオン及び酪酸イオンである。それらは、式Iの化合物と、対応する陰イオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸又は硝酸とを反応させることによって形成することができる。

【0029】

10

「獣医学的に許容される塩」という用語は、獣医学的に使用するための塩の形成に関して当分野で公知であり且つ許容されている陽イオン又は陰イオンの塩を意味する。例えば、塩基性窒素原子(例えばアミノ基)を含有する式Iの化合物によって形成される適切な酸付加塩には、無機酸との塩、例えば、塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩及び硝酸塩、並びに有機酸の塩、例えば、酢酸、マレイン酸、ニマレイン酸、フマル酸、ニフマル酸、メタンスルフェン酸、メタンスルホン酸及びコハク酸の塩が含まれる。

【0030】

20

本明細書で使用する「無脊椎有害生物」という用語は、植物を攻撃し、これにより攻撃を受けた植物に相当な被害をもたらし得る昆虫、クモ形類及び線虫等の動物集団、並びに動物、特に、例えば哺乳動物若しくは鳥類等の温血動物又は爬虫類、両生類若しくは魚類等の他の高等動物に寄生し、これにより寄生された動物に相当な被害をもたらし得る外部寄生生物を包含する。

【0031】

30

「植物繁殖材料」という用語は、植物の繁殖に使用することができる、種子並びに挿し木及び塊茎(例えば、ジャガイモ)等の植物性の植物材料等の植物の繁殖性部分すべてを意味するものと理解されたい。これには、種子、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎、苗条、新芽、並びに土壤からの発芽後又は出芽後に移植されることになる、苗及び幼若植物を含む、植物の他の部分が含まれる。これらの植物繁殖材料は、植栽若しくは移植と同時又はその前のいずれか一方で、植物保護用化合物により予防的に処理することができる。上記幼若植物はまた、浸漬又は注入による全体又は一部の処理によって、移植前に保護することもできる。

【0032】

「植物」という用語は、「非栽培植物」、及び特に「栽培植物」を含む、すべての種類の植物を含む。

【0033】

「非栽培植物」という用語は、あらゆる野生型種、又は栽培植物の関連する種若しくは関連する属を指す。

【0034】

40

「栽培植物」という用語は、育種、突然変異誘発又は遺伝子工学によって変更(修飾)された植物を含むものとして理解されたい(上市されているか又は開発中の農芸化学的な生物工学製品を含むが、これらに限定されない)(http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.aspを参照されたい)。遺伝子組換え植物は、遺伝物質が組換えDNA技術の使用によって修飾されている、自然環境下において交雑育種、突然変異又は自然組換えによって容易に得ることができない植物である。通常、植物のある種の特性を改善するため、1つ以上の遺伝子が、遺伝子組換え植物の遺伝物質に組み込まれている。こうした遺伝的修飾には、以下に限定されないが、例えばグリコシル化による、又はブレニル化、アセチル化若しくはファルネシル化部位若しくはPEG部位等のポリマー付加による、タンパク質(複数可)、オリゴペプチド又はポリペプチドの標的化翻訳後修飾も含まれる。

【0035】

育種、突然変異誘発又は遺伝子工学により修飾された植物は、例えば、育種又は遺伝子

50

工学の従来の方法の結果として、特定のクラスの除草剤、例えばオーキシン除草剤（ジカンバ又は2,4-D等）、白化除草剤（ヒドロキシルフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ（HPPD）阻害剤又はフィトエンデサチュラーゼ（PDS）阻害剤等）、アセト乳酸シンターゼ（ALS）阻害剤（スルホニル尿素系又はイミダゾリノン系等）、エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸シンターゼ（EPSPS）阻害剤（グリホセート等）、グルタミンシンセターゼ（GS）阻害剤（グルホシネート等）、プロトポルフィリノーゲン-IXオキシダーゼ阻害剤、脂質生合成阻害剤（アセチルCoAカルボキシラーゼ（ACCase）阻害剤等）、又はオキシニル（すなわち、プロモキシニル又はイオキシニル）除草剤の施用に対する耐性が付与されている。さらに、植物は、複合的な遺伝子組換えによって、複数のクラスの除草剤に対して抵抗性になっている（例えば、グリホセートとグルホシネートの両方に対する抵抗性、又はグリホセートと別のクラス由来の除草剤（ALS阻害剤、HPPD阻害剤、オーキシン除草剤、又はACCase阻害剤等）の両方に対する抵抗性）。これらの除草剤抵抗性技術は、例えば、Pest Managem. Sci. 61巻、2005年、246頁；61巻、2005年、258頁；61巻、2005年、277頁；61巻、2005年、269頁；61巻、2005年、286頁；64巻、2008年、326頁；64巻、2008年、332頁；Weed Sci. 57巻、2009年、108頁；Austral. J. Agricult. Res. 58巻、2007年、708頁；Science 316巻、2007年、1185頁、及びそれらの中で引用されている参考文献に記載されている。数種の栽培植物が、従来的な育種方法（突然変異誘発）により除草剤に対する耐性が付与されており、例えば、Clearfield（登録商標）夏アブラナ（Canola、BASF SE、ドイツ）は、イミダゾリノン系、例えばイマザモックスに対して耐性を示し、又はExpressSun（登録商標）ヒマワリ（DuPont、米国）は、スルホニル尿素、例えばトリベヌロンに耐性がある。遺伝子工学的方法は、ダイズ、ワタ、トウモロコシ、ビーツ及びナタネ等の栽培植物が、グリホセート及びグルホシネート等の除草剤に耐性となるようにするために使用されており、そのような植物の一部は、RoundupReady（登録商標）（グリホセート耐性、Monsanto、米国）、Cultivance（登録商標）（イミダゾリノン耐性、BASF SE、ドイツ）、及びLibertyLink（登録商標）（グルホシネート耐性、Bayer CropScience、ドイツ）という商標下で市販されている。

[0 0 3 6]

さらに、組換えDNA技術を使用することにより、1種以上の殺虫性タンパク質、詳細にはバチルス (*Bacillus*) 属細菌(特に、バチルス・トウリンギエンシス(*Bacillus thuringiensis*))由来として知られているもの(-エンドトキシン、例えばCry1A(b)、Cry1A(c)、Cry1F、Cry1F(a2)、Cry1IA(b)、Cry1IA、Cry1IB(b1)又はCry9c等)、植物性の殺虫性タンパク質(VIP)(例えばVIP1、VIP2、VIP3又はVIP3A)、線虫にコロニーを形成する細菌の殺虫性タンパク質(例えはフォトラップドウス属(*Photorhabdus* spp.)又はゼノラップドウス属(*Xenorhabdus* spp.)、動物によって產生される毒素(サソリ毒、クモ毒、ハチ毒、又は他の昆虫特異的神経毒等)、菌類によって產生される毒素(ストレプトマイセス(*Streptomycetes*)毒、植物レクチン(エンドウレクチン又はオオムギレクチン等)等)、アグルチニン、プロテイナーゼ阻害剤(トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン又はパパイン阻害剤等)、リボソーム不活化タンパク質(RIP)(リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン、サポリン又はブリオジン等)、ステロイド代謝酵素(3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-IDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤又はHMG-CoA-レダクターゼ等)、イオンチャネル遮断剤(ナトリウムチャネル又はカルシウムチャネル遮断剤等)、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体(ヘリコキニン受容体)、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ又はグルカナーゼを合成することができる植物も含まれる。本発明の明細書において、これらの殺虫性タンパク質又は毒素は、ブレトキシン、ハイブリッドタンパク質、切断されているか又はそうでなければ修飾されているタンパク質としても明確に理解されるべきである。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新しい組合せによって特徴付けられるものである(例えば、国際公開第02/015701号を参照されたい)。こうした毒素、又はこうした毒素を合成することができる遺伝子組換え植物のさらなる例は、例えば、欧州特許出願公開第374753号明細書、国際公開第93/007278号、国際公開第95/34656号、欧州特許出願公開第42752

9号明細書、欧州特許出願公開第451878号明細書、国際公開第03/18810号及び国際公開第03/52073号に開示されている。こうした遺伝子組換え植物を生成する方法は、一般に当業者に公知であり、例えば上記刊行物に記載されている。遺伝子組換え植物に含有されるこれらの殺虫性タンパク質は、これらのタンパク質を产生する植物に、節足動物のすべての分類学的グループに由来する有害な有害生物、とりわけ甲虫(甲虫目(Coeloptera))、双翅目昆虫(双翅目(Diptera))、及び蛾(鱗翅目(Lepidoptera))、並びに線虫(線形動物門(Nematoda))に対する耐性を付与する。1種以上の殺虫性タンパク質を合成することができる遺伝子組換え植物は、例えば上記の刊行物に記載されており、それらの一部は、YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を产生するトウモロコシ品種)、YieldGuard(登録商標)Plus(Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を产生するトウモロコシ品種)、Starlink(登録商標)(Cry9c毒素を产生するトウモロコシ品種)、Herculex(登録商標)RW(Cry34Ab1、Cry35Ab1毒素及び酵素ホスフィノトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ[PAT]を产生するトウモロコシ品種)、NuCOTN(登録商標)33B(Cry1Ac毒素を产生するワタ品種)、Bollgard(登録商標)I(Cry1Ac毒素を产生するワタ品種)、Bollgard(登録商標)II(Cry1Ac及びCry2Ab2毒素を产生するワタ品種)、VIPCOT(登録商標)(VIP毒素を产生するワタ品種)、NewLeaf(登録商標)(Cry3A毒素を产生するジャガイモ品種);Bt-Xtra(登録商標)、NatureGard(登録商標)、KnockOut(登録商標)、BiteGard(登録商標)、Protecta(登録商標)、Syngenta Seeds SAS、フランスからのBt11(例えば、Agrisure(登録商標)CB)及びBt176(Cry1Ab毒素及びPAT酵素を产生するトウモロコシ品種)、Syngenta Seeds SAS、フランスからのMIR604(Cry3A毒素の改変型を产生するトウモロコシ品種、国際公開第03/018810号を参照されたい)、Monsanto Europe S.A.、ベルギーからのMON863(Cry3Bb1毒素を产生するトウモロコシ品種)、Monsanto Europe S.A.、ベルギーからのIPC531(Cry1Ac毒素の改変型を产生するワタ品種)、並びにPioneer Overseas Corporation、ベルギーからの1507(Cry1F毒素及びPAT酵素を产生するトウモロコシ品種)等が市販されている。
10

【0037】

さらに、組換えDNA技術の使用により、細菌、ウイルス若しくは菌病原体に対する植物の抵抗性又は耐性を増大する1種以上のタンパク質を合成することができる植物も含まれる。こうしたタンパク質の例は、いわゆる「病変形成関係性タンパク質」(PRタンパク質、例えば欧州特許出願公開第392225号明細書を参照されたい)、植物病害抵抗性遺伝子(例えば、メキシコの野生ジャガイモであるソラヌム・ブルボカスタヌム(Solanum bulbocastanum)由来のジャガイモ疫病菌(Phytophthora infestans)に対して作用する抵抗性遺伝子を発現するジャガイモ栽培品種)、又はT4-リゾチーム(例えば、火傷病菌(Erwinia amylovora)等の細菌に対して高い抵抗性を有するこれらのタンパク質を合成することができるジャガイモ栽培品種)である。こうした遺伝子組換え植物を生成する方法は、一般に当業者に公知であり、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0038】

さらに、組換えDNA技術を使用することにより、生産性(例えば、バイオマス产生、穀物収穫量、デンブン含量、油含量又はタンパク質含量)を増大し、干ばつ、塩分若しくは他の成長制限環境因子に対する耐性、又は植物の有害生物及び菌、細菌若しくはウイルス病原体に対する耐性を増大する1種以上のタンパク質を合成することができる植物も含まれる。

【0039】

さらに、組換えDNA技術を使用することにより、特にヒト又は動物の栄養を改善するための、含有物質又は新しい含有物質を改変された量で含有する植物、例えば、健康を促進する長鎖オメガ-3脂肪酸又は不飽和オメガ-9脂肪酸を产生する油料作物(例えば、Nexera(登録商標)ナタネ、DOW Agro Sciences、カナダ)も含まれる。

【0040】

さらに、組換えDNA技術を使用することにより、特に原料生産を改善するための、含有物質又は新しい含有物質を改変された量で含有する植物、例えば、多量のアミロペクチンを产生するジャガイモ(例えば、Amflora(登録商標)ジャガイモ、BASF SE、ドイツ)も含ま

10

20

30

40

50

れる。

【0041】

可変要素の上記定義において言及されている有機部分は、「ハロゲン」という用語と同様に、個々の基のメンバーの個別の一覧の総称用語である。接頭語C_n～C_mは、各場合において、その基中の可能な炭素原子数を示す。

【0042】

「ハロゲン」という用語は、各場合において、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素、特にフッ素、塩素又は臭素を意味する。

【0043】

本明細書で使用し、且つアルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルカルボニル等のアルキル部分における「アルキル」という用語は、1～2個(「C₁～C₂-アルキル」)、1～3個(「C₁～C₃-アルキル」)、1～4個(「C₁～C₄-アルキル」)、2～4個(「C₂～C₄-アルキル」)、1～6個(「C₁～C₆-アルキル」)、1～8個(「C₁～C₈-アルキル」)、又は1～10個(「C₁～C₁₀-アルキル」)の炭素原子を有する、直鎖又は分岐の飽和炭化水素基を指す。C₁～C₂-アルキルは、メチル又はエチルである。C₁～C₃-アルキルはさらに、プロピル及びイソプロピルである。C₁～C₄-アルキルはさらに、ブチル、1-メチルプロピル(sec-ブチル)、2-メチルプロピル(イソブチル)、又は1,1-ジメチルエチル(tert-ブチル)である。C₁～C₆-アルキルはさらに、例えば、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、ヘキシル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、又は1-エチル-2-メチルプロピルである。C₁～C₈-アルキルはさらに、例えば、ヘプチル、オクチル、2-エチルヘキシル、及びそれらの位置異性体である。C₁～C₁₀-アルキルはさらに、例えば、ノニル、デシル、及びそれらの位置異性体である。C₂～C₄-アルキルは、エチル、プロピル、イソプロピル、n-ブチル、1-メチルプロピル(sec-ブチル)、2-メチルプロピル(イソブチル)又は1,1-ジメチルエチル(tert-ブチル)である。

【0044】

本明細書で使用する「ハロアルキル」という用語は、「部分的又は完全にハロゲン化されているアルキル」としても表され、1個(「C₁-ハロアルキル」)、「ハロゲン化メチル」又は「ハロメチル」とも称される)、1～2個(「C₁～C₂-ハロアルキル」)、1～3個(「C₁～C₃-ハロアルキル」)、1～4個(「C₁～C₄-ハロアルキル」)、1～6個(「C₁～C₆-ハロアルキル」)、1～8個(「C₁～C₈-ハロアルキル」)、又は1～10個(「C₁～C₁₀-ハロアルキル」)の炭素原子を有する、直鎖又は分岐アルキル基(上記の通り)であって、これらの基における水素原子の一部又はすべてが、上記のハロゲン原子により置きかえられている、アルキル基を指し、クロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル又はペンタフルオロエチル等のC₁～C₂-ハロアルキルである。C₁～C₃-ハロアルキルはさらに、例えば、1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、1,1-ジフルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、1,2-ジフルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、3,3,3-トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,1-トリフルオロプロパ-2-イル、3-クロロプロピル等である。C₁～C₄-ハロアルキルに関する例には、C₁～C₃-ハロアルキルに関するもの他に、4-クロロブチル等がある。

【0045】

「ハロメチル」又は「ハロゲン化メチル」又は「C₁-ハロアルキル」とは、1、2又は3個

10

20

30

40

50

の水素原子がハロゲン原子で置きかえられているメチルである。例には、プロモメチル、クロロメチル、フルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル等がある。

【0046】

1又は2個のフッ素原子により置換されているC₂～C₄-アルキルは、1又は2個の水素原子がフッ素原子で置きかえられているC₂～C₄-アルキルである。例には、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、1,1-ジフルオロエチル、1,2-ジフルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、1-フルオロプロピル、2-フルオロプロピル、3-フルオロプロピル、1,1-ジフルオロプロピル、2,2-ジフルオロプロピル、3,3-ジフルオロプロピル、1,2-ジフルオロプロピル、1,3-ジフルオロプロピル、2,3-ジフルオロプロピル、1-フルオロブチル、2-フルオロブチル、3-フルオロブチル、4-フルオロブチル等がある。

【0047】

本明細書で使用する「アルケニル」という用語は、2～3個(「C₂～C₃-アルケニル」)、2～4個(「C₂～C₄-アルケニル」)、2～6個(「C₂～C₆-アルケニル」)、2～8個(「C₂～C₈-アルケニル」)、又は2～10個(「C₂～C₁₀-アルケニル」)の炭素原子、及び任意の位置に二重結合を有する直鎖又は分岐の一価不飽和炭化水素基、例えばエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル又は1-メチルエテニル等のC₂～C₃-アルケニル、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル又は2-メチル-2-プロペニル等のC₂～C₄-アルケニル、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチルエテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1-3-ジメチル-1-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル、1-エチル-2-メチル-2-プロペニル等のC₂～C₆-アルケニル、又はC₂～C₆-アルケニルに関して言及した基、さらには1-ヘブテニル、2-ヘブテニル、3-ヘブテニル、1-オクテニル、2-オクテニル、3-オクテニル、4-オクテニル、1-ノネニル、2-ノネニル、3-ノネニル、4-ノネニル、1-デセニル、2-デセニル、3-デセニル、4-デセニル、5-デセニル等のC₂～C₁₀-アルケニル並びにそれらの位置異性体を指す。

【0048】

本明細書で使用する「ハロアルケニル」という用語は、「部分的又は完全にハロゲン化されているアルケニル」としても表され、2～3個(「C₂～C₃-ハロアルケニル」)、2～4個(「C₂～C₄-ハロアルケニル」)、2～6個(「C₂～C₆-ハロアルケニル」)、2～8個(「C₂～C₈-ハロアルケニル」)、又は2～10個(「C₂～C₁₀-ハロアルケニル」)の炭素原子、及び任意の

10

20

30

40

50

位置に二重結合を有する直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基(上記の通り)であって、これらの基における水素原子の一部又はすべてが、上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素、及び臭素により置きかえられている基(例えば、クロロビニル、クロロアリル等)を指す。

【0049】

本明細書で使用する「アルキニル」という用語は、2~3個(「C₂~C₃-アルキニル」)、2~4個(「C₂~C₄-アルキニル」)、2~6個(「C₂~C₆-アルキニル」)、2~8個(「C₂~C₈-アルキニル」)、又は2~10個(「C₂~C₁₀-アルキニル」)の炭素原子、及び任意の位置に1つ又は2つの三重結合を有する直鎖又は分岐の炭化水素基、例えばエチニル、1-プロピニル又は2-プロピニル等のC₂~C₃-アルキニル、エチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、3-メチル-1-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-ヘキシニル、2-ヘキシニル、3-ヘキシニル、4-ヘキシニル、5-ヘキシニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-1-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-1-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2-ジメチル-3-ブチニル、3,3-ジメチル-1-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-エチル-1-メチル-2-ブチニル等のC₂~C₆-アルキニルを指す。

【0050】

本明細書で使用する「ハロアルキニル」という用語は、「部分的又は完全にハロゲン化されているアルキニル」としても表され、2~3個(「C₂~C₃-ハロアルキニル」)、2~4個(「C₂~C₄-ハロアルキニル」)、3~4個(「C₃~C₄-ハロアルキニル」)、2~6個(「C₂~C₆-ハロアルキニル」)、2~8個(「C₂~C₈-ハロアルキニル」)、又は2~10個(「C₂~C₁₀-ハロアルキニル」)の炭素原子、及び任意の位置に1つ又は2つの三重結合を有する直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基(上記の通り)であって、これらの基における水素原子の一部又はすべてが、上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素、及び臭素により置きかえられている基を指す。

【0051】

本明細書で使用する「シクロアルキル」という用語は、3~8個(「C₃~C₈-シクロアルキル」)、特に3~6個(「C₃~C₆-シクロアルキル」)、又は3~5個(「C₃~C₅-シクロアルキル」)、又は3~4個(「C₃~C₄-シクロアルキル」)の炭素原子を有する単環式若しくは二環式又は多環式の飽和炭化水素基を指す。3~4個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル及びシクロブチルを含む。3~5個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロブロピル、シクロブチル及びシクロペンチルを含む。3~6個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロブロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルを含む。3~8個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロブロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、及びシクロオクチルを含む。7個又は8個の炭素原子を有する二環式基の例は、ビシクロ[2.2.1]ヘプチル、ビシクロ[3.1.1]ヘプチル、ビシクロ[2.2.2]オクチル、及びビシクロ[3.2.1]オクチルを含む。好ましくは、シクロアルキルという用語は、単環式飽和炭化水素基を意味する。

【0052】

本明細書で使用する「ハロシクロアルキル」という用語は、「部分的又は完全にハロゲン化されているシクロアルキル」としても表され、3~8個(「C₃~C₈-ハロシクロアルキル」)、又は好ましくは3~6個(「C₃~C₆-ハロシクロアルキル」)、又は3~5個(「C₃~C₅-ハロシクロアルキル」)、又は3~4個(「C₃~C₄-ハロシクロアルキル」)の炭素環員を有する単環式若しくは二環式又は多環式の飽和炭化水素基(上記の通り)であって、水素原子の一部又はすべてが、上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素、及び臭素により置きかえられ

ている基を指す。

【0053】

「シクロアルキル-C₁～C₄-アルキル」という用語は、上記で定義したC₁～C₄-アルキル基を介して分子の残部に結合している、上記で定義したC₃～C₈-シクロアルキル基(「C₃～C₈-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキル」)、好ましくはC₃～C₆-シクロアルキル基(「C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキル」)、より好ましくはC₃～C₄-シクロアルキル基(「C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキル」)(好ましくは、単環式シクロアルキル基)を指す。C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキルに関する例はシクロプロピルメチル、シクロブロピルエチル、シクロブロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、及びシクロブチルプロピルである。C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキルに関する例は、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキルに関して言及したものとは別に、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル及びシクロヘキシルプロピルである。C₃～C₈-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキルに関する例は、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₄-アルキルに関して言及したものとは別に、シクロヘプチルメチル、シクロヘプチルエチル、シクロオクチルメチル等である。

【0054】

「C₃～C₆-シクロアルキルメチル」という用語は、メチレン基(CH₂)を介して分子の残部に結合している上記で定義したC₃～C₆-シクロアルキル基を指す。例は、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル及びシクロヘキシルメチルである。

【0055】

「C₃～C₈-ハロシクロアルキル-C₁～C₄-アルキル」という用語は、上記で定義したC₁～C₄-アルキル基を介して分子の残部に結合している、上記で定義したC₃～C₈-ハロシクロアルキル基を指す。

【0056】

「C₃～C₆-ハロシクロアルキル-メチル」という用語は、メチレン基(CH₂)を介して分子の残部に結合している、上記で定義したC₃～C₆-ハロシクロアルキル基を指す。

【0057】

「C₁～C₂-アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-アルキル基である。「C₁～C₃-アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₃-アルキル基である。「C₁～C₄-アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-アルキル基である。「C₁～C₆-アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-アルキル基である。「C₁～C₁₀-アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-アルキル基である。C₁～C₂-アルコキシは、メトキシ又はエトキシである。C₁～C₃-アルコキシはさらに、例えば、n-プロポキシ及び1-メチルエトキシ(イソプロポキシ)である。C₁～C₄-アルコキシはさらに、例えば、ブトキシ、1-メチルブロポキシ(sec-ブトキシ)、2-メチルブロポキシ(イソブトキシ)、又は1,1-ジメチルエトキシ(tert-ブトキシ)である。C₁～C₆-アルコキシはさらに、例えば、ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1,1-ジメチルブロポキシ、1,2-ジメチルブロポキシ、2,2-ジメチルブロポキシ、1-エチルブロポキシ、ヘキソキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1,2-トリメチルブロポキシ、1,2,2-トリメチルブロポキシ、1-エチル-1-メチルブロポキシ、又は1-エチル-2-メチルブロポキシである。C₁～C₈-アルコキシはさらに、例えばヘプチルオキシ、オクチルオキシ、2-エチルヘキシルオキシ、及びそれらの位置異性体である。C₁～C₁₀-アルコキシはさらに、例えばノニルオキシ、デシルオキシ、及びそれらの位置異性体である。

【0058】

10

20

30

40

50

「C₁～C₂-ハロアルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-ハロアルキル基である。「C₁～C₃-ハロアルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₃-ハロアルキル基である。「C₁～C₄-ハロアルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-ハロアルキル基である。「C₁～C₆-ハロアルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-ハロアルキル基である。「C₁～C₁₀-ハロアルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-ハロアルキル基である。C₁～C₂-ハロアルコキシは、例えば、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃、OCH₂Cl、OCHCl₂、OCCl₃、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、又はOC₂F₅である。C₁～C₃-ハロアルコキシはさらに、例えば、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブロモプロポキシ、3-ブロモプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、OCH₂-C₂F₅、OCF₂-C₂F₅、1-(CH₂F)-2-フルオロエトキシ、1-(CH₂Cl)-2-クロロエトキシ、又は1-(CH₂Br)-2-ブロモエトキシである。C₁～C₄-ハロアルコキシはさらに、例えば、4-フルオロブロトキシ、4-クロロブロトキシ、4-ブロモブロトキシ、又はノナフルオロブロトキシである。C₁～C₆-ハロアルコキシはさらに、例えば、5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブロモペントキシ、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブロモヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシ又はドデカフルオロヘキソキシである。

【0059】

「ハロゲン化メトキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、上記で定義したC₁-ハロアルキル基を指す。例には、OCH₂F、OCHF₂、OCF₃、OCH₂Cl、OCHCl₂、OCCl₃、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ又はクロロジフルオロメトキシがある。

【0060】

本明細書で使用する「C₁～C₃-アルコキシ-C₁～C₃-アルキル」という用語は、上記で定義した1～3個の炭素原子を有する直鎖又は分岐のアルキル基であって、水素原子の1個が上記で定義したC₁～C₃-アルコキシ基により置きかえられているアルキル基を指す。本明細書で使用する「C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル」という用語は、上記で定義した1～4個の炭素原子を有する直鎖又は分岐のアルキル基であって、水素原子の1個が上記で定義したC₁～C₄-アルコキシ基により置きかえられているアルキル基を指す。本明細書で使用する「C₁～C₆-アルコキシ-C₁～C₆-アルキル」という用語は、上記で定義した1～6個の炭素原子を有する直鎖又は分岐のアルキル基であって、水素原子の1個が上記で定義したC₁～C₆-アルコキシ基により置きかえられているアルキル基を指す。例は、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、n-ブトキシメチル、sec-ブトキシメチル、イソブトキシメチル、tert-ブトキシメチル、1-メトキシエチル、1-エトキシエチル、1-プロポキシエチル、1-イソプロポキシエチル、1-n-ブトキシエチル、1-sec-ブトキシエチル、1-イソブトキシエチル、1-tert-ブトキシエチル、2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、2-ブロポキシエチル、2-イソブロポキシエチル、2-n-ブトキシエチル、2-sec-ブトキシエチル、2-イソブトキシエチル、2-tert-ブトキシエチル、1-メトキシプロピル、1-エトキシプロピル、1-ブロポキシプロピル、1-イソプロポキシプロピル、1-n-ブトキシプロピル、1-sec-ブトキシプロピル、1-イソブトキシプロピル、1-tert-ブトキシプロピル、2-メトキシプロピル、2-エトキシプロピル、2-ブロポキシプロピル、2-イソブロポキシプロピル、2-n-ブトキシプロピル、2-sec-ブトキシプロピル、2-イソブトキシプロピル、2-tert-ブトキシプロピル、3-メトキシプロピル、3-エトキシプロピル、3-ブロポキシプロピル、3-イソプロポキシプロピル、3-n-ブトキシプロピル、3-sec-ブ

トキシプロピル、3-イソブトキシプロピル、3-tert-ブトキシプロピル等である。

【0061】

本明細書で使用する「C₁～C₄-アルコキシ-メチル」という用語は、水素原子の1個が上記で定義したC₁～C₄-アルコキシ基により置きかえられているメチルを指す。本明細書で使用する「C₁～C₆-アルコキシ-メチル」という用語は、水素原子の1個が上記で定義したC₁～C₆-アルコキシ基により置きかえられているメチルを指す。例は、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、n-ブトキシメチル、sec-ブトキシメチル、イソブトキシメチル、tert-ブトキシメチル、ベンチルオキシメチル、ヘキシルオキシメチル等である。

【0062】

C₁～C₆-ハロアルコキシ-C₁～C₆-アルキルは、1～6個、とりわけ1～4個の炭素原子(=C₁～C₆-ハロアルコキシ-C₁～C₄-アルキル)を有する直鎖又は分岐のアルキル基であって、水素原子の1個がC₁～C₆-アルコキシ基により置きかえられており、且つ少なくとも1個、例えば1、2、3、4個又は残りの水素原子のすべて(アルコキシ部分中又はアルキル部分中のいずれか一方、又はその両方中)がハロゲン原子によって置きかえられているアルキル基である。C₁～C₄-ハロアルコキシ-C₁～C₄-アルキルは、1～4個の炭素原子を有する直鎖又は分岐のアルキル基であって、水素原子の1個がC₁～C₄-アルコキシ基により置きかえられており、且つ少なくとも1個、例えば1、2、3、4個又は残りの水素原子のすべて(アルコキシ部分中又はアルキル部分中のいずれか一方、又はその両方中)がハロゲン原子によって置きかえられているアルキル基である。例は、ジフルオロメトキシメチル(CHF₂OCH₂)、トリフルオロメトキシメチル、1-ジフルオロメトキシエチル、1-トリフルオロメトキシエチル、2-ジフルオロメトキシエチル、2-トリフルオロメトキシエチル、ジフルオロメトキシメチル(CH₃OCF₂)、1,1-ジフルオロ-2-メトキシエチル、2,2-ジフルオロ-2-メトキシエチル等である。

【0063】

「C₁～C₂-アルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-アルキル基である。「C₁～C₃-アルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₃-アルキル基である。「C₁～C₄-アルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-アルキル基である。「C₁～C₆-アルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-アルキル基である。「C₁～C₁₀-アルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-アルキル基である。C₁～C₂-アルキルチオは、メチルチオ又はエチルチオである。C₁～C₃-アルキルチオはさらに、例えば、n-プロピルチオ又は1-メチルエチルチオ(イソプロピルチオ)である。C₁～C₄-アルキルチオはさらに、例えば、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ(sec-ブチルチオ)、2-メチルプロピルチオ(イソブチルチオ)、又は1,1-ジメチルエチルチオ(tert-ブチルチオ)である。C₁～C₆-アルキルチオはさらに、例えば、ベンチルチオ、1-メチルブチルチオ、2-メチルブチルチオ、3-メチルブチルチオ、1,1-ジメチルプロピルチオ、1,2-ジメチルプロピルチオ、2,2-ジメチルプロピルチオ、1-エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1-メチルベンチルチオ、2-メチルベンチルチオ、3-メチルベンチルチオ、4-メチルベンチルチオ、1,1-ジメチルブチルチオ、1,2-ジメチルブチルチオ、1,3-ジメチルブチルチオ、2,2-ジメチルブチルチオ、2,3-ジメチルブチルチオ、3,3-ジメチルブチルチオ、1-エチルブチルチオ、2-エチルブチルチオ、1,1,2-トリメチルプロピルチオ、1,2,2-トリメチルプロピルチオ、1-エチル-1-メチルプロピルチオ、又は1-エチル-2-メチルプロピルチオである。C₁～C₈-アルキルチオはさらに、例えば、ヘプチルチオ、オクチルチオ、2-エチルヘキシルチオ、及びそれらの位置異性体である。C₁～C₁₀-アルキルチオはさらに、例えばノニルチオ、デシルチオ、及びそれらの位置異性体である。

【0064】

「C₁～C₂-ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-ハロアルキル基である。「C₁～C₃-ハロアルキルチオ」という用語は、硫

10

20

30

40

50

黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₃-ハロアルキル基である。「C₁～C₄-ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-ハロアルキル基である。「C₁～C₆-ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-ハロアルキル基である。「C₁～C₁₀-ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-ハロアルキル基である。C₁～C₂-ハロアルキルチオは、例えば、SCH₂F、SCHF₂、SCF₃、SCH₂Cl、SCHCl₂、SCCl₃、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、2-フルオロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、2-ブロモエチルチオ、2-ヨードエチルチオ、2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、2-クロロ-2-フルオロエチルチオ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルチオ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチルチオ、2,2,2-トリクロロエチルチオ、又はSC₂F₅である。C₁～C₃-ハロアルキルチオはさらに、例えば、2-フルオロプロピルチオ、3-フルオロプロピルチオ、2,2-ジフルオロプロピルチオ、2,3-ジフルオロプロピルチオ、2-クロロプロピルチオ、3-クロロプロピルチオ、2,3-ジクロロプロピルチオ、2-ブロモプロピルチオ、3-ブロモプロピルチオ、3,3,3-トリフルオロプロピルチオ、3,3,3-トリクロロプロピルチオ、SCH₂-C₂F₅、SCF₂-C₂F₅、1-(CH₂F)-2-フルオロエチルチオ、1-(CH₂Cl)-2-クロロエチルチオ、又は1-(CH₂Br)-2-ブロモエチルチオである。C₁～C₄-ハロアルキルチオはさらに、例えば、4-フルオロブチルチオ、4-クロロブチルチオ、4-ブロモブチルチオ、又はノナフルオロブチルチオである。C₁～C₆-ハロアルキルチオはさらに、例えば、5-フルオロペンチルチオ、5-クロロペンチルチオ、5-ブロモペンチルチオ、5-ヨードペンチルチオ、ウンデカフルオロペンチルチオ、6-フルオロヘキシルチオ、6-クロロヘキシルチオ、6-ブロモヘキシルチオ、6-ヨードヘキシルチオ又はドデカフルオロヘキシルチオである。

【0065】

「C₁～C₂-アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-アルキル基である。「C₁～C₄-アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-アルキル基である。「C₁～C₆-アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-アルキル基である。「C₁～C₁₀-アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(0)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-アルキル基である。C₁～C₂-アルキルスルフィニルは、メチルスルフィニル又はエチルスルフィニルである。C₁～C₄-アルキルスルフィニルはさらに、例えば、n-プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル(イソプロピルスルフィニル)、ブチルスルフィニル、1-メチルブロピルスルフィニル(sec-ブチルスルフィニル)、2-メチルブロピルスルフィニル(イソブチルスルフィニル)、又は1,1-ジメチルエチルスルフィニル(tert-ブチルスルフィニル)である。C₁～C₆-アルキルスルフィニルはさらに、例えば、ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、1,1-ジメチルブロピルスルフィニル、1,2-ジメチルブロピルスルフィニル、2,2-ジメチルブロピルスルフィニル、1-エチルブロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1,1-ジメチルブチルスルフィニル、1,2-ジメチルブチルスルフィニル、1,3-ジメチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルブチルスルフィニル、2,3-ジメチルブチルスルフィニル、3,3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1,1,2-トリメチルブロピルスルフィニル、1,2,2-トリメチルブロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルブロピルスルフィニル、又は1-エチル-2-メチルブロピルスルフィニルである。C₁～C₈-アルキルスルフィニルはさらに、例えばヘプチルスルフィニル、オクチルスルフィニル、2-エチルヘキシルスルフィニル、及びそれらの位置異性体である。C₁～C₁₀-アルキルスルフィニルはさらに、例えばノニルスルフィニル、デシルスルフィニル、及びそれらの位置異性体である。

【0066】

10

20

30

40

50

「C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-ハロアルキル基である。「C₁～C₄-ハロアルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-ハロアルキル基である。「C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-ハロアルキル基である。「C₁～C₁₀-ハロアルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル[S(O)]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-ハロアルキル基である。C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニルは、例えば、S(O)CH₂F、S(O)CHF₂、S(O)CF₃、S(O)CH₂Cl、S(O)CHCl₂、S(O)CCl₃、クロロフルオロメチルスルフィニル、ジクロロフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、2-クロロエチルスルフィニル、2-ブロモエチルスルフィニル、2-ヨードエチルスルフィニル、2,2-ジフルオロエチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、2-クロロ-2-フルオロエチルスルフィニル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルスルフィニル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチルスルフィニル、2,2,2-トリクロロエチルスルフィニル、又はS(O)C₂F₅である。¹⁰ C₁～C₄-ハロアルキルスルフィニルはさらに、例えば、2-フルオロプロピルスルフィニル、3-フルオロプロピルスルフィニル、2,2-ジフルオロプロピルスルフィニル、2,3-ジフルオロプロピルスルフィニル、2-クロロプロピルスルフィニル、3-クロロプロピルスルフィニル、2,3-ジクロロプロピルスルフィニル、2-ブロモプロピルスルフィニル、3-ブロモプロピルスルフィニル、3,3,3-トリフルオロプロピルスルフィニル、3,3,3-トリクロロプロピルスルフィニル、S(O)CH₂-C₂F₅、S(O)CF₂-C₂F₅、1-(CH₂F)-2-フルオロエチルスルフィニル、1-(CH₂Cl)-2-クロロエチルスルフィニル、1-(CH₂Br)-2-ブロモエチルスルフィニル、4-フルオロブチルスルフィニル、4-クロロブチルスルフィニル、4-ブロモブチルスルフィニル、又はノナフルオロブチルスルフィニルである。²⁰ C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニルはさらに、例えば、5-フルオロペンチルスルフィニル、5-クロロペンチルスルフィニル、5-ブロモペンチルスルフィニル、5-ヨードペンチルスルフィニル、ウンデカフルオロペンチルスルフィニル、6-フルオロヘキシルスルフィニル、6-クロロヘキシルスルフィニル、6-ブロモヘキシルスルフィニル、6-ヨードヘキシルスルフィニル又はドデカフルオロヘキシルスルフィニルである。

【0067】

「C₁～C₂-アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-アルキル基である。「C₁～C₃-アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₃-アルキル基である。「C₁～C₄-アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-アルキル基である。「C₁～C₆-アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-アルキル基である。³⁰ 「C₁～C₁₀-アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-アルキル基である。C₁～C₂-アルキルスルホニルは、メチルスルホニル又はエチルスルホニルである。C₁～C₃-アルキルスルホニルはさらに、例えば、n-プロピルスルホニル又は1-メチルエチルスルホニル(イソプロピルスルホニル)である。C₁～C₄-アルキルスルホニルはさらに、例えば、ブチルスルホニル、1-メチルブロピルスルホニル(sec-ブチルスルホニル)、2-メチルブロピルスルホニル(イソブチルスルホニル)、又は1,1-ジメチルエチルスルホニル(tert-ブチルスルホニル)である。⁴⁰ C₁～C₆-アルキルスルホニルはさらに、例えば、ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、1,1-ジメチルブロピルスルホニル、1,2-ジメチルブロピルスルホニル、2,2-ジメチルブロピルスルホニル、1-エチルブロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1,1-ジメチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルブチルスルホニル、1,2-ジメチルブチルスルホニル、1,3-ジメチルブチルスルホニル、2,3-ジメチルブチルスルホニル、3,3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1,1,2-⁵⁰

トリメチルプロピルスルホニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル、又は1-エチル-2-メチルプロピルスルホニルである。C₁～C₈-アルキルスルホニルはさらに、例えばヘプチルスルホニル、オクチルスルホニル、2-エチルヘキシルスルホニル、及びそれらの位置異性体である。C₁～C₁₀-アルキルスルホニルはさらに、例えばノニルスルホニル、デシルスルホニル、及びそれらの位置異性体である。

【0068】

「C₁～C₂-ハロアルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₂-ハロアルキル基である。「C₁～C₃-ハロアルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₃-ハロアルキル基である。「C₁～C₄-ハロアルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₄-ハロアルキル基である。「C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₆-ハロアルキル基である。「C₁～C₁₀-ハロアルキルスルホニル」という用語は、スルホニル[S(O)₂]基を介して結合している、上記で定義したC₁～C₁₀-ハロアルキル基である。C₁～C₂-ハロアルキルスルホニルは、例えば、S(O)₂CH₂F、S(O)₂CHF₂、S(O)₂CF₃、S(O)₂CH₂Cl、S(O)₂CHCl₂、S(O)₂CCl₃、クロロフルオロメチルスルホニル、ジクロロフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロエチルスルホニル、2-ブロモエチルスルホニル、2-ヨードエチルスルホニル、2,2-ジフルオロエチルスルホニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル、2-クロロ-2-フルオロエチルスルホニル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチルスルホニル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチルスルホニル、2,2,2-トリクロロエチルスルホニル、又はS(O)₂C₂F₅である。C₁～C₃-ハロアルキルスルホニルはさらに、例えば、2-フルオロプロピルスルホニル、3-フルオロプロピルスルホニル、2,2-ジフルオロプロピルスルホニル、2,3-ジフルオロプロピルスルホニル、2-クロロプロピルスルホニル、3-クロロプロピルスルホニル、2,3-ジクロロプロピルスルホニル、2-ブロモプロピルスルホニル、3-ブロモプロピルスルホニル、3,3,3-トリフルオロプロピルスルホニル、3,3,3-トリクロロプロピルスルホニル、S(O)₂CH₂-C₂F₅、S(O)₂CF₂-C₂F₅、1-(CH₂F)-2-フルオロエチルスルホニル、1-(CH₂Cl)-2-クロロエチルスルホニル、又は1-(CH₂Br)-2-ブロモエチルスルホニルである。C₁～C₄-ハロアルキルスルホニルはさらに、例えば、4-フルオロブチルスルホニル、4-クロロブチルスルホニル、4-ブロモブチルスルホニル、又はノナフルオロブチルスルホニルである。C₁～C₆-ハロアルキルスルホニルはさらに、例えば、5-フルオロベンチルスルホニル、5-クロロベンチルスルホニル、5-ブロモベンチルスルホニル、5-ヨードベンチルスルホニル、ウンデカフルオロベンチルスルホニル、6-フルオロヘキシルスルホニル、6-クロロヘキシルスルホニル、6-ブロモヘキシルスルホニル、6-ヨードヘキシルスルホニル、又はドデカフルオロヘキシルスルホニルである。

【0069】

置換基「オキソ」は、CH₂基をC(=O)基により置きかえるものである。

【0070】

「C₁～C₄-アルキルカルボニル」という用語は、カルボニル[C(=O)]基を介して結合している、上記で定義した、C₁～C₄-アルキル基を指す。例は、アセチル(メチルカルボニル)、プロピオニル(エチルカルボニル)、プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル等である。

【0071】

「C₁～C₄-ハロアルキルカルボニル」という用語は、カルボニル[C(=O)]基を介して結合している、上記で定義した、C₁～C₄-ハロアルキル基を指す。例は、トリフルオロメチルカルボニル、2,2,2-トリフルオロエチルカルボニル等である。

【0072】

「アミノカルボニル」という用語は、基-C(=O)-NH₂である。

【0073】

「C₁～C₄-アルキルアミノカルボニル」という用語は、基-C(=O)-N(H)C₁～C₄-アルキル

10

20

30

40

50

である。例は、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル等である。

【0074】

「ジ-(C₁ ~ C₄-アルキル)アミノカルボニル」という用語は、基-C(=O)-N(C₁ ~ C₄-アルキル)₂である。例は、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、エチルメチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジイソプロピルアミノカルボニル、メチルプロピルアミノカルボニル、メチルイソプロピルアミノカルボニル、エチルプロピルアミノカルボニル、エチルイソプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル等である。

【0075】

式Iの化合物の可変要素の、特にそれらの置換基A、A¹、A²、X¹、B¹、B²、B³、B⁴、B⁵、R⁹¹、R⁹²、R¹、R²、R^{3a}、R^{3b}、R⁵¹、R⁵²、R⁶¹、R⁶²、R^{7a}、R^{7b}、R⁸¹、R⁸²、R⁹¹、R⁹²、R^{101a}、R^{101b}、R^{101c}、R^{101d}、R^{102a}、R^{102b}、R^{102c}、R^{102d}、R^{112a}、R^{112b}、R^{14a}、R^{14b}、R¹⁶、k、及びpに関する、好ましい実施形態、本発明による使用及び方法の特徴並びに本発明の組成物の特徴に関する以下の記述は、単独でも、特に相互のあらゆる可能な組合せでも有効である。

【0076】

複素環式環において、R¹⁶は、炭素環原子又は第二級窒素環原子に結合していてよい(したがって、後者の場合、上記のE-x環に示される水素原子を置換している)。R¹⁶が窒素環原子に結合している場合、R¹⁶は、好ましくは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、又はアルコキシ、ハロアルコキシ、アルキルチオ、ハロアルキルチオ、アルキルスルフィニル、ハロアルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、若しくはハロアルキルスルホニルなどの0若しくはSを介して結合している基ではない。

【0077】

本発明の一実施形態において、X¹は0である。本発明の別の実施形態において、X¹はCH₂である。しかしながら、好ましくは、X¹は0である。

【0078】

Wは好ましくは0である。

【0079】

本発明の一実施形態(実施形態1)において、AはA¹であり、ここで、W、R⁵¹及びR⁶¹は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に下記の(Wについては、上記の)好ましい意味のうちの1つを有する。

【0080】

実施形態1の好ましい実施形態(実施形態1a)において、R⁵¹は水素である。

【0081】

実施形態1の別の好ましい実施形態(実施形態1b)において、R⁶¹は、1個の基R⁸¹を有するC₁ ~ C₂-アルキル、1個の基R⁸¹を有するC₁ ~ C₂-ハロアルキル、1又は2個のCN置換基で置換されていてよいC₃ ~ C₆-シクロアルキル、C₃ ~ C₆-ハロシクロアルキル、並びに環E-44及び環E-53から選択される複素環式環からなる群から選択され、ここで、

R⁸¹は、CN又はC₁-ハロアルキル置換基を場合によって有するC₃ ~ C₆-シクロアルキル、C₃ ~ C₆-ハロシクロアルキル、-C(=O)N(R^{101c})R^{101d}、及び上記で定義した環E-1 ~ E-63、特に環E-1 ~ E-9から選択される複素環式環からなる群から選択され、ここで、

R^{101c}は、水素及びC₁ ~ C₄-アルキルからなる群から選択され、

R^{101d}は、水素、C₁ ~ C₆-アルキル及びC₁ ~ C₆-ハロアルキルからなる群から選択される。

【0082】

より詳細には(実施形態1c)、

R⁶¹は、1個の基R⁸¹を有するC₁ ~ C₂-アルキル、C₃ ~ C₆-シクロアルキル並びに環E-44及び環E-53から選択される複素環式環からなる群から選択され、ここで、

10

20

30

40

50

R^{81} は、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $-C(=O)N(R^{101c})R^{101d}$ 、及び環E-1～E-9から選択される複素環式環からなる群から選択され、ここで、

R^{101c} は、水素であり、

R^{101d} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルからなる群から選択される。

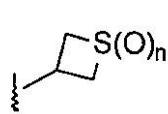
【0083】

実施形態1の別の特定の実施形態(実施形態1d)において、

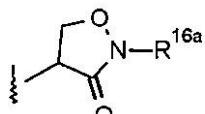
R^{61} は、1個の置換基 R^{81} を有する $C_1 \sim C_4$ -アルキル、環E-44-1及び環E-53-1

【0084】

【化5】



E-44-1



E-53-1

10

[式中、

n は、0、1又は2であり、

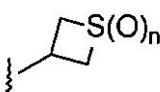
R^{16a} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_2 \sim C_4$ -ハロアルキニル及び $CH_2-(C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル)からなる群から選択され、特に水素及び $C_1 \sim C_4$ -アルキルから選択される]

から選択され、

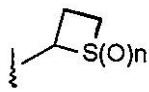
R^{81} は、環E-44-1及び環E-57-1

【0085】

【化6】



E-44-1



E-57-1

20

[式中、

n は、0、1又は2である]

から選択される。

【0086】

実施形態1dのより好ましい実施形態(実施形態1e)において、 R^{61} は、1個の置換基 R^{81} を有するメチル($-CH_2-R^{81}$)、環E-44-1及び環E-53-1から選択され、ここで、 R^{81} 、環E-44-1及び環E-53-1は実施形態1dで定義される通りである。

【0087】

特定の実施形態(実施形態1f)において、 R^{51} は水素であり、 R^{61} は、実施形態1b、1c、1d又は1eで定義される通りである。

30

【0088】

本発明の一実施形態(実施形態2)において、Aは A^2 であり、ここで、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に下記の好ましい意味のうちの1つを有する。

【0089】

実施形態2の好ましい実施形態(実施形態2a)において、 R^{7a} は水素であり、 R^{7b} は、水素、 CH_3 、 CF_3 及び CN から選択される。実施形態2aの特定の実施形態(実施形態2aa)において、 R^{7a} 及び R^{7b} は水素である。

【0090】

実施形態2の別の好ましい実施形態(実施形態2b)において、 R^{52} は、水素及び $C_1 \sim C_3$ -ア

40

50

ルキルから選択され、特に水素である。

【0091】

実施形態2の別の好ましい実施形態(実施形態2c)において、 R^{62} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、1個の基 R^{82} で置換されている $C_1 \sim C_4$ -アルキル、CN置換基を場合によって有する $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環から選択され、ここで、 R^{82} 及び R^{16} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に下記の好ましい意味のうちの1つを有する。

【0092】

R^{82} は、好ましくは、CN、CN又は CF_3 置換基を場合によって有する $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニル、1、2又は3個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択される。

【0093】

実施形態2又は2cのフェニル及び環E-1～E-63における R^{16} は、好ましくは、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ及び $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシから選択される。

【0094】

実施形態2の特定の実施形態(実施形態2d)において、
 R^{7a} は、水素であり、
 R^{7b} は、水素、 CH_3 、 CF_3 及びCNから選択され、
 R^{52} は、水素及び $C_1 \sim C_3$ -アルキルから選択され、
 R^{62} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、1個の基 R^{82} で置換されている $C_1 \sim C_4$ -アルキル、CN置換基を場合によって有する $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環から選択され、ここで、

R^{82} は、CN、CN又は CF_3 置換基を場合によって有する $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニル、1、2又は3個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

フェニル及び環E-1～E-63における R^{16} は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、 $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_4$ -アルコキシ及び $C_1 \sim C_4$ -ハロアルコキシから選択される。

【0095】

実施形態2のより特定の実施形態(実施形態2e)において、
 R^{7a} 及び R^{7b} は、水素であり、
 R^{52} は、水素であり、
 R^{62} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、1個の基 R^{82} で置換されている $C_1 \sim C_4$ -アルキル、CN置換基を場合によって有する $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、及び $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキルから選択され、ここで、

R^{82} は、CN、CN又は CF_3 置換基を場合によって有する $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルから選択され、特に $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルから選択される。

【0096】

実施形態2の具体的な実施形態(実施形態2f)において、

10

20

30

40

50

R^{7a} 及び R^{7b} は、水素であり、

R^{52} は、水素であり、

R^{62} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、1個の基 R^{82} で置換されている $C_1 \sim C_4$ -アルキル、及び $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルから選択され、ここで、

R^{82} は、 C_6 -アルキルスルホニル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルから選択される。

【0097】

好みしくは、 B^2 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は水素でなく、 B^1 、 B^3 、 B^4 及び B^5 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に下記の好みしい意味のうちの1つを有する。より好みしくは、 B^1 及び B^5 は CH であり、 B^2 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は水素でなく、 B^3 及び B^4 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に下記の好みしい意味のうちの1つを有する。

10

【0098】

好みしくは、 R^2 は、水素、 F 、 Cl 、 Br 、 OCF_3 及び CF_3 から選択され、特に水素、 F 及び Cl から選択される。

【0099】

特定の実施形態において(実施形態3a)において、化合物Iでは、 B^2 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は水素でなく、 B^1 、 B^3 、 B^4 及び B^5 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好みしい意味のうちの1つを有し、 A は A^1 であり、 W は O であり、 R^{51} 及び R^{61} は上記の実施形態1a、1b、1c、1d、1e 又は 1f のいずれかで定義される通りである。

20

【0100】

より特定の実施形態(実施形態3b)において、化合物Iでは、 B^1 及び B^5 は CH であり、 B^2 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は水素でなく、 B^3 及び B^4 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好みしい意味のうちの1つを有し、 A は A^1 であり、 W は O であり、 R^{51} 及び R^{61} は上記の実施形態1a、1b、1c、1d、1e 又は 1f のいずれかで定義される通りである。

【0101】

別の特定の実施形態(実施形態3c)において、化合物Iでは、 B^2 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は水素でなく、 B^1 、 B^3 、 B^4 及び B^5 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好みしい意味のうちの1つを有し、 A は A^2 であり、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は上記の実施形態2a、2aa、2b、2c、2d、2e 又は 2f のいずれかで定義される通りである。

30

【0102】

別のより特定の実施形態(実施形態3d)において、化合物Iにおいて、 B^1 及び B^5 は CH であり、 B^2 は CR^2 であり、ここで、 R^2 は水素でなく、 B^3 及び B^4 は CR^2 であり、 R^2 は上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好みしい意味のうちの1つを有し、 A は A^2 であり、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は上記の実施形態2a、2aa、2b、2c、2d、2e 又は 2f のいずれかで定義される通りである。

【0103】

好みしくは(実施形態4)、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2O-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-SCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-SCH_2S-$ 、 $-OCH_2S-$ 、 $-CH_2S(O)-$ 、 $-S(O)CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2S(O)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2S(O)_2-$ 、 $-S(O)_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2S(O)_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2O-$ 及び $-OCH_2CH_2CH_2-$ から選択される架橋基を形成しており、特に $-CH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-SCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-SCH_2S-$ 、 $-OCH_2S-$ 及び $-SCH_2O-$ から選択される架橋基を形成している。より好みしくは(実施形態4a)、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-OCH_2CH_2-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 及び $-SCH_2CH_2-$ から選択される架橋基を形成しており、特に $-CH_2CH_2O-$ (ここで、O は R^{92} の位置において結合している) を形成している。あるいは、より好みしい実施形態(実施形態4b)において、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-CH_2CH_2O-$ 、 $-CH_2OCH_2-$ 、 $-OCH_2O-$ 、 $-CH_2CH_2S-$ 、 $-CH_2SCH_2-$ 、 $-CH_2CH_2S(O)-$ 、 $-CH_2S(O)CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2S(O)_2-$ 、 $-CH_2S(O)_2CH_2-$ 及び $-CH_2CH_2CH_2O-$

40

50

O_2 -から選択される架橋基を形成している。架橋基の右側部分のC、S又はO原子は、 R^{92} の位置において結合しており、左側部分のC、S又はO原子は、 R^{91} の位置において結合している。例えば、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ において、Oは、 R^{92} の位置において結合している。

【0104】

特定の実施形態(実施形態4c)において、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OC}\text{H}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 及び $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ から選択される架橋基を形成しており、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c又は3dのいずれかで定義される通りである。

10

【0105】

より特定の実施形態(実施形態4d)において、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{SCH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{S}-$ 及び $-\text{SCH}_2\text{O}-$ から選択される架橋基を形成しており、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c又は3dのいずれかで定義される通りである。

20

【0106】

より特定の実施形態(実施形態4e)において、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 及び $-\text{SCH}_2\text{CH}_2-$ から選択される架橋基を形成しており、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c又は3dのいずれかで定義される通りである。

【0107】

別により特定の実施形態(実施形態4f)において、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{O}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 、 $-\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}\text{H}_2\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2-$ 及び $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ から選択される架橋基を形成しており、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c又は3dのいずれかで定義される通りである。

30

【0108】

極めて特定の実施形態(実施形態4g)において、 R^{91} 及び R^{92} は、一緒になって、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ (ここで、Oは R^{92} の位置において結合している)を形成しており、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 及び R^{62} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c又は3dのいずれかで定義される通りである。

【0109】

好ましくは、 R^1 は CF_3 である。特に(実施形態5)、 R^1 は CF_3 であり、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 、 R^{62} 、 R^{91} 及び R^{92} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c、3d、4、4a、4b、4c、4d、4e、4f又は4gのいずれかで定義される通りである。

40

【0110】

好ましくは、 R^{3a} 及び R^{3b} は、互いに独立して、水素及びフッ素から選択され、特に水素である。特に(実施形態6)、 R^{3a} 及び R^{3b} は、互いに独立して、水素及びフッ素から選択され、特に水素であり、 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 A^1 、 A^2 、 W 、 R^1 、 R^{51} 、 R^{61} 、 R^{7a} 、 R^{7b} 、 R^{52} 、 R^{62} 、 R^{91} 及び R^{92} は、実施形態1a、1b、1c、1d、1e、1f、2a、2aa、2b、2c、2d、2e、2f、3a、3b、3c、3d、4、4a、4b、4c、4d、4e、4f、4g又は5のいずれかで定義される通りである。

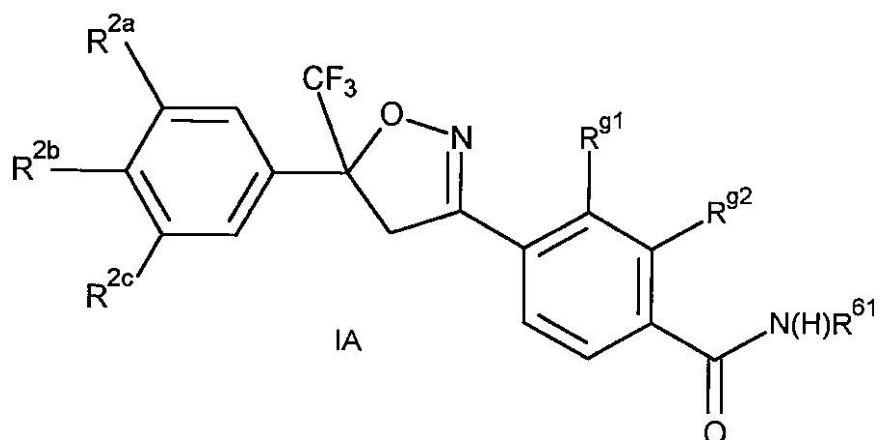
【0111】

特定の実施形態において、式Iの化合物は、式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

50

【 0 1 1 2 】

【化7】



10

{式中、

$R^{g,1}$ 及び $R^{g,2}$ は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、

$R^{6,1}$ は、 $CH_2 - C(O) - N(H) - R^{1,0,1,1,1}$

20

「式中、

R^{101d} は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1又は2個のフッ素原子で置換されている $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 CH_2-CN 、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル及び $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルメチルからなる群から選択される]

である}。

【 0 1 1 3 】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{ 式中、

R^{g_1} 及び R^{g_2} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、

$R^{6,1}$ は、 $-CH_2-R^{8,1}$

[式中、

R^{81} は、上記で定義した環E-5、E-6、E-7、E-19、E-25、E-27、E-44及びE-57から選択され、ここで、環E-5、E-6、E-7、E-19、E-27、E-44及びE-57は、非置換であり(k は0である)、又は1若しくは2個の置換基 R^{16} を有し(k は1又は2である)、環E-25は、1位の窒素原子上に1個の R^{16} 置換基を有し、1又は2個のさらなる置換基 R^{16} を場合によって有し、特に、環E-5、E-6、E-7、E-19、E-25、E-27、E-44-1及びE-57-1から選択され、ここで、環E-5、E-6、E-7、E-19及びE-27は、非置換であり(k は0である)、又は1若しくは2個の置換基 R^{16} を有し(k は1又は2である)、環E-25は、1位の窒素原子上に1個の R^{16} 置換基を有し、1又は2個のさらなる置換基 R^{16} を場合によって有し、

ここで、上記の環において、

各R¹⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-ハロアルキル、C₁～C₂-アルコキシ、C₁～C₂-ハロアルコキシ、C₁～C₂-アルキルチオ、C₁～C₂-ハロアルキルチオ、C₁～C₂-アルキルスルフィニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₂-アルキルスルホニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルホニル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₂～C₃-アルケニル及びC₂～C₃-アルキニルから選択されるが

1

E-25の1位に結合しているR¹⁶は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂-アルコキシ、C₁～

50

～C₂-ハロアルコキシ、C₁～C₂-アルキルチオ、C₁～C₂-ハロアルキルチオ、C₁～C₂-アルキルスルフィニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₂-アルキルスルホニル又はC₁～C₂-ハロアルキルスルホニルではない]である}。

【0114】

さらに別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R⁹¹及びR⁹²は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

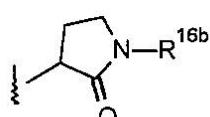
R^{2a}は、CIであり、R^{2b}は、Fであり、R^{2c}は、CIであり、

R⁶¹は、上記で定義した環E-2、E-4、E-6、E-8、E-9、E-44、E-46、E-51及びE-53から選択され、ここで、環E-2、E-4、E-6、E-8、E-9、E-44、E-46及びE-53は、非置換であり(kは0である)、又は1若しくは2個の置換基R¹⁶を有し(kは1又は2である)、ここで、

各R¹⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-ハロアルキル、C₁～C₂-アルコキシ、C₁～C₂-ハロアルコキシ、C₁～C₂-アルキルチオ、C₁～C₂-ハロアルキルチオ、C₁～C₂-アルキルスルフィニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₂-アルキルスルホニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルホニル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₂～C₃-アルケニル及びC₂～C₃-アルキニルから選択され、環E-51は、式E-51-1

【0115】

【化8】



E-51-1

{式中、

R^{16b}は、水素、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-ハロアルキル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₂～C₃-アルケニル及びC₂～C₃-アルキニルからなる群から選択される]の環である}。

【0116】

この実施形態において、環E-44及び環E-53は、好ましくは上記で定義した環E-44-1及び環E-53-1である。

【0117】

さらに別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R⁹¹及びR⁹²は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a}は、CIであり、R^{2b}は、Fであり、R^{2c}は、CIであり、

R⁶¹は、1又は2個のフッ素原子で置換されていてもよいC₂～C₄-アルキル、シクロプロビル、C₃～C₅-ハロシクロアルキル、CH₂-(C₃～C₅-ハロシクロアルキル)、CH₂-(1-シアノ-(C₃～C₅-シクロアルキル))、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-アルキニル、CH₂-CN及び-CH=NR⁹¹(式中、R⁹¹は、C₁～C₃-アルキル及びC₁～C₃-ハロアルキルから選択される)から選択される}。

【0118】

10

20

30

40

50

さらに別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $N(H)R^{101b}$

[式中、

R^{101b} は、 $-C(O)-N(H)R^{14b}$ 、並びに上記で定義した環E-1及び環E-7から選択され、

10

ここで、

R^{14b} は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル及びシクロプロピルから選択され、環E-1及び環E-7において、

kは、0、1又は2であり、

各 R^{16} は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキル、 $C_1 \sim C_2$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_2$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_2$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ -アルキニルから選択される]

である}。

20

【0119】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $CH_2-C(O)-N(H)-R^{101d}$

[式中、

R^{101d} は、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、アリル及びプロパルギルからなる群から選択される]

30

である}。

【0120】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $-CH_2-R^{81}$

40

[式中、

R^{81} は、以下の環E-1、E-7、E-19、E-44、E-47及びE-57から選択され、ここで、環E-1、E-7、E-19、E-44、E-47及びE-57において、kは0である]

である}。

【0121】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

50

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、 R^{61} は、環E-9、E-44、E-46及びE-53から選択され、ここで、環E-9、E-44及びE-46において、kは0であり、特に R^{16a} =H、メチル、エチル又は2,2,2-トリフルオロエチルである環E-9、E-44、E-46及びE-53-1から選択され、ここで、環E-9、E-44及びE-46において、kは0である}。

【0122】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、 R^{61} は、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3,3-ジフルオロシクロブチル、シクロプロピルメチル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、1-シアノシクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、3,3-ジフルオロシクロブチルメチル、アリル、ブロパルギル及び- $CH=NOCH_3$ から選択される}。

【0123】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IAの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $N(H)R^{101b}$

{式中、

R^{101b} は、- $C(O)-N(H)-CH_2CF_3$ 、並びに環E-1及び環E-7から選択され、ここで、環E-1及び環E-7において、kは0である]

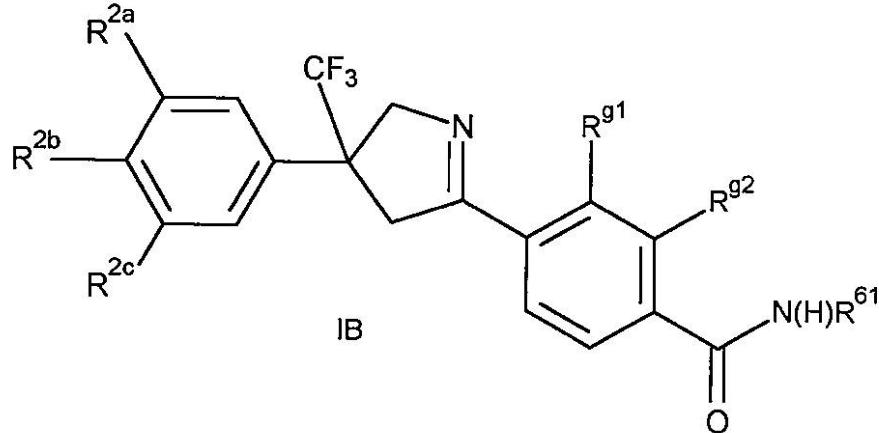
である}。

【0124】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

【0125】

【化9】



{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

10

20

30

40

50

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、
 R^{61} は、 $CH_2-C(O)-N(H)-R^{101d}$

[式中、

R^{101d} は、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、アリル及びプロパルギルからなる群から選択される]
 である}。

【0126】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、
 R^{61} は、 $-CH_2-R^{81}$

[式中、

R^{81} は、以下の環E-1、E-7、E-19、E-44、E-47及びE-57から選択され、ここで、環E-1、E-7、E-19、E-44、E-47及びE-57において、kは0である]
 である}。

【0127】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、
 R^{61} は、環E-9、E-44、E-46及びE-53から選択され、ここで、環E-9、E-44及びE-46において、kは0であり、特に $R^{16a}=H$ 、メチル、エチル又は2,2,2-トリフルオロエチルである環E-9、E-44、E-46及びE-53-1から選択され、ここで、環E-9、E-44及びE-46において、kは0である}。

【0128】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3,3-ジフルオロシクロブチル、シクロプロピルメチル、2,2-ジフルオロシクロプロピルメチル、1-シアノシクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、3,3-ジフルオロシクロブチルメチル、アリル、プロパルギル及び $-CH=NOCH_3$ から選択される}。

【0129】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Fであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $N(H)R^{101b}$

[式中、

10

20

30

40

50

R^{101b} は、 $-C(O)-N(H)-CH_2CF_3$ 、並びに環E-1及び環E-7から選択され、ここで、環E-1及び環E-7において、 k は0である]である}。

【0130】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $CH_2-C(O)-N(H)-R^{101d}$

10

[式中、

R^{101d} は、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、シクロプロピルメチル、アリル及びプロパルギルからなる群から選択される]である}。

【0131】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $-CH_2-R^{81}$

20

[式中、

R^{81} は、以下の環E-1、E-7、E-19、E-44、E-47及びE-57から選択され、ここで、環E-1、E-7、E-19、E-44、E-47及びE-57において、 k は0である]である}。

【0132】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

30

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、環E-9、E-44、E-46及びE-53から選択され、ここで、環E-9、E-44及びE-46において、 k は0であり、特に $R^{16a}=H$ 、メチル、エチル又は2,2,2-トリフルオロエチルである環E-9、E-44、E-46及びE-53-1から選択され、ここで、環E-9、E-44及びE-46において、 k は0である}。

【0133】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

40

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、シクロプロピル、2,2-ジフルオロシクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、シクロブチル、3,3-ジフルオロシクロブチル、シクロブロピルメチル、2,2-ジフルオロシクロブロピルメチル、1-シアノシクロブロピルメチル、シクロブチルメチル、3,3-ジフルオロシクロブチルメチル、アリル、プロパルギル及び $-CH=NOCH_3$ から選択される}。

50

【0134】

別の特定の実施形態において、式Iの化合物は、上記で定義した式IBの化合物、あるいはそのN-オキシド、立体異性体又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩である：

{式中、

R^{91} 及び R^{92} は、上記の全般的な意味のうちの1つ、又は特に上記の好ましい意味のうちの1つを有し、

R^{2a} は、CIであり、 R^{2b} は、Hであり、 R^{2c} は、CIであり、

R^{61} は、 $N(H)R^{101b}$

[式中、

R^{101b} は、 $-C(O)-N(H)-CH_2CF_3$ 、並びに環E-1及び環E-7から選択され、ここで、環E-1及び環E-7において、kは0である]

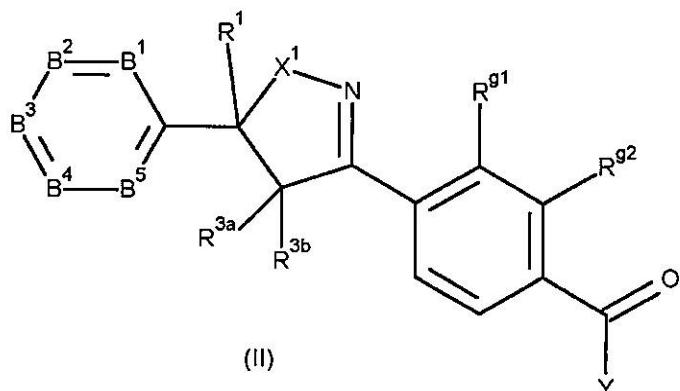
である}。

【0135】

本発明はさらに、式IIの化合物に関する：

【0136】

【化10】



10

20

[式中、

B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 X^1 、 R^1 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{g1} 及び R^{g2} は、上記の全般的又は好ましい意味のうちの1つを有し、

30

Yは、水素及び OR^{17}

(式中、

R^{17} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル及び $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルから選択される)から選択される]。

【0137】

化合物IIもまた、生物活性を有するが、化合物I(式中、Aは A^1 である)の調製における中間体化合物として特に有用である。したがって、本発明はまた、中間体化合物II、及び化合物Iの調製におけるそのような化合物の使用に関する。

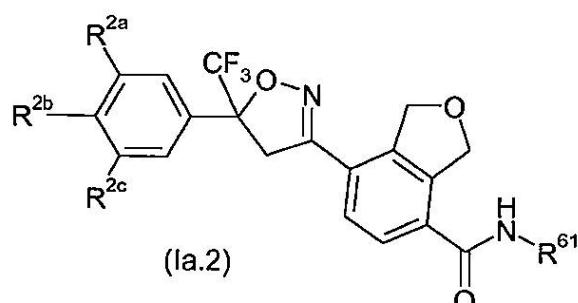
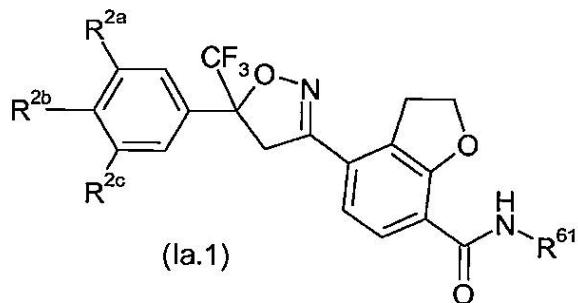
【0138】

好ましい化合物の例は、以下の式Ia.1～Ia40の化合物であり、この場合、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、 R^2 に関して上記で与えられている一般的又は好ましい意味の1つを有し、他の可変要素は、上記で与えられている一般的又は好ましい意味の1つを有する。好ましい化合物の例は、以下の表1～3400にまとめた個々の化合物である。さらに、表中の個々の可変要素に関して以下に言及する意味はそれ自体で、それらについて言及されている組合せから独立して、対象となる置換基の特に好ましい実施形態である。

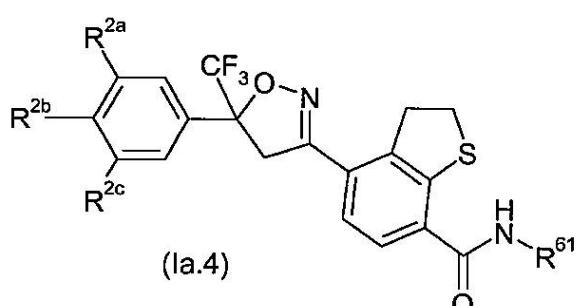
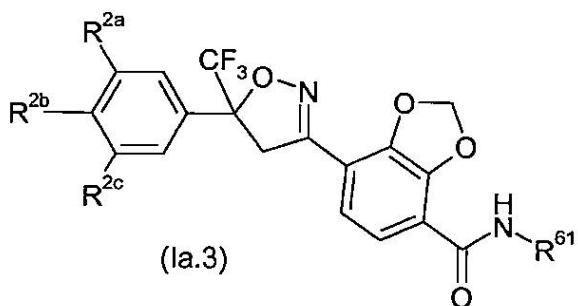
【0139】

40

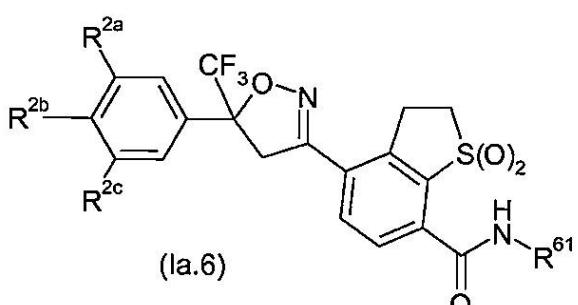
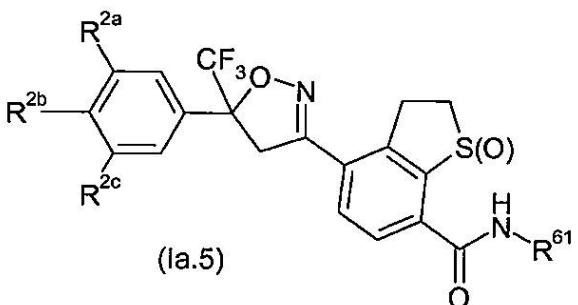
【化 1 1】



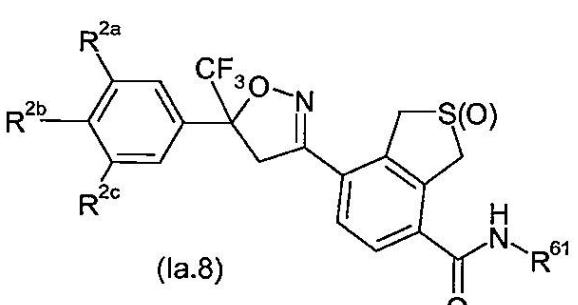
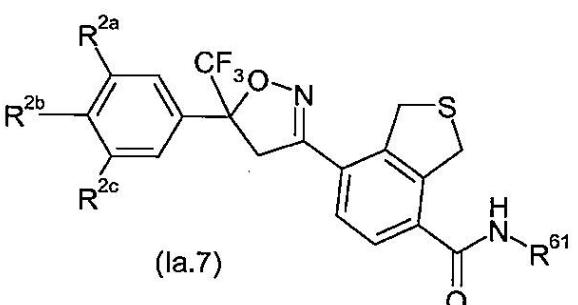
10

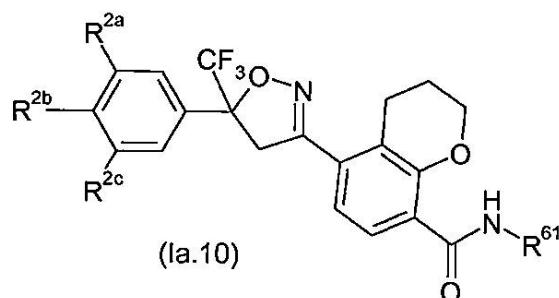
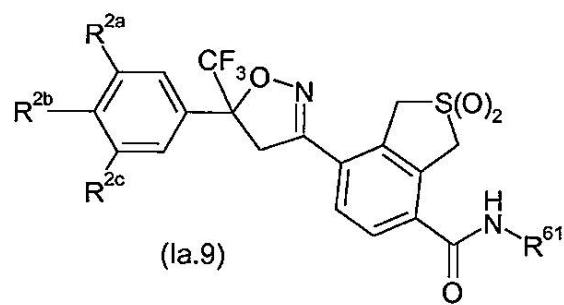


20

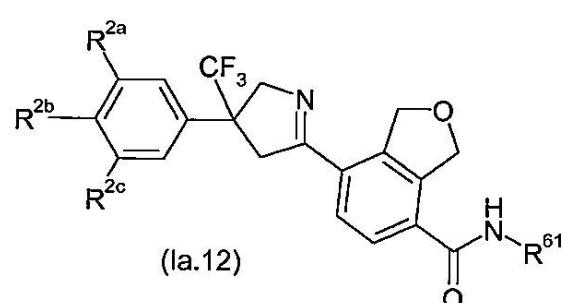
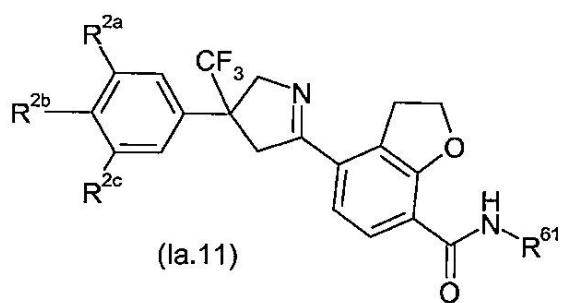


30

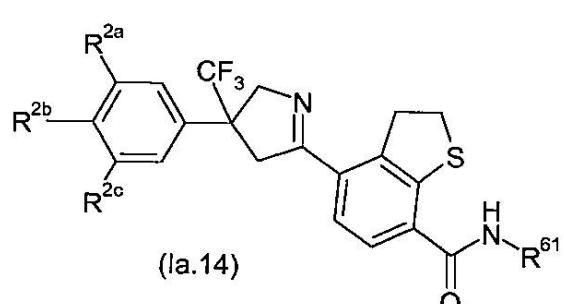
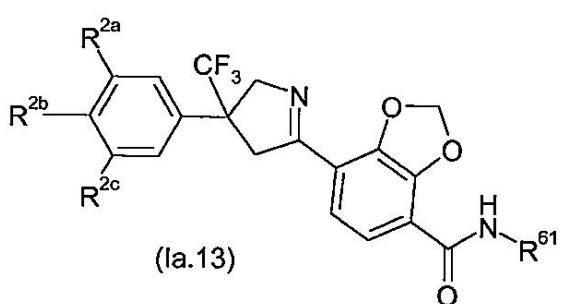




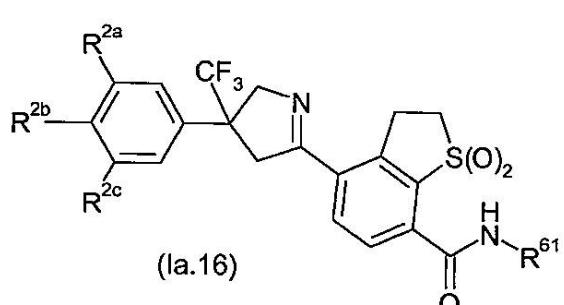
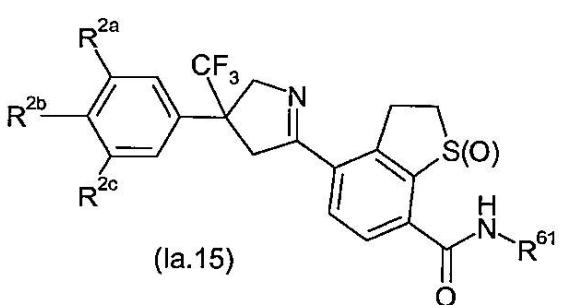
10

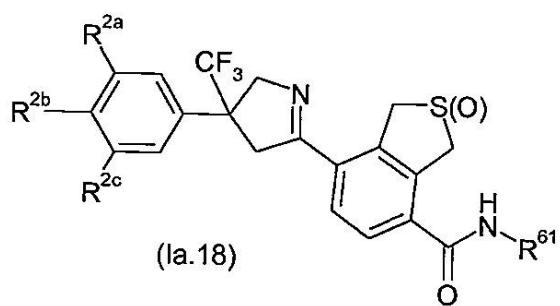
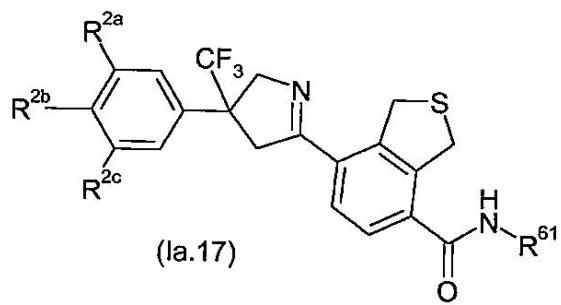


20

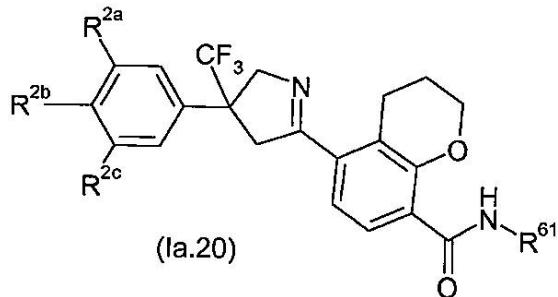
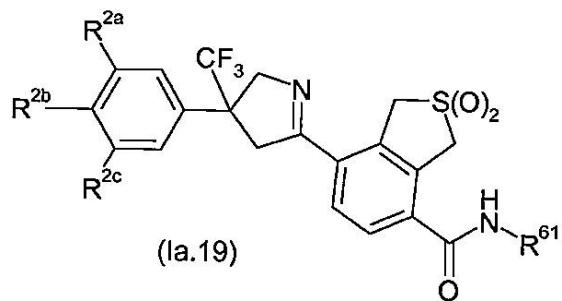


30

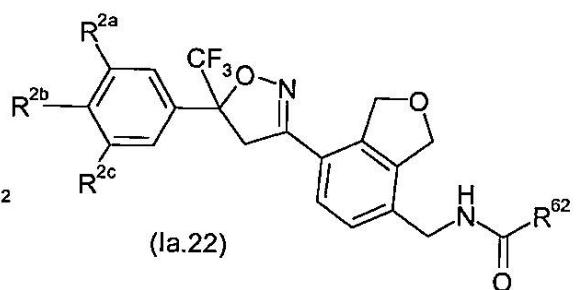
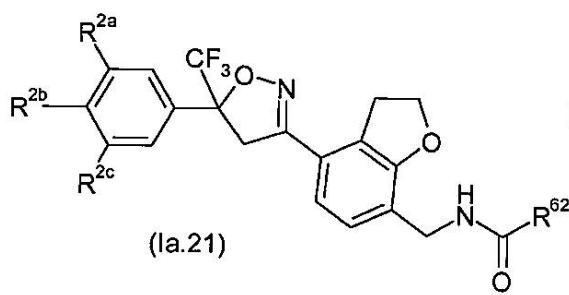




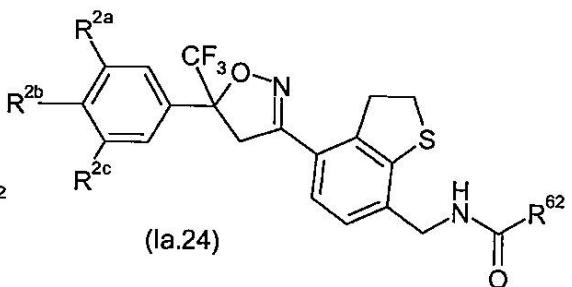
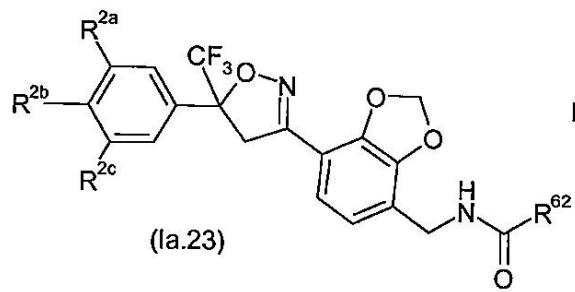
10

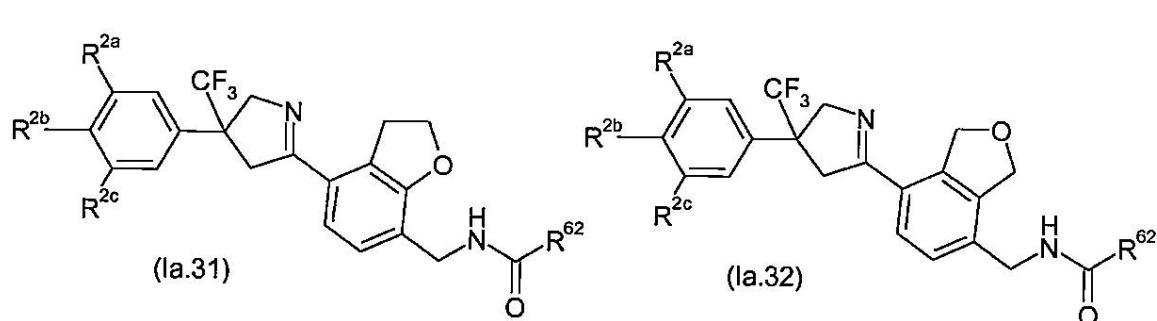
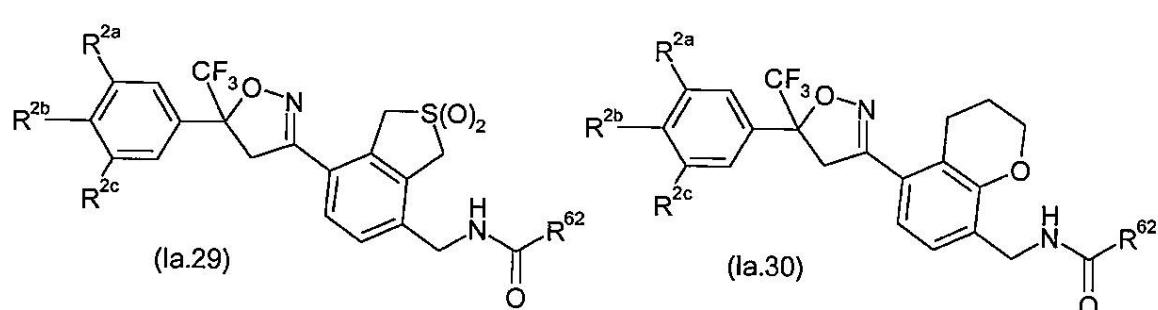
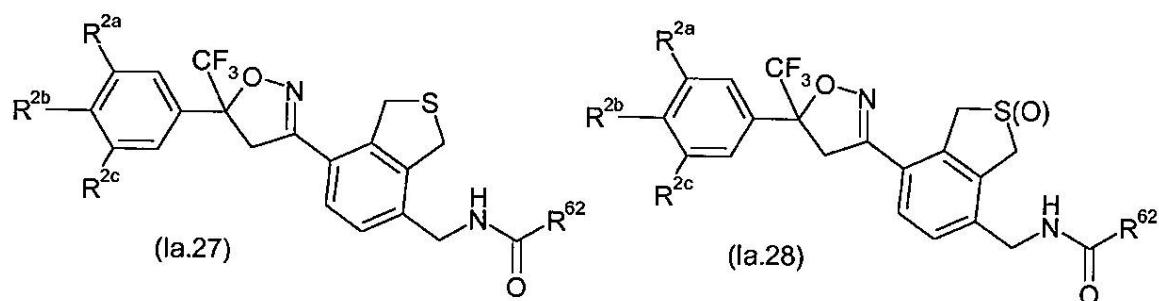
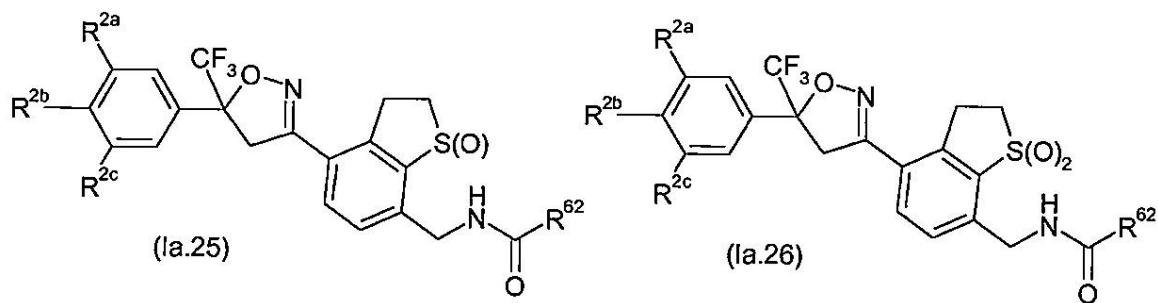


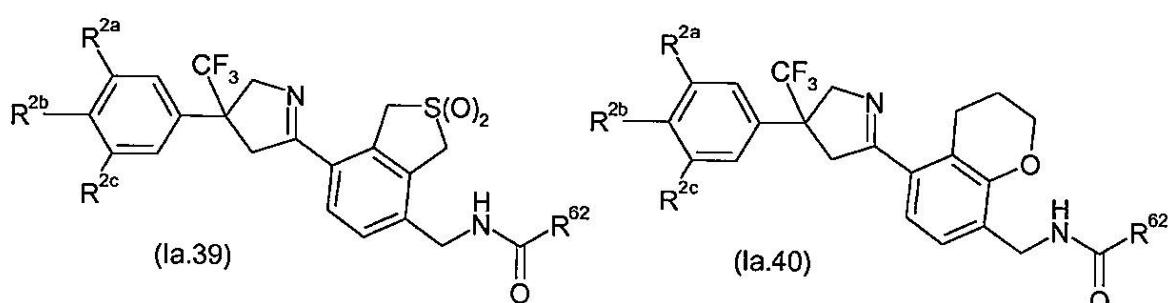
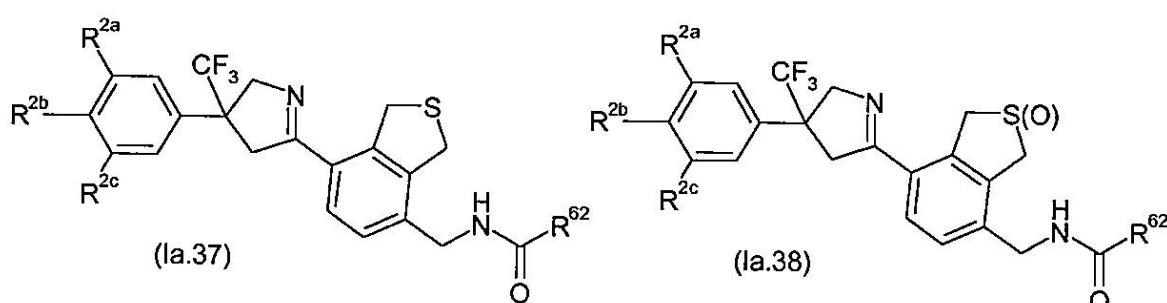
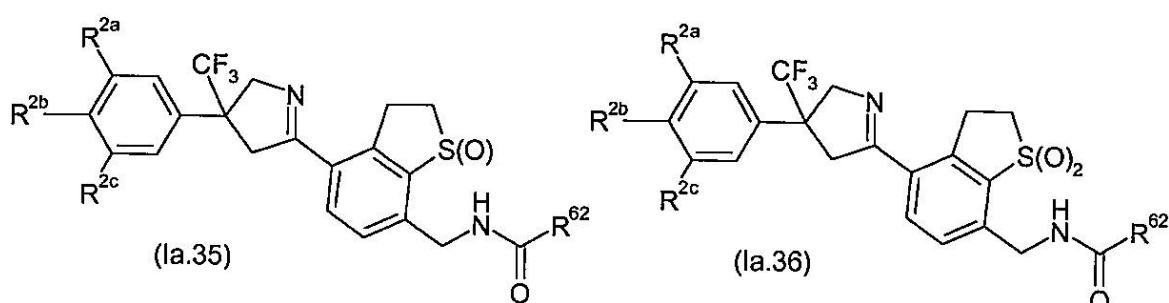
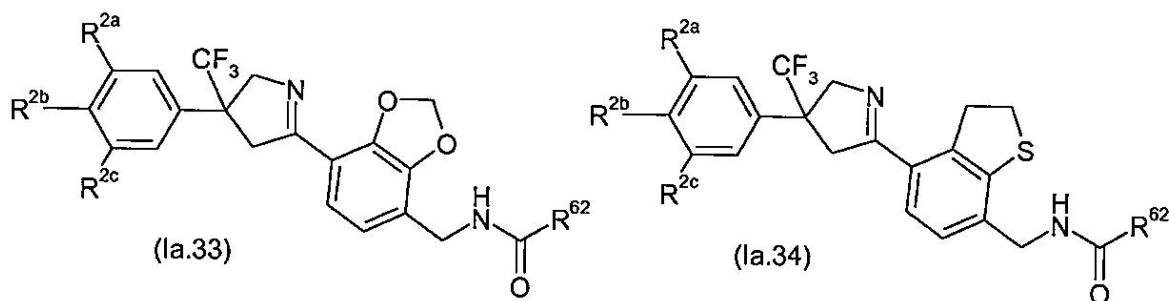
20



30







【 0 1 4 0 】

表1

R^{61} が水素であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表2

R^{61} がメチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表3

R^{61} がエチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表4

R^{61} がn-プロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行

10

20

30

40

50

の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表5

R^{61} がn-ブチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表6

R^{61} がsec-ブチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表7

R^{61} が- CH_2CN であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表8

R^{61} が- $CH_2-CH=CH_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表9

R^{61} が- $CH_2-CH=CH-CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表10

R^{61} が- $CH_2C=CH$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表11

20

R^{61} が- $CH_2CH_2OCH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表12

R^{61} が- $CH_2CH_2OCH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表13

R^{61} が- $CH_2CH_2OCF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表14

R^{61} が- $CH_2CH_2OCH_2CF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

30

表15

R^{61} が- $CH_2CH_2SCH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表16

R^{61} が- $CH_2CH_2S(O)CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表17

R^{61} が- $CH_2CH_2S(O)_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表18

R^{61} が- $CH_2CH_2SCH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表19

R^{61} が- $CH_2CH_2S(O)CH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表20

R^{61} が- $CH_2CH_2S(O)_2CH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表21

50

R^{61} が $-CH_2CH_2SCF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表22

R^{61} が $-CH_2CH_2S(O)CF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表23

R^{61} が CH_2CHF_2 であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表24

R^{61} が CH_2CF_3 であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表25

R^{61} が $CH_2CH_2CF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表26

R^{61} が $CH_2CH_2CHF_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表27

R^{61} がシクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

20

表28

R^{61} が1-シアノ-シクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表29

R^{61} が2-フルオロシクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表30

R^{61} が2,2-ジフルオロシクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表31

30

R^{61} がシクロブチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表32

R^{61} が1-シアノ-シクロブチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表33

R^{61} が3,3-ジフルオロシクロブチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表34

R^{61} がシクロペンチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表35

R^{61} が1-シアノ-シクロペンチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表36

R^{61} がシクロヘキシルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表37

R^{61} が1-シアノ-シクロヘキシルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

50

表38

R^{61} が $-CH_2$ -シクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表39

R^{61} が $-CH_2$ -(1-シアノ-シクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表40

R^{61} が $-CH_2$ -(1-フルオロ-シクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表41

R^{61} が $-CH_2$ -(1-トリフルオロメチル-シクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表42

R^{61} が $-CH_2$ -(1-ジフルオロメチル-シクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表43

R^{61} が $-CH_2$ -(2,2-ジフルオロシクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表44

R^{61} が $-CH_2$ -(2,2-ジクロロシクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表45

R^{61} が $-CH_2$ -(2,2-ジブロモシクロプロピル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表46

R^{61} が $-CH_2$ -シクロブチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表47

R^{61} が $-CH_2$ -(1-シアノ-シクロブチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表48

R^{61} が $-CH_2$ -(1-フルオロ-シクロブチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表49

R^{61} が $-CH_2$ -(2,2-ジフルオロシクロブチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表50

R^{61} が $-CH_2$ -(3,3-ジフルオロシクロブチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表51

R^{61} が $-CH_2$ -(2,2,3,3-テトラフルオロシクロブチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表52

R^{61} が $-CH_2$ -シクロペンチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表53

R^{61} が $-CH_2$ -(1-フルオロ-シクロペンチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表54

R^{61} が $-CH_2$ -(1-シアノ-シクロペンチル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組

10

20

30

40

50

み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表55

R^{61} が $-CH_2-(2,2\text{-ジフルオロシクロペンチル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表56

R^{61} が $-CH_2-(3,3\text{-ジフルオロシクロペンチル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表57

R^{61} が $-CH_2\text{-シクロヘキシル}$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表58

R^{61} が $-CH_2-(1\text{-フルオロシクロヘキシル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表59

R^{61} が $-CH_2-(1\text{-シアノシクロヘキシル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表60

R^{61} がチエタン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表61

20

R^{61} が1-オキソ-チエタン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表62

R^{61} が1,1-ジオキソ-チエタン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表63

R^{61} が $-CH_2\text{-チエタン-3-イル}$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表64

30

R^{61} が $-CH_2-(1\text{-オキソ-チエタン-3-イル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表65

R^{61} が $-CH_2-(1,1\text{-ジオキソ-チエタン-3-イル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表66

R^{61} が $-CH_2\text{-チエタン-2-イル}$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表67

R^{61} が $-CH_2-(1\text{-オキソ-チエタン-2-イル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表68

R^{61} が $-CH_2-(1,1\text{-ジオキソ-チエタン-2-イル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表69

R^{61} がテトラヒドロチオフェン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表70

R^{61} が1-オキソ-テトラヒドロチオフェン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

50

表71

R^{61} が1,1-ジオキソ-テトラヒドロチオフェン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表72

R^{61} がフェニルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表73

R^{61} が2-フルオロフェニルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表74

R^{61} がピリジン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表75

R^{61} がピリジン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表76

R^{61} がピリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表77

R^{61} がピリミジン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

20

表78

R^{61} がピリミジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表79

R^{61} がピリミジン-5-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表80

R^{61} がオキセタン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表81

30

R^{61} がテトラヒドロフラン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表82

R^{61} がテトラヒドロフラン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表83

R^{61} が2-オキソテトラヒドロフラン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表84

R^{61} が1-エチル-2-オキソ-ピロリジン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表85

R^{61} が2-オキソピロリジン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表86

R^{61} が1-メチル-2-オキソピロリジン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表87

R^{61} が2-オキソ-1-(2,2,2-トリフルオロエチル)-ピロリジン-3-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

50

表88

R^{61} が3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表89

R^{61} が2-メチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表90

R^{61} が2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表91

R^{61} が2-プロピル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表92

R^{61} が2-(2-フルオロエチル)-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表93

R^{61} が2-(2,2-ジフルオロエチル)-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表94

R^{61} が2-(2,2,2-トリフルオロエチル)-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

20

表95

R^{61} が-NH-ピリジン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表96

R^{61} が-N(CH₃)-ピリジン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

30

表97

R^{61} が-NH-ピリミジン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表98

R^{61} が-NH-ピリミジン-4-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表99

R^{61} が-N(CH₃)-ピリミジン-2-イルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表100

R^{61} が-CH₂-CONH₂であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表101

R^{61} が-CH₂-CONH-CH₃であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表102

R^{61} が-CH₂-CONH-CH₂CH₃であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表103

R^{61} が-CH₂-CONH-CH₂CH₂CH₃であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

50

表104

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2CH_2F$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表105

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2CHF_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表106

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2CF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表107

R^{61} が $-CH_2-CONH$ -シクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表108

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2CN$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表109

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2CH=CH_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表110

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2C(CH_3)_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表111

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2-$ シクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表112

R^{61} が $-CH_2-CONH-CH_2-(1-シアノ-シクロプロピル)$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表113

R^{61} がベンジルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表114

R^{61} が $-CH_2-($ ピリジン-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表115

R^{61} が $-CH_2-($ ピリジン-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表116

R^{61} が $-CH_2-($ ピリジン-4-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表117

R^{61} が $-CH_2-($ ピリミジン-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表118

R^{61} が $-CH_2-($ ピリミジン-4-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表119

R^{61} が $-CH_2-($ ピリミジン-5-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表120

R^{61} が $-CH_2-($ ピリダジン-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わ

10

20

30

40

50

せが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表121

R^{61} が- CH_2 -(ピリダジン-4-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表122

R^{61} が- CH_2 -(ピラジン-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表123

R^{61} が- CH_2 -(1-メチルピラゾール-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表124

R^{61} が- CH_2 -(チアゾール-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表125

R^{61} が- CH_2 -(チアゾール-4-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表126

R^{61} が- CH_2 -(1,3,4-チアジアゾール-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表127

20

R^{61} が- CH_2 -(1,2,4-チアジアゾール-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表128

R^{61} が- CH_2 -(イソチアゾール-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表129

R^{61} が- CH_2 -(オキサゾール-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表130

R^{61} が- CH_2 -(オキサゾール-4-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

30

表131

R^{61} が- CH_2 -(1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表132

R^{61} が- CH_2 -(1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表133

R^{61} が- CH_2 -(イソオキサゾール-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表134

R^{61} が- CH_2 -(1-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表135

R^{61} が- CH_2 -(4-メチル-1,2,4-トリアゾール-3-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表136

R^{61} が- CH_2 -(テトラヒドロフラン-2-イル)であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表137

50

R^{61} が $-CH_2-$ (テトラヒドロフラン-3-イル) であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表138

R^{61} が $-CH_2-$ (1,3-ジオキソラン-2-イル) であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表139

R^{61} が $-CH_2CH_2-$ (1,3-ジオキソラン-2-イル) であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表140

R^{61} が $-CH_2-$ (1,3-ジオキサン-2-イル) であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

10

表141

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表142

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表143

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2CF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

20

表144

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2CHF_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表145

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2CN$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表146

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2-CH=CH_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表147

30

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2-CH=CH$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表148

R^{61} が $-NHCO-NH-$ シクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表149

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2-$ シクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表150

R^{61} が $-NHCO-NH-CH_2-$ (1-シアノシクロプロピル) であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

40

表151

R^{61} が $-CH=NOCH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表152

R^{61} が $-CH=NOCH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表153

R^{61} が $-CH=NOCH_2CF_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

50

表154

R^{61} が $-CH=NOCH_2CH=CH_2$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表155

R^{61} が $-CH=NOCH_2C\text{---}CH$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.1の化合物

表156～310

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.2の化合物

表311～465

10

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.3の化合物

表466～620

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.4の化合物

表621～775

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.5の化合物

表776～930

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.6の化合物

20

表931～1085

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.7の化合物

表1086～1240

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.8の化合物

表1241～1395

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.9の化合物

30

表1396～1550

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.10の化合物

表1551～1705

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.11の化合物

表1706～1860

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.12の化合物

表1861～2015

40

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.13の化合物

表2016～2170

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.14の化合物

表2171～2325

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.15の化合物

表2326～2480

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わ

50

せが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.16の化合物

表2481～2635

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.17の化合物

表2636～2790

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.18の化合物

表2791～2945

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.19の化合物

表2946～3100

R^{61} が表1～155で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.20の化合物

表3101

R^{62} がメチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3102

R^{62} がエチルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3103

R^{62} がn-プロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3104

R^{62} がシクロプロピルであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3105

R^{62} が- CH_2CF_3 であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3106

R^{62} が- CH_2SCH_3 であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3107

R^{62} が- $CH_2SCH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3108

R^{62} が- $CH_2S(O)CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3109

R^{62} が- $CH_2S(O)CH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3110

R^{62} が- $CH_2S(O)_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3111

R^{62} が- $CH_2S(O)_2CH_2CH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3112

R^{62} が- CH_2OCH_3 であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3113

10

20

30

40

50

R^{62} が $-CH_2CH_2OCH_3$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3114

R^{62} が $-CH_2-(2\text{-テトラヒドロフラニル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3115

R^{62} が $-CH_2-(1,3\text{-ジオキソラン-2-イル})$ であり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.21の化合物

表3116 ~ 3130

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.22の化合物

10

表3131 ~ 3145

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.23の化合物

表3146 ~ 3160

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.24の化合物

表3161 ~ 3175

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.25の化合物

20

表3176 ~ 3190

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.26の化合物

表3191 ~ 3205

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.27の化合物

表3206 ~ 3220

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.28の化合物

表3221 ~ 3235

30

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.29の化合物

表3236 ~ 3250

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.30の化合物

表3251 ~ 3265

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.31の化合物

表3266 ~ 3280

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.32の化合物

40

表3281 ~ 3295

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.33の化合物

表3296 ~ 3310

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.34の化合物

表3311 ~ 3325

R^{62} が表3101 ~ 3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの 1 行の各場合に相当する、式Ia.35の化合物

50

表3326～3340

R^{62} が表3101～3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.36の化合物

表3341～3355

R^{62} が表3101～3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.37の化合物

表3356～3370

R^{62} が表3101～3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.38の化合物

表3371～3385

10

R^{62} が表3101～3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.39の化合物

表3386～3400

R^{62} が表3101～3115で定義される通りであり、化合物についての R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} の組み合わせが表Aの1行の各場合に相当する、式Ia.40の化合物

【0141】

表A

【0142】

【表1】

20

Table A

No.	R^{2a}	R^{2b}	R^{2c}
A-1	F	F	H
A-2	F	H	F
A-3	F	F	F
A-4	F	Cl	F
A-5	F	Br	F
A-6	F	H	Cl
A-7	F	H	Br
A-8	Cl	F	H
A-9	Cl	H	Cl
A-10	Cl	F	H
A-11	Cl	Cl	Cl
A-12	Cl	F	Cl
A-13	Cl	Br	Cl
A-14	Cl	H	Br
A-15	Br	F	H
A-16	Br	H	Br
A-17	Br	F	Br
A-18	Br	Cl	Br
A-19	CF ₃	H	H
A-20	CF ₃	H	F

30

40

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}
A-21	CF ₃	H	Cl
A-22	CF ₃	H	Br
A-23	CF ₃	H	CF ₃
A-24	CF ₃	F	F
A-25	CF ₃	Cl	Cl
A-26	CF ₃	F	H
A-27	OCF ₃	H	F
A-28	OCF ₃	H	Cl
A-29	OCF ₃	F	H
A-30	OCF ₃	H	CF ₃
A-31	OCF ₃	H	H

10

【0143】

上述の化合物のうち、化合物Ia.1、Ia.5及びIa.6、特にIa.1が好ましい。

【0144】

特定の実施形態において、化合物Iは、遊離塩基として、あるいはその農業的若しくは獣医学的に許容される塩、N-オキシド又は立体異性体の形態における、実施例にて特定される化合物から選択される。

20

【0145】

式(I)の化合物は、以下のスキーム若しくは実施例の合成の説明に記載されるような方法により、又は有機化学の標準的方法により調製することができる。置換基、可変要素及び指數は、特に指定しない場合、式(I)について上記で定義した通りである。

【0146】

X¹が0であり及びR^{3b}が水素である式Iの化合物(以下、化合物I.aと称す)は、以下のスキーム1に示される式1の化合物と、ヒドロキシルアミンとを、イミノ化/マイケル(Michael)付加反応において反応させることにより調製することができる。A'は、A又はAの前駆体である。Aの典型的な前駆体は、ハロゲン原子、CN、カルボキシ、C(O)OR^{z1}又は-OSO₂-R^{z1}(R^{z1}は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル又はフェニル(C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-ハロアルコキシから選択される1、2又は3つの基により置換されていてもよい)である。化合物I'は、A'がAであるとき、化合物Iに相当する。化合物I.a'は、A'がAであるとき、化合物I.aに相当する。適切な反応条件は、例えば、国際公開第2012/158396号に記載されている。好適には、ヒドロキシルアミンは、塩酸塩として用いられる。反応は、一般的に、塩基(例えば、NaOH、KOH、Na₂CO₃等)の存在下で行われる。適切な溶媒は、水溶性(例えば、水、又は水と極性溶媒(例えば、テトラヒドロフラン、ジオキサン及び低級アルカノール)との混合物)である。必要な場合(すなわち、A'がAの前駆体である場合)、次いでA'は基Aに転換される。

30

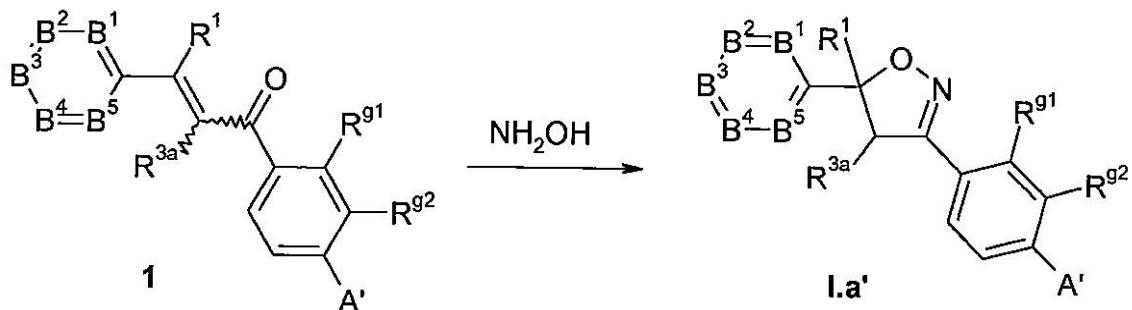
【0147】

スキーム1

【0148】

40

【化12】



10

【0149】

X^1 が CH_2 であり及び R^{3b} が水素である式1の化合物(以下、化合物I.bと称す)は、第一に、式1の化合物に二トロメタンとのマイケル(Michael)付加を受けさせて2とし、次いで2の二トロ基をアミノ基に還元することにより調製することができる。得られるアミノケトンは、自然発生的に以下のスキーム2に示されるように、ピロリンI.b'へと反応する。化合物I.b'は、A'がAであるとき、化合物I.bに相当する。適切な反応条件は、例えば、米国特許出願公開第2010/0298558号明細書に記載されている。1への二トロメタンのマイケル(Michael)付加は、塩基の存在下において行われる。適切な塩基は、例えば、水酸化アルカリ及びアルコレートであるが、好ましくは、非求核性塩基(例えば、DBN又はDBU)が使用される。適切な溶媒は、特に、使用される塩基に左右される。水酸化アルカリが使用される場合、好適には、水性媒体、例えば、水又は低級アルカノールとのその混合物が使用される一方で、アルコキシドはそれぞれのアルコールにおいて使用される。非求核性塩基が使用される場合、極性の非プロトトン性溶媒(例えば、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等)が好ましい。必要な場合(すなわち、A'がAの前駆体である場合)、次いでA'は基Aに転換される。2の還元は、適切な還元剤(例えば、Zn、Sn、Sn(II)塩、Fe又は水素生成剤(hydrogen-producing agent)(例えばZn又はPdの存在下におけるギ酸アンモニウム))で行われる。

20

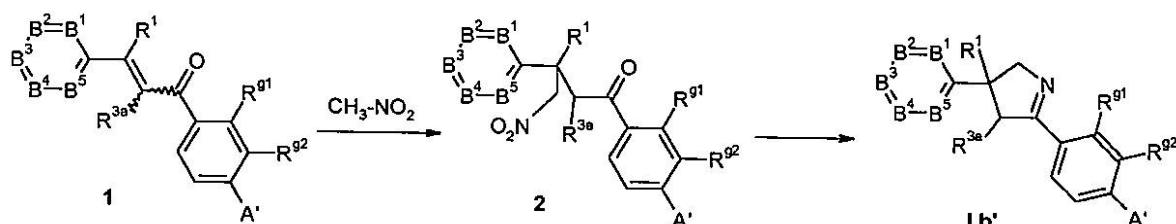
【0150】

スキーム2

【0151】

30

【化13】



【0152】

化合物1は、ケトン3及び4にアルドール縮合を受けさせることにより、欧州特許出願公開第2172462号明細書に記載される方法と同様にして及び以下のスキーム3に示されるように調製することができる。

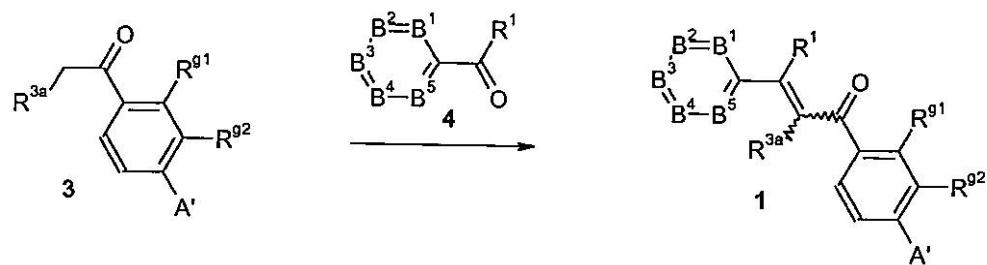
40

【0153】

スキーム3

【0154】

【化14】



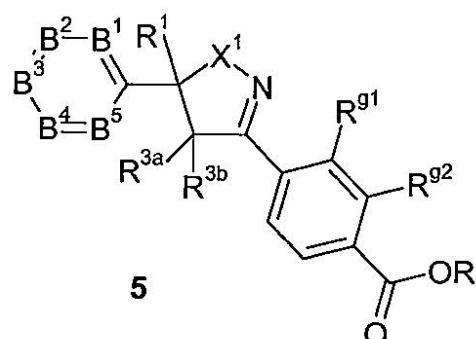
【0155】

10

AがA¹であり、Wが0である化合物Iは、パラジウム触媒及びアルコールROH（式中、Rは、C₁～C₄-アルキルである）の存在下、A'がCl、Br、I又はトリフリートである化合物I'と一酸化炭素とを反応させて式5の化合物にすることにより調製することができる。適切なパラジウム触媒は、例えば国際公開第2011/161130号に記載されているものである。

【0156】

【化15】



20

【0157】

次に、このエステルを各カルボン酸に加水分解して、次いで、これを標準的なアミド化条件下でアミンNHR⁵¹R⁶¹と反応させる。加水分解は、標準条件、例えば塩酸、硫酸若しくはトリフルオロ酢酸を使用する酸性条件下、又は例えばLiOH、NaOH、若しくはKOH等のアルカリ金属水酸化物を使用する塩基性条件下で実施することができる。アミド化は、カルボン酸を塩化オキサリル[(COCl)₂]又は塩化チオニル(SOCl₂)により活性化して個々の酸塩化物にし、次に、アミンNHR⁵¹R⁶¹と反応させることにより好ましくは実施される。あるいは、アミド化は、カップリング剤の存在下で実施される。適切なカップリング剤(活性化剤)は周知であり、例えば、カルボジイミド、例えば、DCC(ジシクロヘキシルカルボジイミド)及びDIC(ジイソプロピルカルボジイミド)、ベンゾトリアゾール誘導体、例えば、HATU(0-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート)、HBTU((0-ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート)及びHCTU(1H-ベンゾトリアゾリウム-1-[ビス(ジメチルアミノ)メチレン]-5-クロロテトラフルオロボレート)、並びにホスホニウム由来の活性化剤、例えば、BOP((ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)-トリス(ジメチル-アミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート)、Py-BOP((ベンゾトリアゾール-1-イルオキシ)-トリピロリジンホスホニウムヘキサフルオロホスフェート)及びPy-BroP(ブロモトリピロリジンホスホニウムヘキサフルオロホスフェート)から選択される。一般に、活性化剤は過剰に使用される。ベンゾトリアゾール及びホスホニウムカップリング剤は、一般に塩基性媒体中で使用される。

30

【0158】

AがA¹であり、WがSである化合物Iは、対応するオキソ化合物(Wは0である)と、Lawesson試薬(CAS 19172-47-5)とを反応させることにより調製することができ、例えば、JesbergerらのSynthesis、2003年、1929～1958頁、及びその参照文献を参照されたい。

40

50

60 ~ 100

等の高温では、HMPA又はTHF等の溶媒を使用することができる。好ましい反応条件は、65においてTHFである。

【0159】

AがA¹である化合物Iはまた、A'がアルデヒド基である化合物I'から調製することができる。このアルデヒド基は、A'がカルボキシリ基である化合物I'に酸化することができる。適切な条件は、例えば、酸化剤として亜塩素酸塩(例えば、亜塩素酸ナトリウムNaClO₂)を用いるピニック(Pinnick)又はリンドグレン(Lindgren)酸化のものである。反応中に形成される次亜塩素酸塩(HOCl)のスカベンジャー(捕捉剤)として、2-メチル-2-ブテン又は過酸化水素を使用することができる。ピニック(Pinnick)又はリンドグレン(Lindgren)酸化は、一般的に、わずかに酸性の緩衝条件(pH約3~5; リン酸水素(例えば、NaH₂PO₄)の使用)下において、水含有溶媒中で行われる。他の適切な酸化条件は、例えば、国際公開第2011/022337号に記載されている。次いで、得られるカルボン酸は、さらに上で記載されるようなアミド化を受け、AがA¹であり、A¹がC(O)NR⁵¹R⁶¹である化合物Iを得ることができる。

【0160】

A'がアルデヒド基である化合物I'は、A'がCl、Br、I又は-OSO₂-R^{z1}(式中、R^{z1}は、上記で定義した通りである)である化合物I'から、遷移金属錯体触媒、好ましくはパラジウム触媒の存在下で、一酸化炭素及びヒドリド源、例えばトリエチルシランとの反応により、順に調製することができる。適切な反応条件は、例えば、国際公開第2011/161130号に記載されている。あるいは、A'がアルデヒド基(CHO)である化合物I'は、A'がC(O)OR^{z1}(R^{z1}=C₁~C₄-アルキル)である化合物I'を、水素化ジイソブチルアルミニウム(DIBAL-H)によって、アルデヒドに直接還元するか、又は対応するアルコールを経て、その後アルデヒドに酸化するかのいずれかにより得ることもできる。

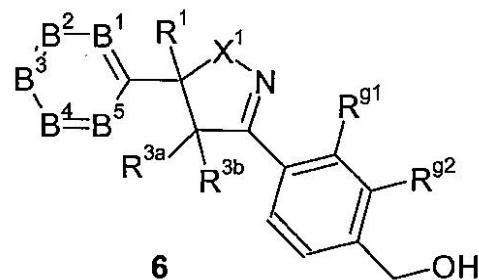
【0161】

R^{3b}が水素でない化合物Iは、国際公開第2010/020521号に記載される方法と同様にして、化合物I.a'又はI.b'から、これらと塩基(例えば、リチウムジイソプロピルアミン)とを反応させ、続いて電子求核試薬[例えば、ハロゲン化剤(例えば4-ヨードトルエンジフルオリド、N-フルオロベンゼンスルホンイミド('NFSI')、N-クロロスクシンイミド('NCS')、N-ブロモスクシンイミド('NBS')又はN-ヨードスクシンイミド('NIS'))]の付加により、調製することができる。

【0162】

Aが基A²であり、R^{7a}及びR^{7b}が水素である化合物Iは、A'が-CHO又は-C(O)OHである化合物I'を、例えばLAH(水素化アルミニウムリチウム)又はDIBAL-H(水素化ジイソブチルアルミニウム)により化合物6まで還元することにより調製することができる。

【化16】



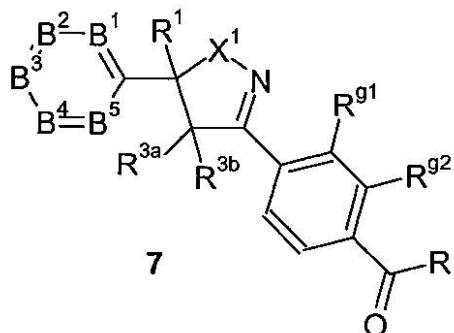
【0163】

次いで、これと、アミドNHR⁵²C(O)R⁶²、又は、より良好には、アミンNH₂R⁵²とを、S_N反応において反応させる。両方の場合において、OH基が、良好な脱離基に、例えばスルホネート(例えば、メシレート、トシレート又はトリフラーート基)に最初に転換され得る。第二の変形例(アミンNH₂R⁵²との反応)では、次いで、得られるベンジルアミンと、酸R⁶²-COOH又はその誘導体、例えばその酸塩化物R⁶²-COClとを、アミド化反応において反応させる。

【0164】

Aが基A²であり、R^{7a}がメチル又はC₁-ハロアルキルであり、R^{7b}が水素である化合物Iは、ケトン7

【化17】

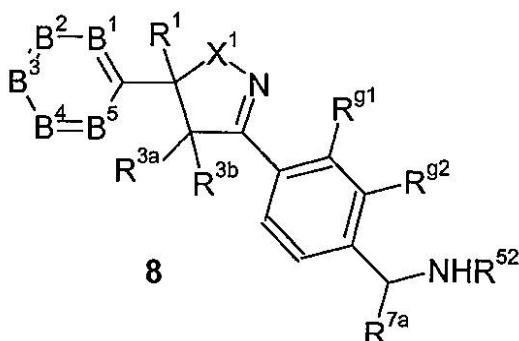


10

(式中、RはR^{7a}に相当し、R^{7a}はメチル又はC₁-ハロアルキルである)

に還元的アミノ化を受けさせて、化合物8を得ることにより調製することができる。還元的アミノ化の典型的な条件は、ケトン7とアミンH₂NR⁵²とを反応させて対応するイミンを得て、これを、還元剤試薬、例えばNa(CN)BH₃によりアミン8に還元する。ケトン7からアミン8への反応はまた、ワンポット法(one pot procedure)として実施することもできる。

【化18】



20

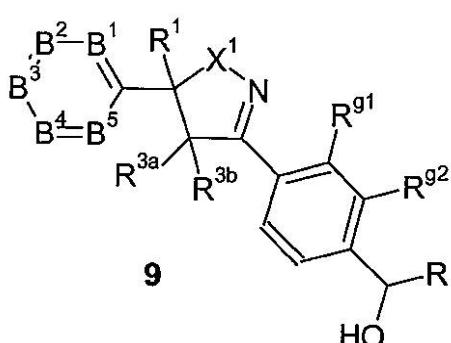
【0165】

次いで、上に記載したように、アミン8と、酸R⁶²-COOH又はその誘導体、例えばその酸塩化物R⁶²-COClとを、アミド化反応において反応させる。

【0166】

ケトン7は、A'がアルデヒド基-CHOである化合物I' と、グリニヤール試薬R-MgHal (式中、Halは、Cl、Br又はIである)又は有機リチウム化合物R-Liとを反応させて、式9のアルコールを得て、次いで、これを、式7のカルボニル化合物に酸化することにより、順に得られる。

【化19】



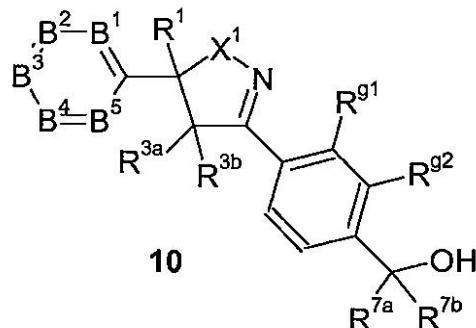
40

【0167】

50

R^{7a} 及び R^{7b} がメチル又は C_1 -ハロアルキルである化合物を得るために、カルボニル化合物、例えば7(式中、Rは R^{7a} に相当し、 R^{7a} はメチル又は C_1 -ハロアルキルである)と、グリニャール試薬 R^{7b} -MgHal(式中、Halは、Cl、Br又はIである)又は有機リチウム化合物 R^{7b} -Li(式中、 R^{7b} は、メチル又は C_1 -ハロアルキルである)とを反応させて、式10のアルコールを得る。

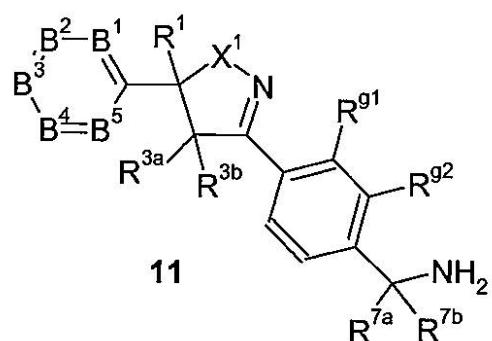
【化20】



【0168】

次いで、アルコール10は、例えばOrganic Letters、2001、3(20)、3145-3148に記載されるように、対応するアジドを経て、アミン11に転換することができる。

【化21】



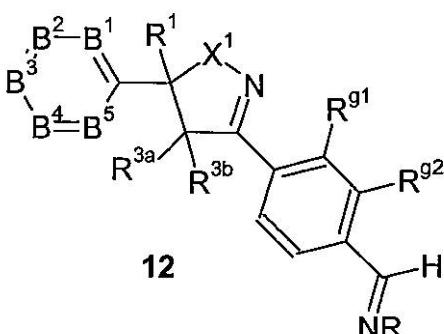
【0169】

これは、例えば標準的なアルキル化反応により、 R^{52} が水素とは異なる化合物Iに転換することができる。基C(O)R⁶²は、上に記載したように、酸R⁶²-COOH又はその誘導体、例えばその酸塩化物R⁶²-COClを用いるアシル化により導入することができる。

【0170】

Aが基A²であり、 R^{7a} がCN、メチル又は C_1 -ハロアルキルであり、 R^{7b} が水素である化合物Iは、アミン誘導体NH₂R(式中、Rはtert-ブチルスルフィニルである)との反応によって、A'がアルデヒド基CHOである化合物I'をイミン12に転換することにより、調製することができる。

【化22】



10

20

30

40

50

【0171】

次いで、このイミンと、化合物X-R^{7a}とを、付加反応において反応させる。適切な試薬は、例えばR^{7a}としてCNを導入するためのSi(CH₃)₃-CN若しくはHCN、又はR^{7a}としてCF₃を導入するためのSi(CH₃)₃-CF₃、又はR^{7a}としてメチル基を導入するためのメチルマグネシウムプロミド(CH₃-MgBr)である。適切な条件は、例えばJ. Am. Chem. Soc. 2009、3850-3851及びそこで引用されている文献、又はChemistry - A European Journal 2009、15、11642-11659に記載されている。次いで、R(tert-ブチルスルフィニル)は、酸性条件下、例えばメタノール中の塩酸下で、除去されて、アミノ基を得ることができる。次いで、基C(0)R⁶²は、上に記載したように、このアミノ基を、酸R⁶²-COOH又はその誘導体、例えばその酸塩化物R⁶²-COClによりアシル化することにより導入することができる。

10

【0172】

通例として、式Iの化合物（それらの立体異性体、塩、及びN-オキシドを含む）及び合成方法におけるそれらの前駆体は、上記の方法で調製することができる。個々の化合物が上記の経路により調製することができない場合、それらは、他の化合物I若しくはそれぞれの前駆体の誘導体化により、又は記載されている合成経路の慣習的な改変により調製することができる。例えば、個々の場合において、ある種の式(I)の化合物は、他の式(I)の化合物から、誘導体化、例えばエステル加水分解、アミド化、エステル化、エーテル開裂、オレフィン化、還元、酸化等により、又は記載されている合成経路の慣習的な改変により有利に調製することができる。

【0173】

20

反応混合物は、慣習的方式で、例えば水と混合し、相を分離し、適当であれば、例えばアルミナ又はシリカゲル上で、クロマトグラフィーにより粗生成物を精製することによって、ワークアップ(後処理)を行う。中間体及び最終生成物の中には、無色又は薄茶色の粘性の油の形態で得られるものがあり、これらは減圧下及び適度な高温で揮発性成分から遊離又は精製される。中間体及び最終生成物が固体として得られる場合、これらは再結晶化又は摩碎により精製することができる。

【0174】

これらの優れた活性により、本発明の化合物は、無脊椎有害生物を防除するために使用することができる。

【0175】

30

したがって、本発明はまた、無脊椎有害生物を防除するための方法であって、有害生物、それらの餌供給源、それらの生息地若しくはそれらの繁殖地、若しくは有害生物が成長中であるか若しくは成長し得る、栽培植物、植物繁殖材料(種子等)、土壤、領域、材料若しくは環境、又は有害生物の攻撃若しくは寄生から保護すべき材料、栽培植物、植物繁殖材料(種子等)、土壤、表面若しくは空間を、殺有害生物有効量の上記で定義したような本発明の化合物又は組成物で処理することを含む方法も提供する。本発明はまた、無脊椎有害生物を駆除するための、本発明の化合物、その立体異性体及び/又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩の使用に関する。

【0176】

40

好ましくは、本発明の方法は、植物繁殖材料(種子等)及びそこから生育する植物を、無脊椎有害生物の攻撃又は寄生から保護する役目を果たし、植物繁殖材料(種子等)を、殺有害生物有効量の上記で定義したような本発明の化合物、又は殺有害生物有効量の上記及び以下で定義するような農業用組成物で処理することを含む。本発明の方法は、本発明に従い処理した「基材」(植物、植物繁殖材料、土壤材料等)の保護に限定されないばかりか、予防的効果も有し、したがって、例えば、植物それ自体が処理されていなくても、処理した植物繁殖材料(種子等)から生育する植物に保護を施す。

【0177】

あるいは、好ましくは、本発明の方法は、植物を、無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から保護する役目を果たし、該方法は、植物を、殺有害生物有効量の少なくとも1種の本発明の化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩で処

50

理することを含む。

【0178】

本発明の意味において、「無脊椎有害生物」とは、好ましくは節足動物及び線虫から、より好ましくは有害な昆虫、クモ形類及び線虫から、さらにより好ましくは昆虫、コナダニ及び線虫から選択される。本発明の意味において、「無脊椎有害生物」は最も好ましくは昆虫である。

【0179】

本発明はさらに、無脊椎有害生物を駆除するための農業用組成物であって、殺有害生物性作用を有するような量の少なくとも1種の本発明による化合物及び少なくとも1種の農業的に許容される不活性な液体及び/又は固形の担体、並びに所望する場合、少なくとも1種の界面活性剤を含む農業用組成物を提供する。

【0180】

このような組成物は、本発明の活性化合物を單一で含むか、又はいくつかの本発明の活性化合物の混合物を含み得る。本発明による組成物は、個々の異性体若しくは異性体の混合物、又は塩、及び個々の互変異性体若しくは互変異性体の混合物を含み得る。

【0181】

本発明の化合物（それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む）は、動物有害生物、例えば、節足動物、腹足類、及び線虫（限定されないが、以下に示すものを含む）を効率的に防除するのに特に適切である：

【0182】

鱗翅目(Lepidoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アクロイア・グリセラ(Achroia grisella)、アクリエリス属の種(Acleris spp.)、例えば、A. フィンブリアーナ(A. fimbriana)、A. グロベラナ(A. gloverana)、A. バリアナ(A. variana)； アクロレピオプシス・アッセクテラ(Acrolepiopsis assectella)、アクロニクタ・メジャー(Acroneicta major)、アドキソファイエス属の種(Adoxophyes spp.)、例えば、A. シルトセマ(A. cyrtosema)、A. オラーナ(A. orana)； アエディア・リューコメラス(Aedia leucomelas)、アグロチス属の種(Agrotis spp.)、例えば、A. エキスクラマチオニス(A. exclamationis)、A. フコサ(A. fucosa)、A. イプシロン(A. epsilon)、A. オルトゴマ(A. orthogoma)、A. セゲツム(A. segetum)、A. スブテラネア(A. subterranea)； アラバマ・アルギラセア(Alabama argillacea)、アレウロジクス・ジスペルスス(Aleurodicus dispersus)、アルソフィラ・ポメタリア(Alsophila pometaria)、アンペロファーガ・ルビギノサ(Ampelophaga rubiginosa)、アミエロイス・トランシテラ(Amyelois transitella)、アナカンプシス・サルシテラ(Anacampsis sarcitella)、アナガスタ・クエニエラ(Anagasta kuehniella)、アナルシア・リネアテラ(Anarsia lineatella)、アニソータ・セナトリア(Anisota senatoria)、アンテラエア・ペルニイ(Antheraea pernyi)、アンチカルシア(=テルメシア)属の種(Anticarsia (=Thermesia) spp.)、例えば、A. ゲンマタリス(A. gemmatalis)； アパメア属の種(Apamea spp.)、アプロアエレマ・モジセラ(Aproaerema modicella)、アルキブス属の種(Archips spp.)、例えば、A. アルギロスピラ(A. argyrospila)、A. フスコクプレアヌス(A. fuscocupreanus)、A. ロサナ(A. rosana)、A. キシロセアヌス(A. xyloseanus)； リンゴヒメシンケイ(Argyresthia conjugella)、アルギロプロス属の種(Argyroploce spp.)、アルギロタエニア属の種(Argyrotaenia spp.)、例えば、A. ベルチナナ(A. velutinana)； アテチス・ミンダラ(Athetis mindara)、アウトロアスカ・ヴィリジグリセア(Austroasca viridigrisea)、ガンマキンウワバ(Autographa gamma)、アウトグラファ・ニグリシグナ(Autographa nigrisigna)、バラスラ・ブラッシカエ(Barathra brassicae)、ベデリア属の種(Bedellia spp.)、ボナゴタ・サルブリコラ(Bonagota salubricola)、ボルボ・キンナラ(Borbo cinnara)、ブキュラトリクス・スルベリエラ(Bucculatrix thurberiella)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、ブッセオラ属の種(Busseola spp.)、カコエシア属の種(Cacoecia spp.)、例えば、C. ムリナナ(C. murinana)、C. ポダナ(C. podana)； カクトプラスチス・カクトルム(Cactoblastis cactorum)、カドラ・カウテラ(Cadra cautella)、カリンゴ・ブラジリエンシス(Calingo brasiliensis)、カロプチリス・ティ

10

20

30

40

50

ボラ(*Caloptilis theivora*)、カプア・レティクラーナ(*Capua reticulana*)、カルポシナ属の種(*Carposina* spp.)、例えば、*C. ニボネンシス*(*C. niponensis*)、*C. ササキイ*(*C. sasaki*)；セフス属の種(*Cephus* spp.)、カエトクネマ・アリヅラ(*Chaetocnema aridula*)、ケイマトビア・ブルマータ(*Cheimatobia brumata*)、キロ属の種(*Chilo* spp.)、例えば、*C. インジクス*(*C. Indicus*)、*C. スップレッサリス*(*C. suppressalis*)、*C. パルテルス*(*C. partellus*)；コロイチス・パリアナ(*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属の種(*Choristoneura* spp.)、例えば、*C. コンフリクトナ*(*C. conflictana*)、*C. フミフェラナ*(*C. fumiferana*)、*C. ロンギセラナ*(*C. longicellana*)、*C. ムリナナ*(*C. murinana*)、*C. オッシデンタリス*(*C. occidentalis*)、*C. ロサセアナ*(*C. rosaceana*)；クリソディキシス(=プソイドブルシア)属の種(*Chrysodeixis* (=*Pseudoplusia*) spp.)、例えば、*C. エリオソマ*(*C. eriosoma*)、*C. インクルデンス*(*C. includens*)；シルフィス・ウニ puncta(*Cirphis unipuncta*)、クリシア・アンビグエラ(*Clytia ambiguella*)、クナファロセルス属の種(*Cnaphalocerus* spp.)、クナファロクロシス・メジナリス(*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア属の種(*Cnephacia* spp.)、コキルイス・ホスペス(*Cochylis hospes*)、コレオホラ属の種(*Coleophora* spp.)、オオアメリカモンキチョウ(*Colias eurytheme*)、コノッポモルファ属の種(*Conopomorpha* spp.)、コノツラチエラス属の種(*Conotrachelus* spp.)、コピタルシア属の種(*Copitarsia* spp.)、コルシラ・セファロニカ(*Corcyra cephalonica*)、クランブス・カリギノセルス(*Crambus caliginosellus*)、クランブス・トテルレルス(*Crambus tetterellus*)、クロシドセマ(=エピノチア)・アポレマ(*Crocidosema* (=*Epinotia*) *aporema*)、シダリマ(=ジアファニア)・ペルスペクタリス(*Cydalima* (=*Diaphania*) *perspectalis*)、シジア(=カルポカプサ)属の種(*Cydia* (=*Carpocapsa*) spp.)、例えば、*C. ポモネラ*(*C. pomonella*)、*C. ラチフェレアナ*(*C. latiferreana*)；ダラカ・ノクツイデス(*Dalaca noctuides*)、ダタナ・インテゲリマ(*Datana integerrima*)、ダシキラ・ピニコラ(*Dasychira pinicola*)、デンドロリムス属の種(*Dendrolimus* spp.)、例えば、*D. ピニ*(*D. pini*)、*D. スペクタビリス*(*D. spectabilis*)、*D. シビリクス*(*D. sibiricus*)；デスマ・フネラリス(*Desmia funeralis*)、ダイアファニア属の種(*Diaphania* spp.)、例えば、*D. ニチダリス*(*D. nitidalis*)、*D. ヒアリナタ*(*D. hyalinata*)；ジアトラエア・グランジオセラ(*Diatraea grandiosella*)、ダイアトラエア・サッカラリス(*Diatraea saccharalis*)、ジフテラ・フェスチバ(*Diphthera festiva*)、エアリアス属の種(*Earias* spp.)、例えば、*E. インスラナ*(*E. insulana*)、*E. ビッテラ*(*E. vittella*)；エクジトロファ・アウランチアヌ(*Ecdytolopha aurantianu*)、エギラ(=キシロミゲス)・クリアリス(*Egira* (=*Xylomyges*) *curialis*)、エラウモバルパス・リクノセーラス(*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ(*Eldana saccharina*)、エンドピザ・ビテアナ(*Endopiza viteana*)、エンノモス・スブシグナリア(*Ennomos subsignaria*)、エオロイマ・ロフチニ(*Eoreuma loftini*)、エフェスチア属の種(*Ephestia* spp.)、例えば、*E. カウテラ*(*E. cautella*)、*E. エルテラ*(*E. elutella*)、*E. クエニエラ*(*E. kuehniella*)；エピノチア・アポレマ(*Epinotia aporema*)、エピフィアス・ポストビッタナ(*Epiphyas postvittana*)、エランニス・チリアリア(*Erannis tiliaria*)、エリオノタ・トラキス(*Erionota thrax*)、エチエラ属の種(*Etiella* spp.)、ユーリア属の種(*Eulia* spp.)、ユーポエシリア・アムギュッラ(*Eupoecilia ambiguella*)、ユーブロクティス・クリソロエア(*Euproctis chrysorrhoea*)、ユークソア属の種(*Euxoa* spp.)、エベトリア・ボウリアナ(*Evetria bouliana*)、ファロンタ・アルビリネア(*Faronta albilinea*)、フェルティア属の種(*Feltia* spp.)、例えば、*F. スブテラネアン*(*F. subterranean*)；ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*)、グラシラリア属の種(*Gracillaria* spp.)、グラホリタ属の種(*Grapholita* spp.)、例えば、*G. フネブラナ*(*G. funebrana*)、*G. モレスタ*(*G. molesta*)、*G. イノピナタ*(*G. inopinata*)；ハリシドタ属の種(*Halysidota* spp.)、ハリシナ・アメリカナ(*Harrisina americana*)、ヘジレプタ属の種(*Hedylepta* spp.)、ヘリコベルバ属の種(*Helicoverpa* spp.)、例えば、*H. アルミゲラ*(*H. armigera*) (=ヘリオティス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*))、*H. ゼア*(*H. zea*) (=ヘリオティス・ゼア(*Heliothis zea*))、ヘリオティス属の種(*Heliothis* spp.)、例えば、*H. アッスルタ*(*H. assulta*)、*H. スブフレキサ*(*H. subflexa*)、*H. ビレセンス*(*H. virescens*)；ヘルラ属の種(*He*

10

20

30

40

50

IIula spp.)、例えば、H. ウンダリス(H. undalis)、H. 口ガタリス(H. rogatalis)；ヘロコベルパ・ゲロトポエオン(Helocoverpa gelotopoeon)、ヘミロイカ・オリビア(Hemileuc a oliviae)、ヘルペトグラムマ・リカルシサリス(Herpetogramma licarsialis)、ヒベルニア・デホリアリア(Hibernia defoliaria)、ホフマノフィラ・シュードスプレテラ(Hofm annophila pseudospretella)、ホモエオソマ・エレクテルム(Homoeosoma electellum)、チャハマキ(Homona magnanima)、ヒペナ・スカブラ(Hypena scabra)、アメリカシロヒトリ(Hyphantria cunea)、ヒポノメウタ・パデラ(Hyponomeuta padella)、ヒポノメウタ・マリネルス(Hyponomeuta malinellus)、カキヴォリア・フラヴォファスシアタ(Kakivoria flavofasciata)、ケイフェリア・リコペルシケラ(Keiferia lycopersicella)、ランブジナ・フィセラリア・フィセラリア(Lambdina fiscellaria fiscellaria)、ランブジナ・フィセラリア・ルグブロサ(Lambdina fiscellaria lugubrosa)、ランブロセマ・インジカタ(Lamprosema indicata)、ラスペイレシア・モレスタ(Laspeyresia molesta)、レグミニボラ・グリシニボレラ(Leguminivora glycinivorella)、レロデア・オイファラ(Lerodea eu fala)、ロイシノデス・オーボナリス(Leucinodes orbonalis)、ロイコマ・サリシス(Leuc oma salicis)、ロイコプテラ属の種(Leucoptera spp.)、例えば、L. コフェエラ(L. coffe ella)、L. シテラ(L. scitella)；ロイミニボラ・リシニボレラ(Leuminivora lycinivorella)、リトコレチス・ブランカルデラ(Lithocletis blanca)、リトファン・アンテナータ(Lithophane antennata)、ラッチア・オクト(Liattia octo)(=アミナ・アキシス(Amyna axis))、ロベシア・ボトラナ(Lobesia botrana)、ロホカンパ属の種(Lophocampa spp.)、ロキサグロチス・アルビコスタ(Loxagrotis albicosta)、ロキソステグ属の種(Lo xostege spp.)、例えば、L. スチクチカリス(L. sticticalis)、L. セレラリス(L. cereral is)；リマントリア属の種(Lymantria spp.)、例えば、L. ジスパル(L. dispar)、L. モナカ(L. monacha)；モモハモグリガ(Lyonetia clerkella)、リオネチア・ブルニホリエラ(Lyonetia prunifoliella)、マラコソマ属の種(Malacosoma spp.)、例えば、M. アメリカヌム(M. americanum)、M. カリホルニクム(M. californicum)、M. コンストリクトム(M. con strictum)、M. ノイストリア(M. neustria)；マメストラ属の種(Mamestra spp.)、例えば、M. ブラッシカ(M. brassicae)、M. コンフィグラタ(M. configurata)；マムストラ・ブラッシカ(Mamstra brassicae)、マンズカ属の種(Manduca spp.)、例えば、M. キンクマク ラタ(M. quinquemaculata)、M. セキスタ(M. sexta)；マラスミア属の種(Marasmia spp.)、マルマラ属の種(Marmara spp.)、マルカ・テスチュラリス(Maruca testulalis)、メガロピグ・ラナタ(Megalopyge lanata)、メランクラ・ピクタ(Melanchra picta)、メラニチス・レダ(Melanitis leda)、モキス属の種(Mocis spp.)、例えば、M. ラピテス(M. lapites)、M. レパンダ(M. repanda)；モシス・ラチペス(Mocis latipes)、モノクロア・フラガリア(Monochroa fragariae)、ミチムナ・セバラータ(Thymimna separata)、ネマポゴン・クロアセラ(Nemapogon cloacella)、ネオロイシノデス・エレガントリス(Neoleucinodes elegantalis)、ネピチア属の種(Neptilia spp.)、ニムフラ属の種(Nymphula spp.)、オイケチクス属の種(Oiketicus spp.)、オミオデス・インジカタ(Omiodes indicata)、オンフィサ・アナストモサリス(Omphisa anastomosalis)、オペロフテラ・ブルマタ(Operophtera brumata)、オルギア・ブソイドツガタ(Orgyia pseudotsugata)、オリア属の種(Oria spp.)、オルタガ・チリサリス(Orthaga thyras)、オストリニア属の種(Ostrinia spp.)、例えば、O. ヌビラリス(O. nubilalis)；オウレマ・オリゼエ(Oulema oryzae)、パレアクリタ・ベルナタ(Paleacrita vernata)、パノリス・フランメア(Panolis flammea)、パルナラ属の種(Parnara spp.)、パパイペマ・ネブリス(Papaipema nebris)、パピリオ・クレスホンテス(Papilio cresphontes)、パラミエロイス・トランシスイテラ(Paramyelois transiella)、パラントレン・レガリス(Paranthrene regalis)、パイサンジシア・アルコン(Paysandisia archon)、ペクチノフォラ属の種(Pectinophora spp.)、例えば、P. ゴッショピエラ(P. gossypiella)；ニセタマナヤガ(Peridroma saucia)、ペリロイコプテラ属の種(Perileucoptera spp.)、例えば、P. コフェエラ(P. coffeella)；ファレラ・ブセファラ(Phalera bucephala)、フリガニジア・カリホルニカ(Phryganidea californica)、フソリマエア属の種(Phthorimaea spp.)、例えば、P. オペルクレラ(P. operculella)；フ

10

20

30

40

50

イロクニスティス・シトレラ(*Phylloconistis citrella*)、フィロノリクテル属の種(*Phylloonycter* spp.)、例えば、P. ブランカルデラ(*P. blancardella*)、P. クラタエゲラ(*P. crataegella*)、P. イッキイ(*P. issikii*)、P. リンゴニエラ(*P. ringoniella*)；ピエリス属の種(*Pieris* spp.)、例えば、P. ブラッシカ(*P. brassicae*)、P. ラバ(*P. rapae*)、P. ナビ(*P. napi*)；ピロクロシス・トリプンクタタ(*Pilocrocis tripunctata*)、プラチペナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、プラチノタ属の種(*Platynota* spp.)、例えば、P. フラベダナ(*P. flavedana*)、P. イダオイサリス(*P. idaeusalis*)、P. スツルタナ(*P. stultana*)；

10 ブラチブチリア・カルズイダクチルア(*Platyptilia carduidactyla*)、ブレベジス・アルグス(*Plebejus argus*)、プロジア・インテルブンクテラ(*Plodia interpunctella*)、ブルシア属の種(*Plusia* spp.)、ブルテッラ・マクリペンニス(*Plutella maculipennis*)、ブルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*)、ポンチア・プロトジカ(*Pontia protodica*)、プライス属の種(*Prays* spp.)、プロデニア属の種(*Prodenia* spp.)、プロキセヌス・レピゴン(*Proxenus lepigone*)、シュードアレティア属の種(*Pseudaletia* spp.)、例えば、P. セクアキス(*P. sequax*)、P. ウニブンクタ(*P. unipuncta*)；ピラウスタ・ヌビラリス(*Pyrausta nubilalis*)、ラキブルシア・ヌ(*Rachiplusia nu*)、リキア・アルビコスタ(*Richia albicosta*)、リゾビウス・ヴェントラリス(*Rhizobius ventralis*)、リアキオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、サブロデス・アエグロタタ(*Sabulodes aegrotata*)、スキズラ・コンシンナ(*Schizura concinna*)、スコエノビウス属の種(*Schoenobius* spp.)、スクレッケンステイニア・フェスタリエラ(*Schreckensteinia festaliella*)、スキルボファガ属の種(*Scirpophaga* spp.)、例えば、S. インセルツラス(*S. incertulas*)、S. インノタタ(*S. innotata*)；スコティア・セゲツム(*Scotia segetum*)、セサミア属の種(*Sesamia* spp.)、例えば、S. インフェレンス(*S. inferens*)、ソイジラ・スブフラバ(*Seudyra subflava*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、スピロノタ・レクリアスピス(*Spilonota lechriaspis*)、S. オセラナ(*S. ocellana*)、スボドプテラ(=ランフィグマ)属の種(*Spodoptera* (=*Lamphygma*) spp.)、例えば、S. コスモイデス(*S. cosmoides*)、S. エリダニア(*S. eridania*)、S. エキシグア(*S. exigua*)、S. フルギペルダ(*S. frugiperda*)、S. ラチファシア(*S. latifascia*)、S. リットラリス(*S. littoralis*)、S. リツラ(*S. litura*)、S. オミトガリ(*S. omithogalli*)；スチグメラ属の種(*Stigmella* spp.)、ストモプテリクス・サブセシヴェラ(*Stomopteryx subsecivella*)、ストリモン・バゾキイ(*Strymon bazochii*)、シレプタ・デロガタ(*Sylepta derogata*)、シナンセドン属の種(*Synanthedon* spp.)、例えば、S. エキシチオサ(*S. exitiosa*)、テシア・ソラニヴオラ(*Tecia solanivora*)、テレヒン・リクス(*Telehin licus*)、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaumatopoea pityocampa*)、タウマトチビア(=クリプトフレビア)・ロイコトレタ(*Thaumatotibia* (=*Cryptophlebia*) *leucotreta*)、タウメトポエア・ピチオカンパ(*Thaumetopoea pityocampa*)、テクラ属の種(*Thecla* spp.)、テレシミマ・アンペロファガ(*Theresa imima ampelophaga*)、チリンティナ属の種(*Thyrinteina* spp.)、チルデニア・インコンスピケエラ(*Tildenia inconspicuella*)、チネア属の種(*Tinea* spp.)、例えば、T. クロアセラ(*T. cloacella*)、T. ペリオネラ(*T. pellionella*)；ティネオラ・ビセリエラ(*Tineola bisselliella*)、トルトリクス属の種(*Tortrix* spp.)、例えば、T. ビリダナ(*T. viridana*)；トリコファガ・タペトゼラ(*Trichophaga tapetzella*)、トリコブルシア属の種(*Trichoplusia* spp.)、例えば、T. ニ(*T. ni*)；ツタ(=スクロビバルブラ)・アブソルタ(*Tuta* (=*Scrobipalpula*) *absoluta*)、ウデア属の種(*Udea* spp.)、例えば、U. ルビガリス(*U. rubigalis*)、U. ルビガリス(*U. rubigalis*)；ビラコラ属の種(*Virachola* spp.)、イポノモイタ・パデラ(*Yponomeuta padella*)、及びゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)；

【 0 1 8 3 】

鞘翅目(Coleoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アカリニマ・ビタタム(*Acalymma vittatum*)、インゲンマメゾウムシ(*Acanthoscelides obtectus*)、アドレタス属の種(*Adoretus* spp.)、アゲラスティカ・アルニ(*Agelastica alni*)、アグリルス属の種(*Agrilus* spp.)、例えば、A. アンキシウス(*A. anxius*)、A. プラニペニス(*A. planipennis*)、A. シヌア

ツス(*A. sinuatus*)；アグリオテス属の種(*Agriotes spp.*)、例えば、*A. fuscicollis*、*A. lineatus*、*A. obscurus*；アルフィトビウス・ジアペリヌス(*Alphitobius diaperinus*)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパル(*Anisandrus dispar*)、アニソブリア・アウストリアカ(*Anisoplia austriaca*)、アノビウム・ブンクタツム(*Anobium punctatum*)、アノマラ・コルプレンタ(*Anomala corpulenta*)、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、アノプロフォラ属の種(*Anoplophora spp.*)、例えば、*A. glabripennis*；アンソノマス属の種(*Anthonomus spp.*)、例えば、*A. eugenii*、*A. grandis*、*A. pomorum*；アンスレナス属の種(*Anthrenus spp.*)、アフトナ・ユーホリダエ(*Aphthona euphoridae*)、アピオン属の種(*Apion spp.*)、アポゴニア属の種(*Apogonia spp.*)、アソウス・ハエモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア属の種(*Atomaria spp.*)、例えば、*A. linearis*；アタゲナス属の種(*Attagenus spp.*)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、ブラストファガス・ピニペルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダタ(*Blitophaga undata*)、ブルキディウス・オブテクタス(*Bruchidius obtectus*)、ブルーカス属の種(*Bruchus spp.*)、例えば、*B. lentis*、*B. pisorum*、*B. rufimanus*；ビクチスクス・ベツラ(*Byctiscus betulae*)、カリジエルム・ルフィペン(*Calidiellum rufipenne*)、カロピストリア・フロリデンシス(*Callopistria floridensis*)、アズキマメゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、カメラリア・オーリデラ(*Cameraria ohridella*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、セトニア・アウラタ(*Cetonia aurata*)、ケウトリリンクス属の種(*Ceuthorhynchus spp.*)、例えば、*C. assimilis*、*C. napi*；ケトクネマ・ティビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、クレオヌス・メンディクス(*Cleonus mendicus*)、コノデルス属の種(*Conoderus spp.*)、例えば、*C. vespertinus*；コノトラケルス・ネヌファル(*Conotrachelus nenuphar*)、コスマポリテス属の種(*Cosmopolites spp.*)、コステリトラ・ジーランディカ(*Costelytra zealandica*)、クリオセリス・アスパラギ(*Crioceris asparagi*)、クリプトレステス・フェルギノイス(*Cryptoleistes ferrugineus*)、クリプトリンカス・ラパチ(*Cryptorhynchus lapathi*)、クテニセラ属の種(*Ctenicera spp.*)、例えば、*C. destructor*；クルクリオ属の種(*Curculio spp.*)、シリンドロコプツルス属の種(*Cylindrocopturus spp.*)、シクロセファラ属の種(*Cyclocephala spp.*)、ダクチルイスパ・バリイ(*Dactylispa balyi*)、デクテス・テキサヌス(*Dectes texanus*)、デルメステス属の種(*Dermestes spp.*)、ジアプロティカ属の種(*Diabrotica spp.*)、例えば、*D. undecimpunctata*、*D. speciosa*、*D. longicornis*、*D. semipunctata*、*D. virgifera*；ジアプレペス・アップレビアテス(*Diaprepes abbreviates*)、ディコクロシス属の種(*Dichocrocis spp.*)、ディクラディスパ・アルミゲラ(*Dicladispa armigera*)、アブデルスツノカブト(*Diloboderus abderus*)、ジオカランドラ・フルメンチ(*Diocalandra frumenti*)（ジオカランドラ・スチグマチコリサ(*Diocalandra stigmaticollis*)）、エナファロデス・ルフルス(*Enaphalodes rufulus*)、エピラクナ属の種(*Epilachna spp.*)、例えば、*E. varivestis*、*E. vigintioctomaculata*；エピトリックス属の種(*Epitrix spp.*)、例えば、*E. hirtipennis*、*E. similis*；オイテオラ・フミリス(*Eutheola humilis*)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、ファウスチヌス・クバエ(*Faustinus cubae*)、ギビウム・ブシロイデス(*Gibbium psylloides*)、グナトセルス・コルヌツス(*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス(*Hellula undalis*)、ヘテロニカス・アラトル(*Heteronychus arator*)、ヒラモルファ・エレガヌス(*Hylamorpha elegans*)、ヒロビウス・アビエチス(*Hylobius abietis*)、ヒロトルペス・バユルス(*Hylobius bajulus*)、ヒペラ属の種(*Hypera spp.*)、例えば、*H. brunneipennis*、*H. postica*；ヒポメセス・スクアモスス(*Hypothenemus squamosus*)、ハイポセネムス属の種(*Hypothenemus spp.*)、ヤツバキクイムシ(*Ips* 50

typographus)、ラクノステルナ・コンサンゲイネア(*Lachnostenra consanguinea*)、ラシオデルマ・セリコルン(*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザ(*Latheticus oryzae*)、ラトリジウス属の種(*Lathridius spp.*)、レマ属の種(*Lema spp.*)、例えば、*L. bilineata*、*L. melanopus*；レブチノタルサ属の種(*Leptinotarsa spp.*)、例えば、*L. decemlineata*；レブチスパ・ピグマエア(*Lepisipa pygmaea*)、リモニウス・カリホルニカス(*Limonius californicus*)、リソロプトルス・オリゾフィルス(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リクサス属の種(*Lixus spp.*)、ルペロデス属の種(*Luperodes spp.*)、リクタス属の種(*Lyctus spp.*)、例えば、*L. brunneus*；リオゲニス・フスクス(*Liogenys fuscus*)、マクロダクチルウス属の種(*Macroductylus spp.*)、例えば、*M. subspinosis*；マラデラ・マトリダ(*Maladera matrida*)、メガプラチプス・ムタテス(*Megaplatypus mutates*)、メガスセリス属の種(*Megascelis spp.*)、メラノツス・コンムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス属の種(*Meligethes spp.*)、例えば、*M. aeneus*；メロロンタ属の種(*Melo lontha spp.*)、例えば、*M. hippocastani*、*M. melolontha*；メタマシウス・ヘミプテルス(*Metamasius hemipterus*)、ミクロテカ属の種(*Micro theca spp.*)、ミグドルス属の種(*Migdolus spp.*)、例えば、*M. fryanus*、モノカムス属の種(*Monochamus spp.*)、例えば、*M. alternatus*；ナウパクトス・キサンソグラフス(*Naupactus xanthographus*)、ニプトゥス・ホロレウクス(*Niptus hololeucus*)、オベリア・ブレビス(*Oberia brevis*)、オエモナ・ヒルタ(*Oemona hirta*)、オリクテス・リノセロス(*Oryctes rhinoceros*)、オリザエフィルス・スリナメンシス(*Oryzaephilus surinamensis*)、オリザファガス・オリザエ(*Oryzaphagus oryzae*)、オチオリンクス・スルカタス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバタス(*Otiorrhynchus ovatus*)、オチオリンクス・スルカタス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オウレマ・メラノプス(*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリゼエ(*Oulema oryzae*)、オキシセトニア・ジュクンダ(*Oxyctonia jucunda*)、ファエドン属の種(*Phaedon spp.*)、例えば、*P. brassicae*、*P. cochleariae*；ホラカンタ・レクルバ(*Phoracantha recurva*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga spp.*)、例えば、*P. helleri*；フィロトレタ属の種(*Phyllotreta spp.*)、例えば、*P. chrysocephala*)、*P. nemorum*)、*P. striolata*)、*P. vittula*；フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、ポピリア・ジャポニカ(*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属の種(*Premnotrypes spp.*)、プサコテア・ヒラリス(*Psacothea hilaris*)、ブシリオデス・クリンセファラ(*Psylliodes chrysoccephala*)、プロステファヌス・トルンカテス(*Prostephanus truncatus*)、ブシリオデス属の種(*Psylliodes spp.*)、ブチナス属の種(*Ptinus spp.*)、ブルガ・サルトナ(*Pulga saltona*)、リゾペルタ・ドミニカ(*Rhizopertha dominica*)、リンコホルス属の種(*Rhynchophorus spp.*)、例えば、*R. billineatus*)、*R. ferrugineus*)、*R. palmarum*)、*R. phoenicis*)、*R. vularis*)；サベルダ・カンジダ(*Saperda candida*)、スコリツス・スケビレウイ(*Scolytus schevyrewi*)、シホホルス・アクンクタツス(*Scyphophorus acupunctatus*)、アカアシチビコフキゾウムシ(*Sitona lineatus*)、シトフィラス属の種(*Sitophilus spp.*)、例えば、*S. granaria*)、*S. oryzae*)、*S. zeamais*)；スフェノフォラス属の種(*Sphenophorus spp.*)、例えば、*S. levis*)；ステゴビウム・パニコイム(*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属の種(*Sternechus spp.*)、例えば、*S. subsignatus*)；ストロホモルフス・クテノツス(*Strophomorphus ctenotus*)、シンフィレテス属の種(*Symplyctes spp.*)、タニメカス属の種(*Tanymecus spp.*)、テネブリオ・モリター(*Tenebrio molitor*)、テネブリオイデス・マウレタニクス(*Tenebrioides mauretanicus*)、トリボリウム属の種(*Tribolium spp.*)、例えば、*T. castaneum*)；トロゴデルマ属の種(*Trogoderma spp.*)、チキアス属の種(*Tychius spp.*)、キシロトレカス属の種(*Xylotrichus spp.*)、例えば、*X. pyrr* 50

hoderus) ; 及び、ザブルス属の種(*Zabrus* spp.)、例えば、Z. テネブリオイデス(*Z. tenebrioides*)；

【0184】

双翅目(Diptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アエデス属の種(*Aedes* spp.)、例えば、A. アエギプチ(*A. aegypti*)、A. アルボピクトス(*A. albopictus*)、A. ベキサンス(*A. vexans*)；メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス属の種(*Anopheles* spp.)、例えば、A. アルビマヌス(*A. albimanus*)、A. クルシアンス(*A. crucians*)、A. フレエボルニ(*A. freeborni*)、A. ガンビア(*A. gambiae*)、A. ロイコスフィルス(*A. leucosphyrus*)、A. マクリペニス(*A. maculipennis*)、A. ミニムス(*A. minimus*)、A. クアドリマクラツス(*A. quadrimaculatus*)、A. シネンシス(*A. sinensis*)；バクトロセラ・インバデンス(*Bactrocera invadens*)、ビビオ・ホルツラヌス(*Bibio hortulanus*)、カリフォラ・エリスロセファラ(*Calliphora erythrocephala*)、カリフォラ・ビシナ(*Calliphora vicina*)、セラティティス・キャピタータ(*Ceratitidis capitata*)、クリソミア属の種(*Chrysomyia* spp.)、例えば、C. ベッジアナ(*C. bezziana*)、C. ホミニボラキス(*C. hominivorax*)、C. マセラリア(*C. macellaria*)；クリソップス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、クリソップス・ディスカリス(*Chrysops discalis*)、クリソップス・シラセア(*Chrysops silacea*)、コクリオミイヤ属の種(*Cochliomyia* spp.)、例えば、C. ホミニボラキス(*C. hominivorax*)；コンタリニア属の種(*Contarinia* spp.)、例えば、C. ソルギコラ(*C. sorghicola*)；コルディロビア・アンスロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クレックス属の種(*Culex* spp.)、例えば、C. ニグリパルpus(*C. nigripalpus*)、C. ピピエンス(*C. pipiens*)、C. キンクファシアツス(*C. quinquefasciatus*)、C. タルサリス(*C. tarsalis*)、C. トリタエニオリンクス(*C. tritaeniorhynchus*)；クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、クテレブラ属の種(*Cuterebra* spp.)、ウリミバエ(*Dacus cucurbitae*)、ダカス・オレアエ(*Dacus oleae*)、ダイコンタマバエ(*Dasineura brassicae*)、ダシノイラ・オキシコッカナ(*Dasineura oxyccana*)、デリア属の種(*Delia* spp.)、例えば、D. アンチク(*D. antique*)、D. コアルクタタ(*D. coarctata*)、D. プラツラ(*D. platura*)、D. ラジクム(*D. radicum*)；デルマトビア・ホミニス(*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属の種(*Drosophila* spp.)、例えば、D. スズキイ(*D. suzukii*)、ファニア属の種(*Fannia* spp.)、例えば、F. カニクラリス(*F. canicularis*)；ガステロフィルス属の種(*Gastraphilus* spp.)、例えば、G. インテスチナリス(*G. intestinalis*)；ゲオミザ・チブンクタタ(*Geomyza tipunctata*)、グロッシナ属の種(*Glossina* spp.)、例えば、G. フシペス(*G. fuscipes*)、G. モルシタンス(*G. morsitans*)、G. パルパリス(*G. palpalis*)、G. タキノイデス(*G. tachinoides*)；ノサシバエ(*Haemobapha irritans*)、ハプロジェクトロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種(*Hippelates* spp.)、ヒレミア属の種(*Hylemyia* spp.)、例えば、H. プラツラ(*H. platura*)；ヒポデルマ属の種(*Hypoderma* spp.)、例えば、H. リネアタ(*H. lineata*)；ヒッポボスカ属の種(*Hippobosca* spp.)、トウヨウイネクキミギワバエ(*Hydrellia philippina*)、レプトコノプス・トレンス(*Leptoconops torrens*)、リリオミザ属の種(*Liriomyza* spp.)、例えば、L. サチバ(*L. sativae*)、L. トリホリイ(*L. trifolii*)；ルシリア属の種(*Lucilia* spp.)、例えば、L. カプリナ(*L. caprina*)、L. クプリナ(*L. cuprina*)、L. セリカタ(*L. sericata*)；リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・ティティラヌス(*Mansonia titillans*)、マイエチオラ属の種(*Mayetiola* spp.)、例えば、M. デストルクトル(*M. destructor*)；ムスカ属の種(*Musca* spp.)、例えば、M. アウツムナリス(*M. autumnalis*)、M. ドメスチカ(*M. domestica*)；オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、オエストルス属の種(*Oestrus* spp.)、例えば、O. オビス(*O. ovis*)；オポミザ・フロルム(*Opomyza florum*)、オシネラ属の種(*Oscinella* spp.)、例えば、O. フリット(*O. fritt*)；オルセオリア・オリゼ(*Orseolia oryzae*)、ペゴミア・ヒソシアミ(*Pegomya hysocyma*)、フェレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、ホルビア属の種(*Phorbia* spp.)、例えば、P. アンチクア(*P. antiqua*)、P. プラツシカ(*P. brassicae*)、P. コアルクタタ(*P. coarctata*)；フィトミザ・ギムノストマ(*Phytomyza gymnostoma*)、プロシム

10

20

30

40

50

リウム・ミクスタム(*Prosimulium mixtum*)、プシラ・ロザエ(*Psila rosae*)、プソロフォラ・コロムビアエ(*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ディスカラ(*Psorophora discolor*)、ラゴレチス属の種(*Rhagoletis* spp.)、例えば、*R.セラシ*(*R. cerasi*)、*R.シングラート*(*R. cingulata*)、*R.インジフェレンス*(*R. indifferens*)、*R.メンダキス*(*R. mendax*)、*R.ポモネラ*(*R. pomonella*)；リベリア・クアドリファシアタ(*Rivellia quadrifasciata*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、例えば、*S.ハエモロイダリス*(*S. haemorrhoidalis*)；シムリウム・ウィッタツム(*Simulium vittatum*)、シトジプロシス・モセラナ(*Sitodiplosis mosellana*)、ストモキシス属の種(*Stomoxys* spp.)、例えば、*S.カルシトランス*(*S. calcitrans*)；タバヌス属の種(*Tabanus* spp.)、例えば、*T.アトラツス*(*T. atratus*)、*T.ボビヌス*(*T. bovinus*)、*T.リネオラ*(*T. lineola*)、*T.シミリス*(*T. similis*)；
10 タンニア属の種(*Tannia* spp.)、テコジプロシス・ジャボネンシス(*Thecodiplosis japonensis*)、チプラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)、チプラ・パルドサ(*Tipula paludosa*)、及びウォールファールチア属の種(*Wohlfahrtia* spp.)；

【0185】

総翅目(Thysanoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、バリオトリップス・ビフォルミス(*Baliothrips biformis*)、ジクロモトリップス・コルベッチ(*Dichromothrips corbetti*)、ジクロモトリップス亜種(*Dichromothrips* spp.)、エキノトリップス・アメリカヌス(*Echinothrips americanus*)、エネオトリップス・フラベンス(*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属の種(*Frankliniella* spp.)、例えば、*F.フスカ*(*F. fusca*)、*F.オッシデンタリス*(*F. occidentalis*)、*F.トリチシ*(*F. tritici*)；ヘリオスリップス属の種(*Heliothrips* spp.)、ヘルシノスリップス・フェモラリス(*Hercinothrips femoralis*)、カコスリップス属の種(*Kakothrips* spp.)、ミクロセファロトリップス・アブドミナリス(*Microcephalothrips abdominalis*)、ネオヒダトトリップス・サマユンクル(*Neohydatothrips samayunkur*)、ペゾトリップス・ケリアヌス(*Pezothrips kellyanus*)、リピフォロスリップス・クルエンタッス(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、スキルトスリップス属の種(*Scirtothrips* spp.)、例えば、*S.シトリ*(*S. citri*)、*S.ドルサリス*(*S. dorsalis*)、*S.ペルセア*(*S. perseae*)；ステンカエトトリップス属の種(*Stenchaetothrips* spp.)、タエニオスリップス・カルダモニ(*Taeniothrips cardamoni*)、タエニオトリップス・インコンセクエンス(*Taeniothrips inconsequens*)、スリップス属の種(*Thrips* spp.)、例えば、*T.イマギネス*(*T. imagines*)、*T.ハワイイエンシス*(*T. hawaiiensis*)、*T.オリザ*(*T. oryzae*)、*T.パルミ*(*T. palmi*)、*T.パルビスピヌス*(*T. parvispinus*)、*T.タバシ*(*T. tabaci*)；
30 【0186】

半翅目(Hemiptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アシッジア・ジャマトニカ(*Acizzia jamatonica*)、アクロステルヌム属の種(*Acrosternum* spp.)、例えば、*A.ヒラル*(*A. hirale*)；アシルトシポン属の種(*Acyrthosipon* spp.)、例えば、*A.オノブリキス*(*A. onobrychis*)、*A.ピスム*(*A. pisum*)；カラマツカサアブラムシ(*Adelges laricis*)、アデルゲス・ツガ(*Adelges tsugae*)、アデルホコリス属の種(*Adelphocoris* spp.)、例えば、*A.ラピズス*(*A. rapidus*)、*A.スペルブス*(*A. superbus*)；アエネオラミア属の種(*Aeneolamia* spp.)、アゴノセナ属の種(*Agonoscena* spp.)、アウラコルサム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)、アレウロカンツス・ウォグルミ(*Aleurocanthus woglumi*)、アレウローデス属の種(*Aleurodes* spp.)、アレウロジクス・ジスペルセス(*Aleurodicus disperses*)、アレウロロブス・バロデンシス(*Aleurolobus barodensis*)、アレウロスリンクス属の種(*Aleurothrixus* spp.)、アムラスカ属の種(*Amrasca* spp.)、アナサ・トリスティス(*Anasa tristis*)、アンテスティオブシス属の種(*Antestiopsis* spp.)、アヌラフィス・カルドウイ(*Anuraphis cardui*)、アオニディエラ属の種(*Aonidiella* spp.)、アファノスティグマ・ピリ(*Aphanostigma piri*)、アフィドウラ・ナスツルチイ(*Aphidula nasturtii*)、アフィス属の種(*Aphis* spp.)、例えば、*A.クラッショラ*(*A. craccivora*)、*A.ファバエ*(*A. fabae*)、*A.ホルベシ*(*A. forbesi*)、*A.ゴッシピイ*(*A. gossypii*)、*A.グロッスラリア*(*A. grossulariae*)、*A.マイジラジシス*(*A. maidiradicis*)、*A.ポミ*(*A. pomi*)、*A.サンブシ*(*A. sambuci*)、*A.スクネイデリ*(*A. schneideri*)、*A.スピラエコラ*(*A. spiraecola*)；アルボリディア・アピカリス(
50

Arboridia apicalis)、アリルス・クリタツス(Arius critatus)、アスピディエラ属の種(Aspidiella spp.)、アスピディオトウス属の種(Aspidiotus spp.)、アタヌス属の種(Atanus spp.)、アウラカスピス・ヤスマツイ(Aulacaspis yasumatsui)、アウラコルサム・ソラニ(Aulacorthum solani)、バクテリセラ・コッケレリ(Bactericera cockerelli)(パラトリオザ・コッケレリ(Paratrioza cockerelli))、ベミシア属の種(Bemisia spp.)、例えば、B.アルゲンチホリイ(B. argentifolii)、B.タバシ(B. tabaci)(アレウローデス・タバシ(Aleurodes tabaci))、ブリッサス属の種(Blissus spp.)、例えば、B.ロイコプロテルス(B. leucopterus)；ブラキカウズス属の種(Brachycaudus spp.)、例えば、B.カルズイ(B. cardui)、B.ヘリクリシ(B. helichrysi)、B.ペルシカ(B. persicae)、B.ブルニコラ(B. prunicola)；ブラキコルス属の種(Brachycolus spp.)、ブラキコリネラ・アスパラギ(10 Brachycorynella asparagi)、ブレビコリネ・ブラシカエ(Brevicoryne brassicae)、カコプシルラ属の種(Cacopsylla spp.)、例えば、C.フルグラリス(C. fulguralis)、C.ピリコラ(C. pyricola)(プシラ・ピリ(Psylla piri))、カリギボナ・マルギナータ(Calligrapha marginata)、カロコリス属の種(Calocoris spp.)、キャンピロンマ・リビダ(Campylomma livida)、カピトフォルス・ホルニ(Capitophorus horni)、カルネオセファラ・フルギーダ(Carneocephala fulgida)、カベレリウス属の種(Cavelerius spp.)、セロプラステス属の種(Ceroplastes spp.)、ケラトバクナ・ラニゲラ(Ceratovacuna lanigera)、セロプラステス・セリフェルス(Ceroplastes ceriferus)、セロシファ・ゴッシピイ(Cerosiph a gossypii)、カエトシフォン・フラガエフォリ(Chaetosiphon fragaefolii)、キオナスピス・テガレンシス(Chionaspis tegalensis)、クロリタ・オヌキイ(Chlorita onukii)、クロマフィス・ジュグランディコラ(Chromaphis juglandicola)、クリソムファルス・フィクス(Chrysomphalus ficus)、シカルデュリナ・ムビラ(Cicadulina mbila)、キメクス属の種(Cimex spp.)、例えば、C.ヘミプロテルス(C. hemipterus)、C.レクツラリウス(C. lectularius)；ココミティルス・ハリ(Coccomytilus halli)、コッカス属の種(Coccus sp p.)、例えば、C.ヘスペリズム(C. hesperidum)、C.プロソイドマグノリアルム(C. pseudognoliarum)；コリツカ・アルクアタ(Corythucha arcuata)、クレオンティアデス・ディルタス(Creontiades dilutus)、クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、クリソソナルス・アオニズム(Chrysomphalus aonidum)、クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、クテナリタイナ・スパツラタ(Ctenarytaina spatulata)、シルトペルチス・ノタツス(Cyrtopeltis notatus)、ダルブルス属の種(Dalbulus spp.)、ダシヌス・ピペリス(D. asynus piperis)、ジアレウローデス属の種(Dialeurodes spp.)、例えば、D.シトリホリイ(D. citrifolii)；ダルブルス・マイジス(Dalbulus maidis)、ディアフォリーナ属の種(Diaphorina spp.)、例えば、D.シトリ(D. citri)；ディアスピス属の種(Diaspis spp.)、例えば、D.プロメリア(D. bromeliae)；ディケロプス・フルカツス(Dichelops furcatus)、ディコノコリス・ヘウエッティ(Diconocoris hewetti)、ドラリス属の種(Doralis spp.)、ドレイフシア・ノルドマニアナ(Dreyfusia nordmanniana)、ドレイフシア・ピセア(Dreyfusia piceae)、ドロシカ属の種(Drosicha spp.)、ディサフィス属の種(Dysaphis spp.)、例えば、D.プランタギネア(D. plantaginea)、D.ピリ(D. pyri)、D.ラジコラ(D. radicola)；ジサウラコルツム・プロソイドソラニ(Dysaulacorthum pseudosolani)、ディスデルカス属の種(Dysdercus spp.)、例えば、D.シングラツス(D. cingulatus)、D.インテルメジウス(D. intermedius)；ディスマコックス属の種(Dysmicoccus spp.)、エデッサ属の種(Edessa spp.)、ゲオコリス属の種(Geocoris spp.)、エンポアスカ属の種(Empoasca spp.)、例えば、E.ファバ(E. fabae)、E.ソラナ(E. solana)；エピジアスピス・レペリイ(Epidiaspis leperii)、エリオソマ属の種(Eriosoma spp.)、例えば、E.ラニゲルム(E. lanigerum)、E.ピリコラ(E. pyricola)；エリスロニューラ属の種(Erythroneura spp.)、ユーリガステル属の種(Eurygaster spp.)、例えば、E.インテグリセプス(E. integriceps)；ユーセリス・ビロバタス(Euscelis bilobatus)、ユースキスツス属の種(Euschistus spp.)、例えば、E.ヘロース(E. heros)、E.インピクチベントリス(E. impictiventralis)、E.セルブス(E. servus)；フィオリニア・テア(Fiorinia theae)、ゲオコックス・コッフェアエ(Geococcus coffeae)、グリカスピス・プリンプレコンベイ(Glycaspis 50

brimblecombei)、ハリオモルファ属の種(*Halyomorpha* spp.)、例えば、*H. ハリス*(*H. halys*)；ヘリオペルティス属の種(*Heliopeletis* spp.)、ホマロジスカ・ビトリペンニス(=*H. コアグラタ*)(*Homalodisca vitripennis*(=*H. coagulata*))、ホルキアス・ノビレルス(*Horcius nobilellus*)、モモコフキアプラムシ(*Hyalopterus pruni*)、チシャミドリアプラムシ(*Hyperomyzus lactucae*)、イセリヤ属の種(*Icerya* spp.)、例えば、*I. ブルカーゼ*(*I. purchase*)；イディオケルス属の種(*Idiocerus* spp.)、イディオスコpus属の種(*Idioscopus* spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス(*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属の種(*Lecanium* spp.)、レカノイドイス・フロッシシムス(*Lecanoideus floccissimus*)、レピドサフェス属の種(*Lepidosaphes* spp.)、例えば、*L. ウルミ*(*L. ulmi*)；レプトコリサ属の種(*Leptocoris* spp.)、レプトグロサス・フィロpus(*Leptoglossus phyllopus*)、リパフィス・エリシミ(*Lipaphis erysimi*)、リグス属の種(*Lygus* spp.)、例えば、*L. ヘスペルス*(*L. hesperus*)、*L. リネオラリス*(*L. lineolaris*)、*L. プラテンシス*(*L. pratensis*)；マコネリコックス・ヒルスツス(*Maconellicoccus hirsutus*)、マルカリナ・ヘレニカ(*Marchalina hellenica*)、マクロペス・エクスカバツス(*Macropes excavatus*)、マクロシフム属の種(*Macrosiphum* spp.)、例えば、*M. ロサ*(*M. rosae*)、*M. アベナ*(*M. avenae*)、*M. オイホルビア*(*M. euphorbiae*)；マクロステレス・クアドリリネアツス(*Macrosteles quadrilineatus*)、マハナルバ・フィムブリオラタ(*Mahanarva fimbriolata*)、タイワンマルカムシ(*Megacopta cribraria*)、ソラマメヒゲナガアラムシ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrarius*)、メラナフィス・サッカリ(*Melanaphis sacchari*)、メラノカリス(=チノカリス)・カリエホリア(*Melanocallis* (=*Tinocallis*) *carayaefoliae*)、メトカルフィエラ属の種(*Metcalfiella* spp.)、メトポロフィウム・ジルホヅム(*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス(*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス(*Monelliopsis pecanis*)、ミゾカリス・コリルイ(*Myzocallis coryli*)、ムルガンチア属の種(*Murgantia* spp.)、ミズス属の種(*Myzus* spp.)、例えば、*M. アスカロニクス*(*M. ascalonicus*)、*M. セラシ*(*M. cerasi*)、*M. ニコチアナ*(*M. nicotianae*)、*M. ペルシカ*(*M. persicae*)、*M. バリアンス*(*M. varians*)；ナソノビア・リビスニグリ(*Nasonovia ribis-nigri*)、ネオトキソプテラ・ホルモサナ(*Neotoxoptera formosana*)、ネオメガロトムス属の種(*Neomegalotomus* spp.)、ネホテティクス属の種(*Nephrotettix* spp.)、例えば、*N. マラヤヌス*(*N. malayanus*)、*N. ニグロピクツス*(*N. nigropictus*)、*N. パルブス*(*N. parvus*)、*N. ビレセンス*(*N. virescens*)；ネザラ属の種(*Nezara* spp.)、例えば、*N. ビリズラ*(*N. viridula*)；ニラパルバータ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、ニシウス・フットニ(*Nysius huttoni*)、オエバルス属の種(*Oebalus* spp.)、例えば、*O. プグナキス*(*O. pugnax*)；オンコメトピア属の種(*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ(*Orthezia praelonga*)、オキシカラエヌス・ヒアリニベンニス(*Oxycaraenus hyalinipennis*)、バラベミシア・ミリカエ(*Parabemisia myricae*)、パルラトリア属の種(*Parlatoria* spp.)、パルテノレカニウム属の種(*Parthenolecanium* spp.)、例えば、*P. コルニ*(*P. corni*)、*P. ペルシカ*(*P. persicae*)；ペムフィグス属の種(*Pemphigus* spp.)、例えば、*P. ブルサリウス*(*P. bursarius*)、*P. ポブリベナ*(*P. populivenae*)；ペレグリヌス・マイディス(*Peregrinus maidis*)、クロフツノウンカ(*Perkinsiella saccharicida*)、フェナコッカス属の種(*Phenacoccus* spp.)、例えば、*P. アセリス*(*P. aceris*)、*P. ゴッシピイ*(*P. gossypii*)；ブロエオミズス・パセリニイ(*Phloeomyzus passerinii*)、フォロドン・フミリ(*Phorodon humuli*)、フィロクセラ属の種(*Phylloxera* spp.)、例えば、*P. デバスタトリキス*(*P. devastatrix*)、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ピエゾドラス属の種(*Piezodorus* spp.)、例えば、*P. グイルジニイ*(*P. guildinii*)；ピナスピス・アスピディストラエ(*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコッカス属の種(*Planococcus* spp.)、例えば、*P. シトリ*(*P. citri*)、*P. フィクス*(*P. ficus*)；プロサピア・ビシンクタ(*Prosapia bicincta*)、プロトパルビナリア・ピリフォルミス(*Protopulvinaria pyriformis*)、プサルス・セリアツス(*Psaltus seriatus*)、シューダシスタ・ペルセア(*Pseudacysta perseae*)、シュードオーラカスピス・ペンタゴナ(*Pseudaulacaspis pentagona*)、シュードコッカス属の種(*Pseudococcus* spp.)、例えば、*P. コムストッキ*(*P. comstocki*)；プシラ属の種(*Psylla* spp.)、例えば

10

20

30

40

50

、P. マリ(*P. mali*)； プテロマルス属の種(*Pteromalus* spp.)、プルビナリア・アミグダリ(*Pulvinaria amygdali*)、ピリラ属の種(*Pyrilla* spp.)、クアドラスピディオツス属の種(*Quadraspidiotus* spp.)、例えば、Q. ペルニシオスス(*Q. perniciosus*)； クエサダ・ギガス(*Quesada gigas*)、ラストロコッカス属の種(*Rastrococcus* spp.)、レデュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、リゾエクス・アメリカヌス(*Rhizoecus americanus*)、ロドニウス属の種(*Rhodnius* spp.)、ロパロミズス・アスカロニクス(*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ロパロシファム属の種(*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、R. プソイドブラッシカス(*R. pseudobrassicas*)、R. インセルツム(*R. insertum*)、R. マイジス(*R. maidis*)、R. パジ(*R. padi*)； ソガトデス属の種(*Sagatodes* spp.)、サールベルゲラ・シンギュラリス(*Sahlbergella singularis*)、サイセティア属の種(*Saissetia* spp.)、サッパフィス・マラ(*Sappaphis mala*)、サッパフィス・マリ(*Sappaphis mali*)、スカプトコリス属の種(*Scaptocoris* spp.)、スカホイデス・ティタヌス(*Scaphoides titanus*)、スキザフィス・グラミナム(*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌギノサ(*Schizoneura lanuginosa*)、スコチノフオラ属の種(*Scotinophora* spp.)、セレナスピズス・アルティキュラツス(*Selenaspis articulatus*)、シトビオン・アベナエ(*Sitobion avenae*)、ソガタ属の種(*Sogata* spp.)、ソガテラ・フリシフェラ(*Sogatella furcifera*)、ソルベア・インスラリス(*Solubea insularis*)、スピッシスチルス・フェスチヌス(=スティクトセファラ・フェスティナ)(*Spissistilus festinus*(=*Stictocephala festina*))、ステファニティス・ナシ(*Stephanitis nashi*)、ステファニチス・ピリオイデス(*Stephanitis pyrioides*)、ステファニチス・タケヤイ(*Stephanitis takeyai*)、テナラファラ・マレイエンシス(*Tenalaphara malayensis*)、テトラロイロデス・ペルセア(*Tetraleurodes perseae*)、テリオアフィス・マクラート(*Theroaphis maculata*)、チアンタ属の種(*Thyanta* spp.)、例えば、T. アッセラ(*T. accerra*)、T. ペルジトル(*T. perditor*)； ティプラカ属の種(*Tibraca* spp.)、トマスピス属の種(*Tomaspis* spp.)、トキソプテラ属の種(*Toxoptera* spp.)、例えば、T. アウランチイ(*T. aurantii*)； トリアレウロデス属の種(*Trialeurodes* spp.)、例えば、T. アブチロネア(*T. abutilonea*)、T. リシニ(*T. ricini*)、T. バポラリオルム(*T. vaporariorum*)； トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)、トリオーザ属の種(*Trioza* spp.)、チフロシバ属の種(*Typhlocyba* spp.)、ウナスピス属の種(*Unaspis* spp.)、例えば、U. シトリ(*U. citri*)、U. ヤノネンシス(*U. yanonensis*)； 及びビテウス・ビティフォリ(*Viteus vitifolii*)。

【0187】

膜翅目(Hymenoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アカントミオプス・インテルジェクツス(*Acanthomyops interjectus*)、アタリア・ロサエ(*Athalia rosae*)、アッタ属の種(*Atta* spp.)、例えば、A. カピグアラ(*A. capiguara*)、A. セファロテス(*A. cephalotes*)、A. セファロテス(*A. cephalotes*)、A. ラエビガタ(*A. laevigata*)、A. ロブスタ(*A. robusta*)、A. セキスデンス(*A. sexdens*)、A. テキサナ(*A. texana*)、ボンブス属の種(*Bombus* spp.)、プラキミルメキス属の種(*Brachymyrmex* spp.)、カンボノツス属の種(*Camponotus* spp.)、例えば、C. フロリダヌス(*C. floridanus*)、C. ペンシルバニクス(*C. pennsylvanicus*)、C. モドク(*C. modoc*)； カルジオコンジルア・ヌダ(*Cardiocondyla nuda*)、カリビオン属の種(*Chalibion* sp)、クレマトガスター属の種(*Crematogaster* spp.)、ダシムチラ・オッショデンタリス(*Dasymutilla occidentalis*)、ディプリオン属の種(*Diprion* spp.)、ドリコベスプラ・マクラータ(*Dolichovespula maculata*)、ドリミルメキス属の種(*Dorymyrmex* spp.)、ドリオコスムス・クリフィルス(*Dryocosmus kuriphilus*)、ホルミカ属の種(*Formica* spp.)、ホプロカンパ属の種(*Hoplocampus* spp.)、例えば、H. ミヌタ(*H. minuta*)、H. テスツジネア(*H. testudinea*)； イリドミルメキス・フミリス(*Iridomyrmex humilis*)、ラシウス属の種(*Lasius* spp.)、例えば、L. ニゲル(*L. niger*)、アルゼンチンアリ(*Linepithema humile*)、リオメトプム属の種(*Liometopum* spp.)、レプトシブ・インバサ(*Leptocybe invasa*)、モノモリウム属の種(*Monomorium* spp.)、例えば、M. フラオニス(*M. pharaonis*)、モノモリウム(*Monomorium*)、ニルアンドリア・フルバ(*Nylandria fulva*)、パキコンジルア・キネンシス(*Pachycondyla chinensis*)、パラトレキナ・ロンギコルニス(*Paratrechina longicornis*)、パラベスプラ属の種(*Paravespula* spp.)、例えば、P. ゲルマニカ(*P. 50*

. germanica)、P. ペンシルバニア (P. pennsylvanica)、P. ブルガリス (P. vulgaris)； フエイドール属の種 (Pheidole spp.)、例えば、P. メガセファラ (P. megacephala)； ポゴノミルメキス属の種 (Pogonomyrmex spp.)、例えば、P. バルバツス (P. barbatus)、P. カリホルニクス (P. californicus)、ポリステス・ルビギノサ (Polistes rubiginosa)、プレノレピス・インパイルス (Prenolepis impairs)、プソイドミルメキス・グラシリス (Pseudomyrmex gracilis)、スケリプロン属の種 (Schelipron spp.)、シレキス・シアノイス (Sirex cyaneus)、ソレノプシス属の種 (Solenopsis spp.)、例えば、S. ゲミナタ (S. geminata)、S. インビクタ (S. invicta)、S. モレスタ (S. molesta)、S. リクテリ (S. richteri)、S. キシロニ (S. xyloni)、スフェシウス・スペシオスス (Sphecius speciosus)、スフェキス属の種 (Sphex spp.)、タピノマ属の種 (Tapinoma spp.)、例えば、T. メラノセファルム (T. melanocephalum)、T. セッシル (T. sessile)； テトラモリウム属の種 (Tetramorium spp.)、10 例えば、T. カエスピツム (T. caespitum)、T. ビカリナツム (T. bicarinatum)、ベスパ属の種 (Vespa spp.)、例えば、V. クラブロ (V. crabro)； ベスプラ属の種 (Vespula spp.)、例えば、V. スクアモサール (V. squamosa)； ワスマンニア・アウロブンクタタ (Wasmannia auropunctata)、キシロコバ属の種 (Xylocopa sp)；

【0188】

直翅目 (Orthoptera) の目 (order) からの昆虫、例えば、アチエタ・ドメスティカス (Acheta domesticus)、カリプタマス・イタリカス (Calliptamus italicus)、コルトイケテス・テルミニフェラ (Chortoicetes terminifera)、コイトフィルス属の種 (Ceuthophilus spp.)、ジアストランメナ・アシナモラ (Diastrammena asynamora)、ドシオスタウラス・マロッカナス (Dociostaurus maroccanus)、グリロタルパ属の種 (Gryllotalpa spp.)、20 例えば、G. アフリカナ (G. africana)、G. グリルロタルパ (G. gryllotalpa)； グリルルス属の種 (Gryllus spp.)、ヒエログリフス・ダガネンシス (Hieroglyphus daganensis)、クラウッサリア・アングリフェラ (Kraussaria angulifera)、ロクスタ属の種 (Locusta spp.)、30 例えば、L. ミグラトリア (L. migratoria)、L. パルダリナ (L. pardalina)； メラノブルス属の種 (Melanoplus spp.)、例えば、M. ビビッタツス (M. bivittatus)、M. フェムルブルム (M. femur-rubrum)、M. メキシカヌス (M. mexicanus)、M. サングイニペス (M. sanguinipes)、M. スプレツス (M. spretus)； アカトビバッタ (Nomadacris septemfasciata)、オエダレウス・セネガレンシス (Oedaleus senegalensis)、スカプテリスクス属の種 (Scapteriscus spp.)、スキストセルカ属の種 (Schistocerca spp.)、40 例えば、S. アメリカナ (S. americana)、S. グレガリア (S. gregaria)、ステモペルマツス属の種 (Stemopelmatus spp.)、クラズミウマ (Tachycines asynamorus)、及びゾノゼラス・バリエガタス (Zonozerus variegatus)、

【0189】

蛛形綱 (Arachnida) の綱 (Class) からの有害生物、例えば、ダニ類 (Acarini)、50 例えば、以下の科 (family)、ヒメダニ科 (Argasidae)、マダニ科 (Ixodidae) 及びヒゼンダニ科 (Sarcoptidae)、40 例えば、アンブリオンマ属の種 (Amblyomma spp.) (例えば、A. アメリカヌム (A. americanum)、A. バリエガツム (A. variegatum)、A. マクラツム (A. maculatum))、アルガス属の種 (Argas spp.)、30 例えば、A. ペルシク (A. persicum)、ボーフィラス属の種 (Boophilus spp.)、20 例えば、B. アンヌラツス (B. annulatus)、B. デコロラツス (B. decoloratus)、B. ミクロブルス (B. microplus)、デルマセントル属の種 (Dermacentor spp.)、10 例えば、D. シルバルム (D. silvarum)、D. アンデルソニ (D. andersoni)、D. バリアビリス (D. variabilis)、ヒアロンマ属の種 (Hyalomma spp.)、50 例えば、H. トルンカツム (H. truncatum)、イクソデス属の種 (Ixodes spp.)、40 例えば、I. リシヌス (I. ricinus)、I. ルビクンズス (I. rubicundus)、I. スカプラリス (I. scapularis)、I. ホロシクルス (I. holocyclus)、I. パシフィクス (I. pacificus)、クリイロコイタマダニ (Rhipicephalus sanguineus)、オルニトドルス属の種 (Ornithodoros spp.)、30 例えば、O. モウバタ (O. moubata)、O. ヘルムシ (O. hermsi)、O. ツリカタ (O. turicata)、イエダニ (Ornithonyssus bacoti)、オトビウス・メグニニ (Oribius megnini)、デルマニサス・ガリナエ (Dermayssus gallinae)、プソロプテス属の種 (Psoroptes spp.)、20 例えば、P. オビス (P. ovis)、リピセファルス属の種 (Rhipicephalus spp.)、10 例えば、R. サングイノイス (R. sanguineus)、R. アッペンジクラツス (R. ap-

pendiculatus)、リピセファラス・エベルトシ(*Rhipicephalus evertsii*)、リゾグリフス属の種(*Rhizoglyphus* spp.); サルコプテス属の種(*Sarcoptes* spp.)、例えば、*S. スカビエイ*(*S. Scabiei*)；及び科(Family) フシダニ科(*Eriophyidae*)、例えば、アセリア属の種(*Aceria* spp.)、例えば、*A. シェルドニ*(*A. sheldoni*)、*A. アントコプテス*(*A. anthocoptes*)、アカリツス属の種(*Acalitus* spp.); アクロプス属の種(*Aculops* spp.)、例えば、*A. リコペルシシ*(*A. lycopersici*)、*A. ペレカッジ*(*A. pelekassi*)； アクルス属の種(*Aculus* spp.)、例えば、*A. スクレクテンダリ*(*A. schlechtendali*)； コロメルス・ビチス(*Colomerus* *vitis*)、エピトリメルス・ピリ(*Epitrimerus pyri*)、フィロコプトルタ・オレイボラ(*Phyllocoptrus oleivora*)； エリオフィテス・リビス(*Eriophytes ribis*)及びエリオフィエス属の種(*Eriophyes* spp.)、例えば、エリオフィエス・シェルドニ(*Eriophyes sheldoni*)； 科(Family) ホコリダニ科(*Tarsonemidae*)、例えば、ヘミタルソネムス属の種(*Hemitarsonemus* spp.)、シクラメンホコリダニ(*Phytonemus pallidus*)及びポリファゴタルソネムス・ラタス(*Polyphagotarsonemus latus*)、ステノタルソネムス属の種(*Stenotarsone mus* spp.)、ステネオタルソネムス・スピンキ(*Steneotarsonemus spinki*)； 科(Family) ヒメハダニ科(*Tenuipalpidae*)、例えば、ブレビパルpus属の種(*Brevipalpus* spp.)、例えば、*B. ホエニシス*(*B. phoenicis*)； 科(Family) ハダニ科(*Tetranychidae*)、例えば、エオテトラニクス属の種(*Eotetranychus* spp.)、エウテトラニクス属の種(*Eutetranychus* spp.)、オリゴニクス属の種(*Oligonychus* spp.)、ペトロビア・ラテンス(*Petrobia latens*)、テトラニカス属の種(*Tetranychus* spp.)、例えば、*T. シンナバリヌス*(*T. cinnabarinus*)、*T. エバンシ*(*T. evansi*)、*T. カンザワイ*(*T. kanzawai*)、*T. パシフィクス*(*T. pacificus*)、*T. ファソイルス*(*T. phaseulus*)、*T. テラリウス*(*T. telarius*)及び*T. ウルチカ*(*T. urticae*)； ブリオビア・プラエティオサ(*Bryobia praetiosa*)； パノニカス属の種(*Panonychus* spp.)、例えば、*P. ウルミ*(*P. ulmi*)、*P. シトリ*(*P. citri*)； メタテトラニクス属の種(*Metatetranychus* spp.)及びオリゴニクス属の種(*Oligonychus* spp.)、例えば、*O. プラテンシス*(*O. pratensis*)、*O. ペルセア*(*O. perseae*)、ヴァサテス・リコペルシキ(*Vasates lycopersici*)； ラオイエラ・インジカ(*Raoiella indica*)、科(Family) サトウダニ科(*Carpoglyphidae*)、例えば、カルポグリフス属の種(*Carpoglyphus* spp.)； ペンタレイダ属の種(*Penthaleidae* spp.)、例えば、ハロチデウス・デストルクトル(*Halotydeus destructor*)； 科(Family) ニキビダニ科(*Demodicidae*)及びその種、例えば、デモデクス属の種(*Demodex* spp.)； 科(Family) トロンビシデア(*Trombiculaeidae*)、例えば、トロムビクラ属の種(*Trombicula* spp.)； 科(Family) オオサシダニ科(*Macronyssidae*)、例えば、オルノトニクス属の種(*Ornothonyssus* spp.)； 科(Family) シラミダニ科(*Pyemotidae*)、例えば、ピエモテス・トリチシ(*Pyemotes tritici*)； チロファグス・プロセンチア(*Tyrophagus putrescentiae*)； 科(Family) コナダニ科(*Acaridae*)、例えば、アシクトコナダニ(*Acarus siro*)； 科(Family) 真正クモ目(*Araneida*)、例えば、ラトロデクツス・マクタンス(*Latrodectus mactans*)、テゲナリア・アグレスチス(*Tegenaria agrestis*)、キラカンチウム属の種(*Chiracanthium* sp)、リコサ属の種(*Lycosa* sp)、アカエアラネア・テピダリオルム(*Achaearanea tepidariorum*)及びドクイトグモ(*Loxosceles reclusa*)。

【0190】

線形動物門(Nematoda)の門(Phylum)からの有害生物、例えば、植物寄生線虫、例えば、ネコブセンチュウ(root-knot nematodes)、メロイドギン属の種(*Meloidogyne* spp.)、例えば、*M. ハプラ*(*M. hapla*)、*M. インコグニタ*(*M. incognita*)、*M. ジャバニカ*(*M. javanica*)； 囊腫形成線虫(cyst-forming nematodes)、グロボデラ属の種(*Globodera* spp.)、例えば、*G. ロストキエンシス*(*G. rostochiensis*)； ヘテロデラ属の種(*Heterodera* spp.)、例えば、*H. アベナ*(*H. avenae*)、*H. グリシネス*(*H. glycines*)、*H. スカクチイ*(*H. schachtii*)、*H. トリホリイ*(*H. trifolii*)； タネコブセンチュウ(Seed gall nematodes)、アンガイナ属の種(*Anguina* spp.)； 茎及び葉線虫(Stem and foliar nematodes)、アフェレンコイデス属の種(*Aphelenchoides* spp.)、例えば、*A. ベッセイ*(*A. besseyi*)； 刺毛線虫(Sting nematodes)、ベロノライムス属の種(*Belonolaimus* spp.)、例えば、*B. ロンギカウダツス*(*B. longicaudatus*)； マツの線虫(Pine nematodes)、ブルサフェレンクス属の種(*Bursap*

10

20

30

40

50

helenchus spp.)、例えば、B. リグニコルス(*B. ligniculus*)、B. キシロフィルス(*B. xylophilus*)； リング線虫(Ring nematodes)、クリコネマ属の種(*Criconema spp.*)；クリコネメラ属の種(*Criconemella spp.*)、例えば、C. キセノプラキス(*C. xenoplax*)及びC. オルナタ(*C. ornata*)； 及び、クリコネモイデス属の種(*Criconemoides spp.*)、例えば、クリコネモイデス・インホルミス(*Criconemoides informis*)； メソクリコネマ属の種(*Mesocriconema spp.*)； ナミクキセンチュウ(Stem and bulb nematodes)、ジチレンクス属の種(*Ditylenchus spp.*)、例えば、D. デストルクトル(*D. destructor*)、D. ジップサシ(*D. dipsaci*)； オール線虫(Awl nematodes)、ドリコドルス属の種(*Dolichodorus spp.*)； ラセン線虫(Spiral nematodes)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)； 鞘及び鞘様線虫(Sheath and sheathoid nematodes)、ヘミシクリオホラ属の種(*Hemicycliophora spp.*)及びヘミクリコネモイデス属の種(*Hemicriconemoides spp.*)； ヒルシュマンニエラ属の種(*Hirshmanniella spp.*)； ヤリ線虫(Lance nematodes)、ホブロアイムス属の種(*Hoploaimus spp.*)； ニセネコブ線虫(False rootknot nematodes)、ナコップス属の種(*Nacobbus spp.*)； ハリ線虫(Needle nematodes)、ロンギドルス属の種(*Longidorus spp.*)、例えば、L. エロンガツス(*L. elongatus*)； ネグサレ線虫(*Lesion nematodes*)、プラチレンクス属の種(*Pratylenchus spp.*)、例えば、P. ブラキウルス(*P. brachyurus*)、P. ネグレクトス(*P. neglectus*)、P. ペネトランス(*P. penetrans*)、P. クルビタツス(*P. curvitatus*)、P. ゴオデイ(*P. goodeyi*)； ネモグリ線虫(Burrowing nematodes)、ラドホルス属の種(*Radopholus spp.*)、例えば、R. シミリス(*R. similis*)； ラドホルス属の種(*Rhadopholus spp.*)； ラドフォルス属の種(*Rhodopholus spp.*)； ニセフクロ線虫(*R. eniform nematodes*)、ロチレンクス属の種(*Rotylenchus spp.*)、例えば、R. ロブスツス(*R. robustus*)、R. レニホルミス(*R. reniformis*)； スクテロネマ属の種(*Scutellonema spp.*)； ユミハリセンチュウ(Stubby-root nematode)、トリコドルス属の種(*Trichodorus spp.*)、例えば、T. オブツスス(*T. obtusus*)、T. プリミチブス(*T. primitivus*)； パラトリコドルス属の種(*Paratrichodorus spp.*)、例えば、P. ミノル(*P. minor*)； スタント線虫(*Stunt nematodes*)、チレンコリンクス属の種(*Tylenchorhynchus spp.*)、例えば、T. ク莱イトニ(*T. claytoni*)、T. ズビウス(*T. dubius*)； ミカンネ線虫(*Citrus nematodes*)、チレンクルス属の種(*Tylenchulus spp.*)、例えば、T. セミペネトランス(*T. semipenetrans*)； オオハリセンチュウ(Dagger nematodes)、キシフィネマ属の種(*Xiphinema spp.*)； 及び他の 植物寄生線虫種。

【0191】

等翅目(Isoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、カロテルメス・フラビコリス(*Calotermes flavigollis*)、コプトテルメス属の種(*Coptotermes spp.*)、例えば、C. ホルモサヌス(*C. formosanus*)、C. ゲストロイ(*C. gestroi*)、C. アシナシホルミス(*C. acinaciformis*)； コルニテルメス・クムランス(*Cornitermes cumulans*)、クリプトテルメス属の種(*Cryptotermes spp.*)、例えば、C. ブレビス(*C. brevis*)、C. カビフロンス(*C. cavifrons*)； グロビテルメス・スルフレウス(*Globitermes sulfureus*)、ヘテロテルメス属の種(*Heterotermes spp.*)、例えば、H. アウロイス(*H. aureus*)、H. ロンギセプス(*H. longiceps*)、H. テヌイス(*H. tenuis*)； ロイコテルメス・フラビペス(*Leucotermes flavipes*)、オドントテルメス属の種(*Odontotermes spp.*)、インシシテルメス属の種(*Incisitermes spp.*)、例えば、I. ミノル(*I. minor*)、I. スニデル(*I. Snyder*)； マルギニテルメス・フッバルジ(*Marginitermes hubbardi*)、マストテルメス属の種(*Mastotermes spp.*)、例えば、M. ダルワイニエンシス(*M. darwiniensis*)、ネオカブリテルメス属の種(*Neocapritermes spp.*)、例えば、N. オパクス(*N. opacus*)、N. パルブス(*N. parvus*)； ネオテルメス属の種(*Neoterme spp.*)、プロコルニテルメス属の種(*Procornitermes spp.*)、ゾオテルモプシス属の種(*Zootermopsis spp.*)、例えば、Z. アングスチコリス(*Z. angusticollis*)、Z. ネバデンシス(*Z. nevadensis*)、レティキュリテルメス属の種(*Reticulitermes spp.*)、例えば、R. ヘスペルス(*R. hesperus*)、R. チビアリス(*R. tibialis*)、R. スペラツス(*R. speratus*)、R. フラビペス(*R. flavipes*)、R. グラッセイ(*R. grassei*)、R. ルシフグス(*R. lucifugus*)、R. サントネンシス(*R. santonensis*)、R. ビルギニクス(*R. virginicus*)； テルメス・ナタレ

ンシス(*Termes natalensis*)、

【0192】

ゴキブリ目(Blattaria)の目(order)からの昆虫、例えば、プラッタ属の種(*Blatta* spp.)、例えば、*B. オリエンタリス*(*B. orientalis*)、*B. ラテラリス*(*B. lateralis*)； プラッテラ属の種(*Blattella* spp.)、例えば、*B. アサヒナ*(*B. asahinae*)、*B. ゲルマニカ*(*B. germanica*)； ロイコファエア・マデラエ(*Leucophaea maderae*)、パンクロラ・ニベア(*Panchloria nivea*)、ペリプランエタ属の種(*Periplaneta* spp.)、例えば、*P. アメリカナ*(*P. americana*)、*P. オーストララシア*(*P. australasiae*)、*P. ブルンネア*(*P. brunnea*)、*P. フリッギノサ*(*P. fuligginosa*)、*P. ジャポニカ*(*P. japonica*)； スペラ・ロンギパルバ(*Supella longipalpa*)、パルコブラッタ・ペンシルバニカ(*Parcoblatta pennsylvanica*)、オイリコチス・フロリダナ(*Eurycotis floridana*)、ピクノセルス・スリナメンシス(*Pycnoscelus surinamensis*)。 10

【0193】

ノミ目(Siphonoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、セジオプシルラ・シンプレス(*Cediopsylla simplex*)、セラトフィラス属の種(*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属の種(*Ctenocephalides* spp.)、例えば、*C. フエリス*(*C. felis*)、*C. カニス*(*C. canis*)、ゼノプシラ・ケオピス(*Xenopsylla cheopis*)、ヒトノミ(*Pulex irritans*)、トリコデクテス・カニス(*Trichodectes canis*)、スナノミ(*Tunga penetrans*)、及びヨーロッパネズミノミ(*Nosopsyllus fasciatus*)。 20

【0194】

総尾目(Thysanura)の目(order)からの昆虫、例えば、レピスマ・サッカリナ(*Lepisma saccharina*)、クテノレピスマ・ウルバナ(*Ctenolepisma urbana*)、及びテルモビア・ドメスチカ(*Thermobia domestica*)。 20

【0195】

唇脚綱(Chilopoda)の綱(Class)からの有害生物、例えば、ゲオフィラス属の種(*Geophilus* spp.)、スクティゲラ属の種(*Scutigera* spp.)、例えば、スクティゲラ・コレオプトラタ(*Scutigera coleoptrata*)；

【0196】

倍脚綱(Diplopoda)の綱(Class)からの有害生物、例えば、プラニウルス・グツラツス(*Blaniulus guttulatus*)、ジュルス属の種(*Julus* spp.)、ナルセウス属の種(*Narceus* spp.)。 30

【0197】

コムカデ綱(Symphyla)の綱(Class)からの有害生物、例えば、スクチゲレラ・イマクラタ(*Scutigerella immaculata*)。

【0198】

革翅目(Dermoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、ヨーロッパクギヌキハサミムシ(*Fornicula auricularia*)。

【0199】

トビムシ目(Collembola)の目(order)からの昆虫、例えば、オニキウルス属の種(*Onychiurus* spp.)、例えば、オニキウルス・アルマツス(*Onychiurus armatus*)。 40

【0200】

等脚目(Isopoda)の目(order)からの有害生物、例えば、アルマジリジウム・バルガレ(*Armadillidium vulgare*)、オニスカス・アセルス(*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル(*Porcellio scaber*)。

【0201】

シラミ目(Phthiraptera)の目(order)からの昆虫、例えば、ダマリニア属の種(*Damalinia* spp.)、シラミ属の種(*Pediculus* spp.)、例えば、アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ペジクルス・フマヌス・フマヌス(*Pediculus humanus humanus*)； ケジラミ(*Phthirus pubis*)、ハエマトピヌス属の種(*Haematopinus* spp.)、例えば、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)； リノグナツス属の種(*Linognathus* spp.)、例えば、ウシホソジラミ(*Linognathus* spp.)。 50

thus vituli) ; ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)及びケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*)、トリコデクテス属の種(*Trichodectes spp.*)、

【0202】

式(1)の化合物によって防除し得るさらなる有害生物種の例には、軟体動物門(*Phylum Mollusca*)、双殻類(*Bivalvia*)のクラスから、例えば、カワホトトギスガイ属の種(*Dreissena spp.*)、腹足綱(*Gastropoda*)のクラス、例えば、アリオン属の種(*Arion spp.*)、ビオンファラリア属の種(*Biomphalaria spp.*)、ブリヌス属の種(*Bulinus spp.*)、デロセラス属の種(*Deroceras spp.*)、ガルバ属の種(*Galba spp.*)、リムナエア属の種(*Lymnaea spp.*)、オンコメラニア属の種(*Oncomelania spp.*)、スクミリンゴガイ(*Pomacea canaliculata*)、スクシニア属の種(*Succinea spp.*)、蠕虫(helminths)のクラスから、例えば、アンシロストーマ・デュオデナーレ(*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストーマ・ケイラニクム(*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストーマ・ブラジリエンシス(*Ancylostoma braziliensis*)、アンシロストーマ属の種(*Ancylostoma spp.*)、アスカリス・ルブリコイデス(*Ascaris lubricoides*)、アスカリス属の種(*Ascaris spp.*)、ブルギア・マライ(*Brugia malayi*)、ブルギア・チモリ(*Brugia timori*)、ブノストムム属の種(*Bunostomum spp.*)、カベルチア属の種(*Chabertia spp.*)、クロノルキス属の種(*Clonorchis spp.*)、クーペリア属の種(*Coperia spp.*)、ディクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium spp.*)、ディクチオカウルス・フィラリア(*Dictyocaulus filaria*)、広節裂頭条虫(*Diphyllobothrium latum*)、メジナ虫(*Dracunculus medinensis*)、単包条虫(*Echinococcus granulosus*)、多包条虫(*Echinococcus multilocularis*)、蟇虫(*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属の種(*Faciola spp.*)、ヘモンクス属の種(*Haemonchus spp.*)、例えば、ヘモンクス・コントルタス(*Haemonchus contortus*)、ヘテラキス属の種(*Heterakis spp.*)、小型条虫(*Hymenolepis nana*)、ヒオストロングルス属の種(*Hyostrongylus spp.*)、ロア糸状虫(*Loa Loa*)、ネマトジルス属の種(*Nematodirus spp.*)、エソファゴストム属の種(*Oesophagostomum spp.*)、オピストルキス属の種(*Opisthorchis spp.*)、回旋糸状虫(*Onchocerca volvulus*)、オステルターグ属の種(*Ostertagia spp.*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus spp.*)、スキストソメン属の種(*Schistosomen spp.*)、ストロンギロイデス・フェレボルニ(*Strongyloides fuelleborni*)、ストロンギロイデス・ステルコラリス(*Strongyloides stercoralis*)、ストロンギロイデス属の種(*Strongyloides spp.*)、無鉤条虫(*Taenia saginata*)、有鉤条虫(*Taenia solium*)、旋毛虫(*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ(*Trichinella nativa*)、トリキネラ・プリトビ(*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ(*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・シードプシラリス(*Trichinella pseudospiralis*)、トリコストロングルス属の種(*Trichostrongylus spp.*)、トリクリス・トリクリア(*Trichuris trichuria*)、バンクロフト糸状虫(*Wuchereria bancrofti*)が含まれる。

【0203】

式(1)の化合物によって防除し得る有害生物種のさらなる例には、アニソブリア・アウストリアカ(*Anisoplia austriaca*)、アパメア属の種(*Apamea spp.*)、アウストロアスカ・ヴィリジグリセア(*Austroasca viridigrisea*)、バリオトリップス・ビフォルミス、カエノラブディティス・エレガヌス(*Caenorhabditis elegans*)、セフス属の種(*Cephus spp.*)、セウトトリンクス・ナビ(*Ceutorhynchus napi*)、カエトクネマ・アリヅラ(*Chaetocnema aridula*)、キロ・アウリキリウス(*Chilo auricilius*)、キロ・インジクス(*Chilo indicus*)、キロ・ポリクリスス(*Chilo polychrysus*)、オーストラリアトビバッタ(*Chortiocetes terminifera*)、コブノメイガ(*Cnaphalocroci medicinalis*)、クナファロクロシス属の種(*Cnaphalocrosis spp.*)、オオアメリカモンキチョウ(*Colias eurytheme*)、コロプス属の種(*Collops spp.*)、コルニテルメス・クムランス(*Cornitermes cumulans*)、クレオンチアデス属の種(*Creontiades spp.*)、シクロセファラ属の種(*Cyclocephala spp.*)、ダルブルス・マイジス(*Dalbulus maidis*)、ノハラナメクジ(*Deraceras reticulatum*)、ジアトレア・サッカラリス(*Diatrea saccharalis*)、ジケロップス・フルカツス(*Dichelops furcatus*)、ディクラディスパ・アルミゲラ(*Dicladispa armigera*)、ジロボデルス属の種(*Diloboderus*

10

20

30

40

50

spp.)、例えば、アブデルスツノカブト(*Diloboderus abderus*)、エデッサ属の種(*Edessa* spp.)、エピノチア属の種(*Epinotia* spp.)、アリ科(*Formicidae*)、ゲオコリス属の種(*Geocoris* spp.)、グロビテルメス・スルフレウス(*Globitermes sulfureus*)、ケラ科(*Gryllotalpidae*)、ハロチデウス・デストルクトル(*Halotydeus destructor*)、ヒブノデス・ビコロル(*Hipnodes bicolor*)、トウヨウイネクキミギワバエ(*Hydrellia philippina*)、ジュルス属の種(*Julus* spp.)、ラオデルファクス属の種(*Laodelphax* spp.)、レプトコルシア・アクタ(*Leptocorsia acuta*)、レプトコルシア・オラトリウス(*Leptocorsia oratorius*)、リオゲニス・フスクス(*Liogenys fuscus*)、ルシリア属の種(*Lucilia* spp.)、リオゲニス・フスクス(*Lyogenys fuscus*)、マハナルヴァ属の種(*Mahanarva* spp.)、マラデラ・マトリダ(*Maladera matrida*)、マラスミア属の種(*Marasmia* spp.)、マストテルメス属の種(*Mastotermes* spp.)、コナカイガラムシ(Mealybugs)、メガセリス亜種(*Megascelis* spp.)、メタマシウス・ヘミプテルス(*Metamasius hemipterus*)、ミクロテカ属の種(*Microtheca* spp.)、モシス・ラチペス(*Mocis latipes*)、ムルガンシア属の種(*Murgantia* spp.)、アワヨトウ(*Mythimna separata*)、ネオカプリテルメス・オパクス(*Neocapritermes opacus*)、ネオカプリテルメス・パルブス(*Neocapritermes parvus*)、ネオメガロトマス属の種(*Neomegalotomus* spp.)、ネオテルメス属の種(*Neotermes* spp.)、ニンフラ・デブンクタリス(*Nymphula depunctalis*)、オエバルス・プグナキス(*Oebalus pugnax*)、オルセオリア属の種(*Orseolia* spp.)、例えば、オルセオリア・オリゼ(*Orseolia oryzae*)、オキシカラエヌス・ヒアリニペニス(*Oxycaraenus hyalinipennis*)、ブルシア属の種(*Plusia* spp.)、スクミリンゴガイ(*Pomacea canaliculata*)、プロコルニテルメス亜種(*Procornitermes* spp.)、プロコルニテルメス・トリアシフェル(*Procornitermes triacifer*)、ブシロイデス属の種(*Psyllioides* spp.)、ラチブルシア属の種(*Rachiplusia* spp.)、ラドフォルス属の種(*Rhodopholus* spp.)、スカプトコリス・カスタネア(*Scaptocoris castanea*)、スカプトコリス属の種(*Scaptocoris* spp.)、スキルポファガ属の種(*Scirpophaga* spp.)、例えば、サンカメイチュウ((サンカメイガ) *Scirpophaga incertulas*)、スキルポファガ・イノタタ(*Scirpophaga innotata*)、スコチノファラ属の種(*Scotinophara* spp.)、例えば、スコティノファラ・コアルクタタ(*Scotinophara coarctata*)、セサミア属の種(*Sesamia* spp.)、例えば、イネヨトウ(*Sesamia inferens*)、セジロウンカ(*Sogaella frucifera*)、アカカミアリ(*Solenapsis geminata*)、スピシスチルス属の種(*Spissistilus* spp.)、ストークボーラー(*Stalk borer*)、イネアザミウマ(*Stenchaetothrips biformis*)、ステネオタルソネムス・スピニキ(*Steneotarsonemus spinki*)、シレブタ・デロガタ(*Sylepta derogata*)、テレヒン・リクス(*Telechin licus*)、トリコストロンギルス属の種(*Trichostrongylus* spp.)が含まれる。

【 0 2 0 4 】

本発明の化合物(それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む)は、特に、昆虫、好ましくは吸汁性若しくは刺す及び咀嚼性及びかみつきの昆虫、例えば、鱗翅目(*Lepidoptera*)、鞘翅目(*Coleoptera*)及び半翅目(*Hemiptera*)の属の昆虫等、特に鱗翅目、鞘翅目及び半翅目(true bug)を防除するのに有用である。

【 0 2 0 5 】

本発明の化合物(それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む)はさらに、総翅目(*Thysanoptera*)、双翅目(*Diptera*)(とりわけハエ、蚊)、膜翅目(*Hymenoptera*)(とりわけアリ)及び等翅目(*Isoptera*)(とりわけシロアリ)の目の昆虫を防除するのに有用である。

【 0 2 0 6 】

本発明の化合物(それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含む)は特に、鱗翅目及び鞘翅目の目の昆虫を防除するのに有用である。

【 0 2 0 7 】

本発明はまた、助剤(auxiliary)、及び本発明による少なくとも1種の化合物Iを含む農薬組成物にも関する。

【 0 2 0 8 】

農薬組成物は、殺有害生物有効量の化合物Iを含む。「有効量」という用語は、栽培植

10

20

30

40

50

物に対する有害な菌を防除するため、又は材料の保護において十分であり、且つ処理された植物に実質的な損害をもたらさない、組成物又は化合物Iの量を意味する。こうした量は、広い範囲内で変えることができ、防除すべき種、処理される栽培植物又は材料、気候条件及び使用される特定の化合物I等の様々な要因に依存する。

【0209】

化合物I、それらのN-オキシド及び塩は、慣用的なタイプの農薬組成物、例えば、液剤(solution)、エマルション剤(emulsion)、懸濁剤(suspension)、粉剤(dust)、散剤(powder)、ペースト剤(paste)、粒剤(granule)、圧縮剤(pressing)、カプセル剤(capsule)、及びそれらの混合物に変換することができる。組成物のタイプの例は、懸濁剤(例えば、SC、OD、FS)、乳剤(emulsifiable concentrate)(例えば、EC)、エマルション剤(例えば、EW、E0、ES、ME)、カプセル剤(例えば、CS、ZC)、ペースト剤、パステル剤(pastille)、水和剤若しくは粉剤(wettable powder or dust)(例えば、WP、SP、WS、DP、DS)、圧縮剤(例えば、BR、TB、DT)、粒剤(例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫性物品(例えば、LN)、及び種子等の植物繁殖材料を処理するためのゲル製剤(例えば、GF)である。これら、及びさらなる組成物のタイプは「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」(Technical Monograph No.2、第6版、2008年5月、CropLife International社)において定義されている。

【0210】

組成物は、Mollet及びGrubemann(Formulation technology、Wiley VCH、Weinheim、2001年)、又はKnowles(New developments in crop protection product formulation、Agrow Reports DS243、T&F Informa、London、2005年)より記載されているもの等の公知の方法で調製される。

【0211】

適切な補助剤の例は、溶媒、液体担体、固体担体又は充てん剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤、アジュバント、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、粘着剤、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食刺激物質、相溶剤、殺細菌剤、抗凍結剤、抗発泡剤、着色剤、粘着付与剤及び結合剤である。

【0212】

適切な溶媒及び液体担体は、水及び有機溶媒、例えば、中～高沸点の鉱物油留分(例えば灯油、ディーゼル油)、植物又は動物由来の油、脂肪族炭化水素、環式炭化水素及び芳香族炭化水素(例えば、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン)、アルコール(例えば、エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサンノール)、グリコール、DMSO、ケトン(例えば、シクロヘキサン)、エステル(例えば、乳酸エステル、炭酸エステル、脂肪酸エステル、ガンマ-ブチロラクトン)、脂肪酸、ホスホネート、アミン、アミド(例えば、N-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミド)、及びそれらの混合物である。

【0213】

適切な固体担体又は充てん剤は、鉱物土類(例えば、シリケート、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰石、石灰、チョーク、粘土(クレイ)、ドロマイド、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム)、多糖類粉末(例えば、セルロース、デンプン)、肥料(例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素)、植物由来の産物(例えば、穀粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉)、及びそれらの混合物である。

【0214】

適切な界面活性剤は表面活性化合物、例えばアニオン性、カチオン性、非イオン性及び両性の界面活性剤、ブロックポリマー、多価電解質、及びそれらの混合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又はアジュバントとして使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's、Vol.1: Emulsifiers & De-tergents、McCutcheon's Directories、Glen Rock、USA、2008年(国際版又は北米版)に列挙されている。

10

20

30

40

50

【0215】

適切なアニオン性界面活性剤は、スルホネート、サルフェート、ホスフェート、カルボキシレートの、アルカリ、アルカリ土類又はアンモニウムの塩、及びこれらの混合物である。スルホネートの例は、アルキルアリールスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファ-オレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸及び油のスルホネート、エトキシ化アルキルフェノールのスルホネート、アルコキシ化アリールフェノールのスルホネート、縮合ナフタレンのスルホネート、ドデシルベンゼン及びトリデシルベンゼンのスルホネート、ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホネート、スルホスクシネート又はスルホスクシナメートである。サルフェートの例は、脂肪酸及び油のサルフェート、エトキシ化アルキルフェノールのサルフェート、アルコールのサルフェート、エトキシ化アルコールのサルフェート、又は脂肪酸エステルのサルフェートである。ホスフェートの例は、リン酸エステルである。カルボキシレートの例は、アルキルカルボキシレート、及びカルボキシル化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレートである。

【0216】

適切な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミンオキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、ポリマー界面活性剤、及びこれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1~50当量でアルコキシ化されたアルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸又は脂肪酸エステル等の化合物である。エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシドは、アルコキシ化のために採用することができ、好ましくはエチレンオキシドであってよい。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセロールエステル又はモノグリセリドである。糖ベースの界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロース及びグルコースエステル又はアルキルポリグルコシドである。ポリマー界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、又はビニルアセテートのホモポリマー又はコポリマーである。

【0217】

適切なカチオン性界面活性剤は、第4級界面活性剤、例えば1つ又は2つの疎水基を有する第四級アンモニウム化合物、又は長鎖の第一級アミンの塩である。適切な両性の界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。適切なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B若しくはA-B-Aタイプのブロックポリマー、又はアルカノール、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドを含むA-B-Cタイプのブロックポリマーである。適切な多価電解質は、ポリ酸又はポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリ酸くし型ポリマー又はポリアクリル酸のアルカリ塩である。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

【0218】

適切な補助剤は、無視できる位の殺有害生物活性を有し、又は殺有害生物活性そのものさえも有さず、標的上で化合物Iの生物学的性能を改善する化合物である。例として、界面活性剤、鉱物又は植物油、及び他の助剤がある。さらなる例は、Knowles, *Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006年、第5章に列挙されている。*

【0219】

適切な増粘剤は、多糖類(例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース)、無機質粘土(有機的に修飾されている又は修飾されていない)、ポリカルボキシレート、及びシリケートである。

【0220】

適切な殺細菌剤は、プロノポール、並びにアルキルイソチアゾリノン及びベンゾイソチアゾリノン等のイソチアゾリノン誘導体である。

【0221】

適切な抗凍結剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素及びグリセリンである。

10

20

30

40

50

【0222】

適切な抗発泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、及び脂肪酸の塩である。

【0223】

適切な着色剤(例えば、赤色、青色、又は緑色)は、水溶性の低い顔料、及び水溶性色素である。例は、無機の着色剤(例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸鉄)、及び有機着色剤(例えば、アリザリン着色剤、アゾ着色剤、及びフタロシアニン着色剤)である。

【0224】

適切な粘着付与剤又は結合剤は、ポリビニルピロドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物又は合成ワックス、及びセルロースエーテルである。

10

【0225】

組成物のタイプ及びそれらの調製に関する例は以下の通りである。

【0226】

i)水溶性剤(water-soluble concentrate)(SL、LS)

10~60重量%の本発明による化合物I、及び5~15重量%の湿潤剤(例えば、アルコールアルコキシレート)を水、及び/又は水溶性溶媒(例えば、アルコール)に溶解し、100重量%にする。活性物質は、水で希釈すると溶解する。

【0227】

ii)分散性剤(Dispersible concentrate)(DC)

20

5~25重量%の本発明による化合物I、及び1~10重量%の分散剤(例えば、ポリビニルピロドン)を有機溶媒(例えば、シクロヘキサン)に溶解し、100重量%にする。水で希釈すると分散液が得られる。

【0228】

iii)乳剤(emulsifiable concentrate)(EC)

15~70重量%の本発明による化合物I、及び5~10重量%の乳化剤(例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート)を水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解し、100重量%にする。水で希釈するとエマルションが得られる。

【0229】

iv)エマルション剤(emulsion)(EW、EO、ES)

30

5~40重量%の本発明による化合物I、及び1~10重量%の乳化剤(例えば、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム及びヒマシ油エトキシレート)を20~40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解する。この混合物を、乳化装置により水に導入して100重量%にし、均一なエマルションにする。水で希釈するとエマルションが得られる。

【0230】

v)懸濁剤(suspension)(SC、OD、FS)

攪拌したボールミル内で、20~60重量%の本発明による化合物Iを、2~10重量%の分散剤及び湿潤剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート)、0.1~2重量%の増粘剤(例えば、キサンタンガム)、及び100重量%になる水を加えて細碎すると、活性物質の微細懸濁液が得られる。水で希釈すると、活性物質の安定な懸濁液が得られる。FSタイプの組成物に関すると、最大40重量%の結合剤(例えば、ポリビニルアルコール)が添加される。

40

【0231】

vi)水分散性粒剤(water-dispersible granule)及び水溶性粒剤(water-soluble granule)(WG、SG)

50~80重量%の本発明による化合物Iを100重量%になる分散剤及び湿潤剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム及びアルコールエトキシレート)を添加して微粉碎し、専用の装置(例えば、押出器、噴霧塔、流動床)により水分散性粒剤又は水溶性粒剤として調製する。水で希釈すると活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

【0232】

50

vii) 水分散性散剤(water-dispersible powder)及び水溶性散剤(water-soluble powder)(WP、SP、WS)

ローターステーターミル内で、50～80重量%の本発明による化合物Iに1～5重量%の分散剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム)、1～3重量%の湿潤剤(例えば、アルコールエトキシレート)、及び100重量%になる固体担体(例えば、シリカゲル)を添加して粉碎する。水で希釈すると活性物質の安定な分散液又は溶液が得られる。

【0233】

viii) ゲル剤(gel)(GW、GF)

攪拌したボールミル内で、5～25重量%の本発明による化合物Iを、3～10重量%の分散剤(例えば、リグノスルホン酸ナトリウム)、1～5重量%の増粘剤(例えば、カルボキシメチルセルロース)、及び100重量%になる水を添加して細碎すると、活性物質の微細懸濁液が得られる。水で希釈すると活性物質の安定な懸濁液が得られる。

【0234】

ix)マイクロエマルション剤(microemulsion)(ME)

5～20重量%の本発明による化合物Iを5～30重量%の有機溶媒ブレンド(例えば、脂肪酸ジメチルアミド及びシクロヘキサン)、10～25重量%の界面活性剤ブレンド(例えば、アルコールエトキシレート及びアリールフェノールエトキシレート)、及び100重量%になる水に加える。この混合物を1時間攪拌すると、熱力学的に安定したマイクロエマルションを自然に生じる。

【0235】

x)マイクロカプセル剤(microcapsule)(CS)

5～50重量%の本発明による化合物I、0～40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、2～15重量%のアクリルモノマー(例えば、メタクリル酸メチル、メタクリル酸、及びジ又はトリアクリレート)を含む油相を保護コロイド(例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散させる。ラジカル開始剤により開始されるラジカル重合により、ポリ(メタ)アクリレートのマイクロカプセルが形成する。あるいは、5～50重量%の本発明による化合物I、0～40重量%の水不溶性有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)、及びイソシアネートモノマー(例えば、ジフェニルメテン-4,4'-ジイソシアネート)を含む油相を保護コロイド(例えば、ポリビニルアルコール)の水溶液に分散させる。ポリアミン(例えば、ヘキサメチレンジアミン)の添加により、ポリ尿素のマイクロカプセルが形成する。モノマーは、合計1～10重量%になる。重量%は、CS組成物の総量に関する。

【0236】

xi)散粉性散剤(dustable powder)(DP、DS)

1～10重量%の本発明による化合物Iを微粉碎し、100重量%になる固体担体(例えば、微粉碎カオリン)と一緒に十分混合する。

【0237】

xii)粒剤(granule)(GR、FG)

0.5～30重量%の本発明による化合物Iを微粉碎し、100重量%になる固体担体(例えば、シリケート)と一緒にする。顆粒は、押し出し、スプレードライ、又は流動床により得られる。

【0238】

xiii)超微量溶液剤(ultra-low volume liquid)(UL)

1～50重量%の本発明による化合物Iを有機溶媒(例えば、芳香族炭化水素)に溶解し、100重量%にする。

【0239】

組成物タイプi)～xiii)は、0.1～1重量%の殺細菌剤、5～15重量%の抗凍結剤、0.1～1重量%の抗発泡剤、及び0.1～1重量%の着色剤等のさらなる助剤を場合により含んでもよい。

【0240】

農薬組成物は、一般に、0.01～95重量%、好ましくは0.1～90重量%、特に0.5～75重量%の活性物質を含む。これらの活性物質は、90%～100%、好ましくは95%～100%(NMRスペクト

10

20

30

40

50

ルによる)の純度で使用される。

【0241】

植物繁殖材料(特に、種子)を処理するためには、種子処理用液剤(LS)、サスボエマルション剤(Suspoemulsion)(SE)、フロアブル剤(flowable concentrate)(FS)、乾燥処理用粉剤(DS)、スラリー処理用分散性散剤(WS)、水溶性散剤(SS)、エマルション剤(ES)、乳剤(EC)、及びゲル剤(GF)を一般に使用する。対象の本組成物は、2~10倍希釈した後、即時使用可能な調製物中に0.01~60重量%、好ましくは0.1~40重量%の活性物質濃度をもたらす。施用は、播種前又は播種中に実施することができる。化合物I及びその組成物をそれぞれ、植物繁殖材料、とりわけ種子に施用する方法には、繁殖材料に粉衣する方法(dressing)、繁殖材料をコーティングする方法(coating)、繁殖材料をペレット化する方法(pelleting)、繁殖材料に散粉する方法(dusting)、繁殖材料を浸漬する方法(soaking)、及び繁殖材料に畝間施用する方法(in-furrow application)が含まれる。好ましくは、化合物I又はその組成物はそれぞれ、発芽が誘発されないような方法によって、例えば種子粉衣、種子ペレット化、種子コーティング及び種子への散粉によって、植物繁殖材料に施用される。

【0242】

植物保護において使用する場合、施用される活性物質の量は、所望の効果の種類に応じて、1ha当たり0.001~2kgであり、好ましくは1ha当たり0.005~2kgであり、より好ましくは1ha当たり0.05~0.9kgであり、特に1ha当たり0.1~0.75kgである。

【0243】

種子等の植物繁殖材料の処理(例えば、種子に散粉する、コーティングする、又は種子を浸漬する(drenching))において、植物繁殖材料(好ましくは、種子)100キログラム当たり、0.1~1000g、好ましくは1~1000g、より好ましくは1~100g、最も好ましくは5~100gの量の活性物質が一般に必要である。

【0244】

材料又は貯蔵生産物の保護において使用する場合、施用される活性物質の量は、施用領域の種類及び所望の効果に依存する。材料の保護において慣用的に施用される量は、処理される材料1立方メートル当たり、0.001g~2kg、好ましくは0.005g~1kgの活性物質である。

【0245】

様々なタイプの油、湿潤剤、補助剤、肥料、又は微量栄養素、及びさらなる殺有害生物剤(例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、毒性緩和剤)を、活性物質若しくはそれらを含む組成物にプレミックスとして添加してもよく、又は適宜、使用直前になって初めて添加してもよい(タンクミックス)。これらの薬剤は、本発明による組成物と、1:100~100:1、好ましくは1:10~10:1の重量比で混合することができる。

【0246】

使用者は、本発明による組成物を、通常、事前に投与量を設定できる(predosage)デバイス、背負い式噴霧器、噴霧タンク、噴霧飛行機、又は灌漑システムから施用する。通常、農薬組成物は、水、緩衝剤、及び/又はさらなる助剤を使用して所望の施用濃度に構成され、こうして本発明による即時使用可能な噴霧用液体又は農薬組成物が得られる。通常、農業的に有用な領域1ヘクタール当たり、20~2000リットル、好ましくは50~400リットルの即時使用可能な噴霧用液体が施用される。

【0247】

一実施形態によれば、キットオブパーティ、又は二成分若しくは三成分混合物の部分等の本発明による組成物の個々の成分を、使用者自身が噴霧タンク中で混合してもよく、さらなる助剤を適宜加えてもよい。

【0248】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の個々の成分又は一部事前混合済み成分のいずれか、例えば、化合物I及び/又はグループM若しくはF)(以下を参照されたい)からの活性物質を含む成分を、使用者が噴霧タンク中で混合してもよく、さらなる補助剤及び添

10

20

30

40

50

加剤を適宜加えてよい。

【0249】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の個々の成分又は一部事前混合済み成分のいずれか、例えば、化合物I及び/又はグループM.1～M.UN.X若しくはF.I～F.XIIIからの活性物質を含む成分を、一緒に(例えば、タンク混合した後)又は連続して施用することができる。

【0250】

本発明による化合物と一緒に使用することができ、有望な相乗作用効果が生み出され得る、殺虫剤抵抗性対策委員会(IRAC)の作用様式による分類によりグループ化され、番号付けされた殺有害生物剤の以下の一覧Mは、可能な組合せを例示することを意図するものであるが、いかなる制限も課すことを意図するものではない：

【0251】

M.1 アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害剤： M.1A カルバメート類(carbamates)のクラスから、例えば、アルジカルブ(aldicarb)、アラニカルブ(alanycarb)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ブトカルボキシム(butocarboxim)、ブトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofuran)、カルボスルファン(carbosulfan)、エチオフェンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、ホルメタネート(formetanate)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocarb)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、メトルカルブ(metolcarb)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロポクスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオファノックス(thiofanox)、トリメタカルブ(trimethacarb)、XMC、キシリルカルブ(xylylcarb)及びトリアザメート(triazamate)；又はM.1B 有機リン酸類のクラスから、例えば、アセフェート(acephate)、アザメチホス(azamethiphos)、アジンホス-エチル(azinphos-ethyl)、アジンホスマチル(azinphosmethyl)、カズサホス(cadusafos)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルメホス(chlormephos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クマホス(coumaphos)、シアノホス(cyanophos)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、ダイアジノン(diazinon)、ジクロルホス(diclorvos)/DDVP、ジクロトホス(dicrotophos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジスルホトン(disulfoton)、EPN、エチオン(ethion)、エトプロホス(ethoprophos)、ファムフル(famphur)、フェナミホス(fenamiphos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ヘプテノホス(heptenophos)、イミシアホス(imicyafos)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロピルO-(メトキシアミノチオ-ホスホリル)サリチレート(isopropyl O-(methoxyaminotio-phosphoryl)salicylate)、イソキサチオン(isoxathion)、マラチオン(malathion)、メカルバム(mecarbam)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレド(naled)、オメトエート(omethoate)、オキシデメトン-メチル(oxydemeton-methyl)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、フェントエート(phentoate)、フォレート(phorate)、フォサロン(phosalone)、フォスマット(phosmet)、フォスファミド(phosphamidon)、フォキシム(phoxim)、ピリミホス-メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profenofos)、プロペタンホス(propetamphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、キナルホス(quinalphos)、スルホテップ(sulfotep)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テメホス(temephos)、テルブホス(terbufos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、チオメトン(thiometon)、トリアゾホス(triazophos)、トリクロルホン(trichlorfon)及びバミドチオン(vamidothion)；

【0252】

M.2. GABA依存性クロライドチャネルアンタゴニスト、例えば、：M.2Aシクロジエン有機塩素化合物、例えば、エンドスルファン(endosulfan)又はクロルデン(chlordane)；又はM.2B フィプロール類(fiproles)(フェニルピラゾール類(phenylpyrazoles))、例えば、エ

10

20

30

40

50

チプロール(ethiprole)、フィプロニル(fipronil)、フルフィプロール(flufiprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)及びピリプロール(pyriproxyfen)；

【0253】

M.3 ナトリウムチャネル調節因子、M.3A ピレスロイド類(pyrethroids)のクラスから、例えば、アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、d-cis-transアレスリン(d-cis-trans allethrin)、d-transアレスリン(d-trans allethrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、ビオアレスリン(bioallethrin)、ビオアレスリンS-シクロペンテニル(bioallethrin S-cyclopentenyl)、バイオレスメトリン(bioresmethrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマ-シハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シペルメトリン(cypermethrin)、アルファ-シペルメトリン(alpha-cypermethrin)、ベータ-シペルメトリン(beta-cypermethrin)、シータ-シペルメトリン(theta-cypermethrin)、ゼータ-シペルメトリン(zeta-cypermethrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エンペントリン(empenthrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(etofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucythrinate)、フルメトリン(flumethrin)、タウ-フルバリネート(tau-fluvalinate)、ハルフェンプロックス(halfenprox)、ヘプタフルトリン(heptafluthrin)、イミプロトリン(imiprothrin)、メペルフルトリン(meperfluthrin)、メトフルトリン(metofluthrin)、モンフルオロトリン(momfluorothrin)、ペルメトリン(permethrin)、フェノトリン(phenothrin)、プラレトリン(prallethrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ピレトリン(pyrethrin)(除虫菊(pyrethrum))、レスメトリン(resmethrin)、シラフルオフェン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、トラロメトリン(tralomethrin)及びトランスフルトリン(transfluthrin)；又はM.3B ナトリウムチャネル調節因子、例えば、DDT又はメトキシクロル(methoxychlor)；

【0254】

M.4 ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト(nAChR)、M.4A ネオニコチノイド類(neonicotinoids)のクラスから、例えば、アセタミプリド(acetamiprid)、クロチアニジン(clothianidin)、シクロキサブリド(cycloxaclid)、ジノテフラン(dinotefuran)、イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、チアクロプリド(thiacloprid)及びチアメトキサム(thiamethoxam)；又は化合物M.4A.2：(2E)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-N'-ニトロ-2-ペンチリデンヒドロジンカルボキシミドアミド；又はM4.A.3：1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-7-メチル-8-ニトロ-5-プロポキシ-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジン；又はM.4B ニコチンのクラスから；

【0255】

M.5 ニコチン性アセチルコリン受容体アロステリック活性化剤、スピノシン類(spinosins)のクラスから、

例えば、スピノサド(spinosad)又はスピネトラム(spinetoram)；

【0256】

M.6 クロライドチャネル活性化剤、アベルメクチン類(avermectins)及びミルベマイシン類(milbemycins)のクラスから、例えば、アバメクチン(abamectin)、エマメクチン安息香酸塩(emamectin benzoate)、イベルメクチン(ivermectin)、レピメクチン(lepimectin)又はミルベメクチン(milbemectin)；

【0257】

M.7 幼若ホルモン模倣物(Juvenile hormone mimics)、例えば、M.7A 幼若ホルモン類縁体(juvenile hormone analogues)、例えば、ハイドロプレン(hydroprene)、キノプレン(kinoprene)及びメトプレン(methoprene)；又はその他のもの、例えば、M.7B フェノキシカルブ(fenoxy carb)又はM.7C ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)；

【0258】

10

20

30

40

50

M.8 雜多な非特異的(多部位)阻害剤、例えば、M.8A アルキルハロゲン化物、例えば、臭化メチル及び他のアルキルハロゲン化物、又はM.8B クロルピクリン(chloropicrin)、又はM.8C フッ化スルフリル(sulfuryl fluoride)、又はM.8D ホウ砂(borax)、又はM.8E 吐酒石(tartar emetic)；

【0259】

M.9 選択的同翅類摂食遮断剤、例えば、M.9B ピメトロジン(pymetrozine)、又はM.9C フロニカミド(flonicamid)；

【0260】

M.10 ダニ成長阻害剤、例えば、M.10A クロフェンテジン(clofentezine)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)及びジフロビダジン(diflovidazin)、又はM.10B エトキサゾール(etoxazole)；

【0261】

M.11 昆虫の中腸膜に対する微生物攪乱剤、例えば、バチルス・チューリングエンシス(bacillus thuringiensis)又はバチルス・スファエリクス(bacillus sphaericus)及びそれらが作り出す殺虫性タンパク質、例えば、バチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシス(bacillus thuringiensis subsp. israelensis)、バチルス・スファエリクス(bacillus sphaericus)、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ(bacillus thuringiensis subsp. aizawai)、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキー(bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)及びバチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス(bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis)、又はBt産物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb及びCry34/35Ab1；

【0262】

M.12 ミトコンドリアATPシンターゼ阻害剤、例えば、M.12A ジアフェンチウロン(diafen thiuron)、又はM.12B 有機スズ殺ダニ剤、例えば、アゾシクロチン(azocyclotin)、シヘキサチン(cyhexatin)又はフェンブタチンオキシド(fenbutatin oxide)、又はM.12C プロパルギット(propargite)、又はM.12D テトラジホン(tetradifon)；

【0263】

M.13 プロトン勾配の攪乱による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナビル(chlorfenapyr)、DNOC又はスルフルラミド(sulfluramid)；

【0264】

M.14 ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)チャネル遮断剤、例えば、ネライストキシン類縁体(nereistoxin analogues)、例えば、ベンスルタップ(bensultap)、カルタップ塩酸塩(cartap hydrochloride)、チオシクラム(thiocyclam)又はチオスルタップナトリウム(thiosultap sodium)；

【0265】

M.15 キチン生合成阻害剤0型、例えば、ベンゾイルウレア類(benzoylureas)、例えば、ビストリフルロン(bistrifluron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフェヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)又はトリフルムロン(triflumuron)；

【0266】

M.16 キチン生合成阻害剤1型、例えば、ブプロフェジン(buprofezin)；

【0267】

M.17 脱皮攪乱剤、双翅類(Dipteran)、例えば、シロマジン(cyromazine)；

【0268】

M.18 エクジソン受容体アゴニスト、例えば、ジアシルヒドラジン類(diacylhydrazines)、例えば、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、フフェノジド(fufenozide)又はクロマフェノジド(chromafenozide)；

10

20

30

40

50

【0269】

M.19 オクトパミン受容体アゴニスト、例えば、アミトラズ(amitraz)；

【0270】

M.20 ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害剤、例えば、M.20A ヒドラメチルノン(hydramethylnon)、又はM.20B アセキノシル(acequinocyl)、又はM.20C フルアクリピリム(fluacrypyrim)；

【0271】

M.21 ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害剤、例えば、M.21A METI殺ダニ剤及び殺虫剤、例えば、フェナザキン(fenazaquin)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリダベン(pyridaben)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)又はトルフェンピラド(tolfenpyrad)、又はM.21B ロテノン(rotenone)；

【0272】

M.22 電位依存性ナトリウムチャネル遮断剤、例えば、M.22A インドキサカルブ(indoxacarb)、又はM.22B メタフルミゾン(metaflumizone)、又はM.22B.1: 2-[2-(4-シアノフェニル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]-N-[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-ヒドラジンカルボキサミド又はM.22B.2: N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-2-[(4-クロロフェニル)[4-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]フェニル]メチレン]-ヒドラジンカルボキサミド；

【0273】

M.23 アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロン酸及びテトラミン酸の誘導体、例えば、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフェン(spiromesifen)又はスピロテトラマト(spirotetramat)；

【0274】

M.24 ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害剤、例えば、M.24A ホスフィン(phosphine)、例えば、リン化アルミニウム(aluminium phosphide)、リン化カルシウム(calcium phosphide)、ホスフィン(phosphine)又はリン化亜鉛(zinc phosphide)、又はM.24B シアニド(cyanide)；

【0275】

M.25 ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害剤、例えば、ベータ-ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェン(cyenopyrafen)又はシフルメトフェン(cyflumetofen)；

【0276】

M.28 リアノジン受容体調節因子、ジアミド類(diamides)のクラスから、例えば、フルベンジアミド(flubendiamide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)(ryanaxypyr(登録商標))、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)(cyazypyr(登録商標))、テトラニリプロール(tetraniliprole)、又はフタルアミド化合物(phthalamide compounds)M.28.1: (R)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド及びM.28.2: (S)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、又は化合物M.28.3: 3-ブロモ-N-{2-ブロモ-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(提案されたISO名: シクラニリプロール(cyclaniliprole))、又は化合物M.28.4: メチル-2-[3,5-ジブロモ-2-({[3-ブロモ-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル]-1,2-ジメチルヒドラジンカルボキシレート；又はM.28.5a) ~ M.28.5d) 及びM.28.5h) ~ M.28.5l) から選択される化合物: M.28.5a) N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；M.28.5b) N-[4-クロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；M.28.5c) N-[4-クロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-

10

20

30

40

50

クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；M.28.5d) N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；M.28.5h) N-[4,6-ジブロモ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド；M.28.5i) N-[2-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-ブロモ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；M.28.5j) 3-クロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2,4-ジクロロ-6-[(1-シアノ-1-メチルエチル)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；M.28.5k) 3-ブロモ-N-[2,4-ジクロロ-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-1-(3,5-ジクロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；M.28.5l) N-[4-クロロ-2-[(1,1-ジメチルエチル)アミノ]カルボニル]-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；又はM.28.6：シハロジアミド(cyhalodiamide)から選択される化合物；又は

【0277】

M.29. 作用機序が未知又ははっきりしていない殺虫活性化合物、例えば、アフィドピロペン(afidopyropen)、アフォキソラネル(afoxolaner)、アザジラクチン(azadirachtin)、アミドフルメット(amidoflumet)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ビフェナゼート(bifenzazate)、ブロフラニリド(broflanilide)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、キノメチオネート(chinomethionat)、クリオライト(cryolite)、ジクロロメゾチアズ(dicloromethiaz)、ジコホル(dicofol)、フルフェネリム(flufennerim)、フロメトキン(flometoquin)、フルエンスルホン(fluensulfone)、フルヘキサホン(fluhexafon)、フルオピラム(fluopyram)、フルピラジフロン(flupyradifurone)、フルララネル(fluralaner)、メトキサジアゾン(metoxadiazone)、ピペロニルブトキシド(piperonyl butoxide)、ピフルブミド(pyflubumide)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、スルホキサフロル(sulfoxaflor)、チオキサザフェン(tioxazafen)、トリフルメゾピリム(triflumezopyrim)、又は化合物

【0278】

M.29.3：11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジスピロ[4.2.4.2]-テトラデカ-11-エン-10-オン、又は化合物

【0279】

M.29.4：3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルビフェニル-3-イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2-オン、又は化合物

【0280】

M.29.5：1-[2-フルオロ-4-メチル-5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スルフィニル]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-アミン、又はバチルス・フィルムス(Bacillus firmus)(Votivo、I-1582)に基づく活性剤；又は

【0281】

M.29.6の群から選択される化合物、ここで、化合物は、M.29.6a)～M.29.6k)から選択される：M.29.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド；M.29.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-5-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド；M.29.6c) (E/Z)-2,2,2-トリフルオロ-N-[1-[(6-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]アセトアミド；M.29.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-ブロモ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド；M.29.6e) (E/Z)-N-[1-[1-(6-クロロ-3-ピリジル)エチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド；M.29.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド；M.29.6g) (E/Z)-2-クロロ-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド；M.29.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-クロロピリミジン-5-イル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド；M.29.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-

2-ピリジリデン]-2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-プロパンアミド.) ; M.29.6j) N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-チオアセトアミド ; 又は化合物M.29.6k) N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-N'-イソプロピル-アセトアミジン ; 又は

【0282】

M.29.8: フルアザインドリジン(fluazaindolizine) ; 又は

【0283】

M.29.9.a) 4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(1-オキソチエタン-3-イル)ベンズアミド ; 又はM.29.9.b) : フルキサメタミド(fluxametamide) ; 又は

【0284】

M.29.10: 5-[3-[2,6-ジクロロ-4-(3,3-ジクロロアリルオキシ)フェノキシ]プロポキシ]-1H-ピラゾール ; 又は

【0285】

M.UN.11の群から選択される化合物、ここで、化合物は、M.UN.11b) ~ M.UN.11p)から選択される : M.29.11.b) 3-(ベンゾイルメチルアミノ)-N-[2-プロモ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド ; M.29.11.c) 3-(ベンゾイルメチルアミノ)-2-フルオロ-N-[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベンズアミド ; M.29.11.d) N-[3-[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-N-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.e) N-[3-[[2-プロモ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-2-フルオロフェニル]-4-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.f) 4-フルオロ-N-[2-フルオロ-3-[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-N-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.g) 3-フルオロ-N-[2-フルオロ-3-[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-N-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.h) 2-クロロ-N-[3-[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-3-ピリジンカルボキサミド ; M.29.11.i) 4-シアノ-N-[2-シアノ-5-[2,6-ジプロモ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カルバモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.j) 4-シアノ-3-[(4-シアノ-2-メチル-ベンゾイル)アミノ]-N-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド ; M.29.11.k) N-[5-[[2-クロロ-6-シアノ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.l) N-[5-[[2-プロモ-6-クロロ-4-[2,2,2-トリフルオロ-1-ヒドロキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.m) N-[5-[[2-プロモ-6-クロロ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.n) 4-シアノ-N-[2-シアノ-5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カルバモイル]-2-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.o) 4-シアノ-N-[2-シアノ-5-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]-2-メチル-ベンズアミド ; M.29.11.p) N-[5-[[2-プロモ-6-クロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド ; 又は

【0286】

M.29.12の群から選択される化合物、ここで、化合物は、M.29.12a) ~ M.29.12m)から選択

10

20

30

40

50

される： M.29.12.a) 2-(1,3-ジオキサン-2-イル)-6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-ピリジン； M.29.12.b) 2-[6-[2-(5-フルオロ-3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-2-ピリジニル]-ピリミジン； M.29.12.c) 2-[6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-2-ピリジニル]-ピリミジン； M.29.12.d) N-メチルスルホニル-6-[2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキサミド； M.29.12.e) N-メチルスルホニル-6-[2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]ピリジン-2-カルボキサミド； M.29.12.f) N-エチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.g) N-メチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.h) N,2-ジメチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.i) N-エチル-2-メチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.j) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N-エチル-2-メチル-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.k) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N,2-ジメチル-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.l) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N-メチル-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.m) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-メチルチオ-プロパンアミド； 又は化合物 10

【0287】

M.29.14a) 1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ-5-メトキシ-7-メチル-8-ニトロ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン； 又はM.29.14b) 1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-7-メチル-8-ニトロ-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-5-オール； 又は化合物 20

【0288】

M.29.16a) 1-イソプロピル-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； 又はM.29.16b) 1-(1,2-ジメチルプロピル)-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16c) N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-1-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチル-エチル)ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16d) 1-[1-(1-シアノシクロプロピル)エチル]-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16e) N-エチル-1-(2-フルオロ-1-メチル-プロピル)-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16f) 1-(1,2-ジメチルプロピル)-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16g) 1-[1-(1-シアノシクロプロピル)エチル]-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16h) N-メチル-1-(2-フルオロ-1-メチル-プロピル)-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； M.29.16i) 1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド； 又はM.29.16j) 1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド、 又は 30

【0289】

M.29.17 化合物M.29.17a) ~ M.29.17j) から選択される化合物： M.29.17a) N-(1-メチルエチル)-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド； M.29.17b) N-シクロプロピル-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド； M.29.17c) N-シクロヘキシル-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド； M.29.17d) 2-(3-ピリジニル)-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2H-インダゾール-4-カルボキサミド； M.29.17e) 2-(3-ピリジニル)-N-[(テトラヒドロ-2-フラニル)メチル]-2H-インダゾール-5-カルボキサミド； M.29.17f) メチル 2-[[2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-イル]カルボニル]ヒドラジンカルボキシレート； M.29.17g) N-[(2,2-ジフルオロシクロプロピル)メチル]-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド； M.29.17h) N-(2,2-ジフルオロプロピル)-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド； M.29.17i) 2-(3-ピリジニル)-N-(2-ピリミジニルメチル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド； M.29.17j) N-[(5-メチル-2-ピラジニル)メチル]-2-(3-ピリジニル)-2H-インダゾール-5-カルボキサミド、 又は 40

【0290】

M.29.18 化合物M.29.18a) ~ M.29.18d) から選択される化合物: M.29.18a) N-[3-クロロ-1-(3-ピリジル)ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-(3,3,3-トリフルオロプロピルスルファニル)プロパンアミド; M.29.18b) N-[3-クロロ-1-(3-ピリジル)ピラゾール-4-イル]-N-エチル-3-(3,3,3-トリフルオロプロピルスルフィニル)プロパンアミド; M.29.18c) N-[3-クロロ-1-(3-ピリジル)ピラゾール-4-イル]-3-[(2,2-ジフルオロシクロプロピル)メチルスルファニル]-N-エチル-プロパンアミド; M.29.18d) N-[3-クロロ-1-(3-ピリジル)ピラゾール-4-イル]-3-[(2,2-ジフルオロシクロプロピル)メチルスルフィニル]-N-エチル-プロパンアミド; 又は化合物

M.29.19 サロラナー(sarolaner)、又は化合物

M.29.20 ロチラネル(lotilaner)。

10

【0291】

上で一覧表示した群Mの市販の化合物は、他の刊行物の中でもThe Pesticide Manual、第16版、C. MacBean、British Crop Protection Council (2013)において見出し得る。オンラインのPesticide Manualは、規則的に更新され、<http://bcpcdata.com/pesticide-manual.html>からアクセス可能である。

【0292】

ISOコモンネーム(一般名)を提供する殺有害生物剤についての別のオンラインデータベースは、<http://www.alanwood.net/pesticides>である。

【0293】

M.4 ネオニコチノイドのシクロキサブリド(cycloxaprid)は、国際公開第2010/069266号及び国際公開第2011/069456号から知られており、ネオニコチノイドM.4A.2は、グアジピル(guadipyr)と称されることもあり、国際公開第2013/003977号から知られており、ネオニコチノイドM.4A.3(中国においてパイコンジン(paichongding)として認可)は、国際公開第2007/101369号から公知である。メタフルミゾン類縁体(metaflumizone analogue)M.22B.1は、中国特許第10171577号明細書に記載されており、類縁体M.22B.2は、中国特許第102126994号明細書に記載されている。フタルアミドM.28.1及びM.28.2は、共に国際公開第2007/101540号から公知である。アントラニルアミドM.28.3は、国際公開第2005/077934号に記載されている。ヒドラジド化合物M.28.4は、国際公開第2007/043677号に記載されている。アントラニルアミドM.28.5a) ~ M.28.5d) 及びM.28.5h)は、国際公開第2007/006670号、国際公開第2013/024009号及び国際公開第2013/024010号に記載されており、アントラニルアミド化合物M.28.5i)は、国際公開第2011/085575号に記載されており、化合物M.28.5j)は、国際公開第2008/134969号に記載されており、化合物M.28.5k)は、米国特許出願公開第2011/046186号明細書に記載されており、化合物M.28.5l)は、国際公開第2012/034403号に記載されている。ジアミド化合物M.28.6は、国際公開第2012/034472号に見出すことができる。

20

【0294】

スピロケタール-置換環状ケトエノール誘導体M.29.3は、国際公開第2006/089633号から公知であり、ビフェニル-置換スピロ環式ケトエノール誘導体M.29.4は、国際公開第2008/067911号から公知である。トリアゾイルフェニルスルフィドM.29.5は、国際公開第2006/043635号に記載されており、バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)に基づく生物学的制御剤は、国際公開第2009/124707号に記載されている。

30

【0295】

M.29.6に一覧表示されている化合物M.29.6a) ~ M.29.6i)は、国際公開第2012/029672号に記載されており、化合物M.29.6j)及びM.29.6k)は、国際公開第2013/129688号に記載されている。殺線虫剤化合物M.29.8は、国際公開第2013/055584号から公知である。イソオキサゾリンM.29.9.a)は、国際公開第2013/050317号に記載されている。イソオキサゾリンM.29.9.b)は、国際公開第2014/126208号に記載されている。ピリダリル系類縁体(pyridalyl-type analogue)M.29.10は、国際公開第2010/060379号から公知である。カルボキサミド化合物(carboxamide compound)ブロフランリド(broflanilide)及びM.29.11.b) ~ M.29.11.h)は、国際公開第2010/018714号に記載されている通りに調製することができ、カルボ

40

50

キサミドM.29.11i)～M.29.11.p)は、国際公開第2010/127926号に記載されている。ピリジルチアゾール類(pyridylthiazoles)M.29.12.a)～M.29.12.c)は、国際公開第2010/006713号から公知であり、M.29.12.d)及びM.29.12.e)は、国際公開第2012/000896号から公知であり、M.29.12.f)～M.29.12.m)は、国際公開第2010/129497号から公知である。化合物M.29.14a)及びM.29.14b)は、国際公開第2007/101369号から公知である。ピラゾールM.29.16.a)～M.29.16h)は、それぞれ、国際公開第2010/034737号、国際公開第2012/084670号及び国際公開第2012/143317号に記載されており、ピラゾールM.29.16i)及びM.29.16j)は、米国特許出願公開第61/891437号明細書に記載されている。ピリジニルインダゾールM.29.17.a)～M.29.17.j)は、国際公開2015/038503号に記載されている。ピリジルピラゾールM.29.18a)～M.29.18d)は、米国特許出願公開第2014/0213448号明細書に記載されている。イソオキサゾリンM.29.19は、国際公開第2014/036056号に記載されている。イソオキサゾリンM.29.20は、国際公開第2014/090918号から知られている。
10

【0296】

とりわけ、特に、本発明の化合物と、フィプロール類、ネオニコチノイド類又はピレスロイド類との組み合わせは、カムムシ(stinkbug)、特にエウスキスツス(Euschistus)、例えばエウスキスツス・ヘロス(Euschistus heros)に対し(Colbyの式による)相乗的な防除を示す可能性がある。

【0297】

本発明による化合物と一緒に使用することができる、殺菌剤の以下の一覧は、可能な組合せを例示することを意図するものであるが、それらを制限するものではない：
20

【0298】

F.1)A)呼吸阻害剤

F.1-1)Qo部位における複合体IIIの阻害剤：

ストロビルリン：アゾキシストロビン、コウモキシストロビン、ジモキシストロビン、エネストロブリン、フルオキサストロビン、クレソキシム-メチル、メトミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン、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、ピリベンカルブ、トリクロピリカルブ/クロロジンカルブ、トリフロキシストロビン、2-[2-(2,5-ジメチル-フェノキシメチル)-フェニル]-3-メトキシ-アクリル酸メチルエステル及び2-(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデンアミノオキシメチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチル-アセトアミド；
30

オキサゾリジンジオン及びイミダゾリノン：ファモキサドン、フェンアミドン、

F.1-2)複合体IIの阻害剤(例えばカルボキサミド)：

カルボキサニリド：ベノダニル、ベンゾピニジフルビル、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシン、フェンフラム、フェンヘキサミド、フルオピラム、フルトールアニル、フラメトピル、イソピラザム、イソチアニル、メプロニル、オキシカルボキシン、ペンフルフェン、ベンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルズアミド、チアジニル、2-アミノ-4-メチル-チアゾール-5-カルボキサニリド、N-(3',4',5'-トリフルオロピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(フルキサビロキサド)、N-(4'-トリフルオロメチルチオピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、N-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチル)-1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチ
40

50

ル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(トリフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、3-(ジフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド、1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド；

F.I-3)阻害剤-Qo部位における複合体III阻害剤(例えば、ストロビルリン類(strobilurins))：アゾキシストロビン(azoxystrobin)(A.1.1)、クメトキシストロビン(coumethoxystrobin)(A.1.2)、クモキシストロビン(coumoxystrobin)(A.1.3)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)(A.1.4)、エネストロブリン(enestroburin)(A.1.5)、フェナミンストロビン(fenaminostrobin)(A.1.6)、フェノキシストロビン(fenoxystrobin)/フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)(A.1.7)、フルオキサストロビン(fluoxastrobin)(A.1.8)、クレソキシム-メチル(kresoxim-methyl)(A.1.9)、マンデストロビン(mandestrobin)(A.1.10)、メトミノストロビン(metominostrobin)(A.1.11)、オリサストロビン(orysastrobin)(A.1.12)、ピコキシストロビン(picoxy-strobin)(A.1.13)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)(A.1.14)、ピラメストロビン(pyrametostrobin)(A.1.15)、ピラオキシストロビン(pyraoxystrobin)(A.1.16)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)(A.1.17)、2-(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデンアミノオキシメチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチル-アセトアミド(A.1.18)、ピリベンカルブ(pyribencarb)(A.1.19)、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)/クロロジンカルブ(chlorodincarb)(A.1.20)、ファモキサドン(famoxadone)(A.1.21)、フェンアミドン(fenamidone)(A.1.21)、メチル-N-[2-[(1,4-ジメチル-5-フェニル-ピラゾール-3-イル)オキシルメチル]フェニル]-N-メトキシ-カルバメート(A.1.22)、1-[3-クロロ-2-[[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシメチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.23)、1-[3-プロモ-2-[[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.24)、1-[2-[[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.25)、1-[2-[[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-フルオロ-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.26)、1-[2-[[1-(2,4-ジクロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-フルオロ-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.27)、1-[2-[[4-(4-クロロフェニル)チアゾール-2-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.28)、1-[3-クロロ-2-[[4-(p-トリル)チアゾール-2-イル]オキシメチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.29)、1-[3-シクロプロピル-2-[[2-メチル-4-(1-メチルピラゾール-3-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.30)、1-[3-(ジフルオロメトキシ)-2-[[2-メチル-4-(1-メチルピラゾール-3-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.31)、1-メチル-4-[3-メチル-2-[[2-メチル-4-(1-メチルピラゾール-3-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]テトラゾール-5-オン(A.1.32)、1-メチル-4-[3-メチル-2-[[1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-エチリデンアミノ]オキシメチル]フェニル]テトラゾール-5-オン(A.1.33)、(Z,2E)-5-[1-(2,4-ジクロロフェニル)ピラゾール-3-イル]-オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド(A.1.34)、(Z,2E)-5-[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド(A.1.35)、(Z,2E)-5-[1-(4-クロロ-2-フルオロ-フェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド(A.1.36)、

【0299】

-Qi部位における複合体III阻害剤：シアゾファミド(cyazofamid)(A.2.1)、アミスルブロム(amisulbrom)(A.2.2)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-アセトキシ-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル]2-メチルプロパノエート(A.2.3)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-(アセトキシメトキシ)-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-50

7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.4)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-イソブトキシカルボニルオキシ-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.5)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[[3-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イルメトキシ)-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.6)；(3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2-ピリジニル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-8-(フェニルメチル(フェニル-メチル)-1,5-ジオキソナン-7-イル 2-メチルプロパノエート(A.2.7)、(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピコリンアミド]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル イソブチレート(A.2.8)；

10

【0300】

F.I-4) 他の呼吸阻害剤(複合体I、脱共役剤)ジフルメトリム(diflumetorim)；-複合体II阻害剤(例えば、カルボキサミド類(carboxamides))：ベノダニル(benodanil)(A.3.1)、ベンゾビンジフルピル(benzovindiflupyr)(A.3.2)、ビキサafen(bixafen)(A.3.3)、ボスカリド(boscalid)(A.3.4)、カルボキシン(carboxin)(A.3.5)、フェンフラム(fenfuram)(A.3.6)、フルオピラム(fluopyram)(A.3.7)、フルトラニル(flutolanil)(A.3.8)、フルキサピロキサド(fluxapyroxad)(A.3.9)、フラメトピル(furametpyr)(A.3.10)、イソフェタミド(isofetamid)(A.3.11)、イソピラザム(isopyrazam)(A.3.12)、メプロニル(mepronil)(A.3.13)、オキシカルボキシン(oxycarboxin)(A.3.14)、ペンフルフェン(penflufen)(A.3.14)、ベンチオピラド(penthiopyrad)(A.3.15)、セダキサン(sedaxane)(A.3.16)、テクロフタラム(tecloftalam)(A.3.17)、チフルザミド(thifluzamide)(A.3.18)、N-(4'-トリフルオロメチルチオピフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.19)、N-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.20)、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.21)、3-(トリフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.22)、1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.23)、3-(トリフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.24)、1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.25)、N-(7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-インダン-4-イル)-1,3-ジメチル-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.26)、N-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-メトキシ-1-メチル-エチル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.27)；

20

【0301】

-他の呼吸阻害剤(例えば、複合体I、脱共役剤)：ジフルメトリム(diflumetorim)(A.4.1)、(5,8-ジフルオロキナゾリン-4-イル)-{2-[2-フルオロ-4-(4-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)-フェニル]-エチル}-アミン；テクナゼン(tecnazene)；アメトクトラジン(ametoctradin)；シルチオファム(silthiofam)(A.4.2)；ニトロフェニル誘導体：ビナパクリル(binapacryl)(A.4.3)、ジノブトン(dinobuton)(A.4.4)、ジノカップ(dinocap)(A.4.5)、フルアジナム(fluazinam)(A.4.6)；フェリムゾン(ferimzone)、ニトルタール；イソプロピル(nitralhal-isopropyl)(A.4.7)；有機金属化合物：フェンチン塩(fentin salts)、例えば、フェンチン-アセテート(fentin-acetate)(A.4.8)、フェンチンクロライド(fentin chloride)(A.4.9)又はフェンチンヒドロキシド(fentin hydroxide)(A.4.10)；アメトクトラジン(ametoctradin)(A.4.11)；及びシルチオファム(silthiofam)(A.4.12)；

30

及び有機金属化合物：フェンチン塩(fentin salts)、例えば、フェンチン-アセテート(fentin-acetate)、フェンチンクロライド(fentin chloride)又はフェンチンヒドロキシド(fentin hydroxide)を含む；

【0302】

F.II) B)ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

40

50

F. II-1)- C14デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤、例えば)：トリアゾール類(triazoles)、イミダゾール類(imidazoles))

トリアゾール類：アザコナゾール(azaconazole)(B.1.1)、ビテルタノール(bitertanol)(B.1.2)、ブロムコナゾール(bromuconazole)(B.1.3)、シプロコナゾール(cyproconazole)(B.1.4)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)(B.1.5)、ジニコナゾール(diniconazole)(B.1.6)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)(B.1.7)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)(B.1.8)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)(B.1.9)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)(B.1.10)、フルシラゾール(flusilazole)(B.1.11)、フルトリアホール(flutriafol)(B.1.12)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)(B.1.13)、イミベンコナゾール(imibencconazole)(B.1.14)、イプコナゾール(ipconazole)(B.1.15)、メトコナゾール(metconazole)(B.1.17)、ミクロブタニル(myclobutanil)(B.1.18)、オキスボコナゾール(oxpoconazole)(B.1.19)、パクロブトラゾール(paclobutrazole)(B.1.20)、ペンコナゾール(penconazole)(B.1.21)、プロピコナゾール(propiconazole)、プロチオコナゾール(prothioconazole)、(B.1.22)、プロチオコナゾール(prothioconazole)(B.1.23)、シメコナゾール(simeconazole)(B.1.24)、テブコナゾール(tebuconazole)(B.1.25)、テトラコナゾール(tetraconazole)(B.1.26)、トリアジメホン(triadimefon)(B.1.27)、トリアジメノール(triadimenol)(B.1.28)、トリチコナゾール(triticonazole)(B.1.29)、ウニコナゾール(uniconazole)(B.1.30)、1-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-5-チオシアナト-1H-[1,2,4]トリアゾール、トリアゾロ(B.1.31)、2-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチルオキシラニルメチル]-2H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール(B.1.32)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール(B.1.33)、1-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-シクロプロピル-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノール(B.1.34)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.35)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.36)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-3-メチル-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.37)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール(B.1.38)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-3-メチル-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.39)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール(B.1.40)、2-[4-(4-フルオロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール(B.1.41)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタ-3-イン-2-オール(B.1.51)；イミダゾール類(imidazoles)：イマザリル(imazalil)(B.1.42)、ペフラゾエート(pefurazoate)、オキスボコナゾール(oxpoconazole)、(B.1.43)、プロクロラズ(prochloraz)、トリフルミゾール(triflumizole);(B.1.44)；トリフルミゾール(triflumizol)(B.1.45)；ピリミジン類(pyrimidines)、ピリジン類(pyridines)及びピペラジン類(piperazines)：フェナリモル(fenarimol)(B.1.46)、ヌアリモル(nuarimol)(B.1.47)、ピリフェノックス(pyrifenoxy)(B.1.48)、トリホリン(triforine)、1-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-5チオシアナト-1H-[1,2,4]トリアゾール、2-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-2H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール;(B.1.49)、[3-(4-クロロ-2-フルオロ-フェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)イソオキサゾール-4-イル]-3-ピリジル)メタノール(B.1.50)

【0303】

F. II-2)- デルタ14-レダクターゼ阻害剤(アミン類、例えばモルホリン類(morpholines)、ピペリジン類(piperidines)) モルホリン類阻害剤：アルジモルフ(aldimorph)(B.2.1)、ドデモルフ(dodemorph)(B.2.2)、酢酸ドデモルフ(dodemorph-acetate)(B.2.3)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)(B.2.4)、トリデモルフ(tridemorph);

10

20

30

40

50

ピペリジン類:(B.2.5)、フェンプロピジン(fenpropidin)(B.2.6)、ピペラリン(piperalin);スピロケタールアミン類(spiroketalamines):(B.2.7)、スピロキサミン(spiroxamine)(B.2.8) ;

【0304】

F.II-3)-3-ケトレダクター阻害剤：ヒドロキシアニリド類(hydroxyanilides)：フェンヘキサミド(fenhexamid)(B.3.1)；

【0305】

F.III) C)核酸合成阻害剤

F.III-1) RNA、DNA合成

- フェニルアミド類(phenylamides)又はアシルアミノ酸殺菌剤(acyl amino acid fungicides)：ベナラキシル(benalaxyI)(C.1.1)、ベナラキシル-M(benalaxyI-M)(C.1.2)、キララキシル(kiralaxyI)(C.1.3)、メタラキシル(metaxyI)(C.1.4)、メタラキシル-M(metaxyI-M)(メフェノキサム(mefenoxam)、C.1.5)、オフレース(ofurace)(C.1.6)、オキサジキシル(oxadixyl)(C.1.7)；

【0306】

イソオキサゾール類(isoxazoles)及びイソチアゾロン類(iosothiazolones)-その他：ヒメキサゾール(hymexazole)(C.2.1);オクチリノン(octhilinone)；

F.III-2) DNAトポイソメラーゼ(topoisomerase)阻害剤:(C.2.2)、オキソリン酸(oxolinic acid)

F.III-3) ヌクレオチド代謝(Nucleotide metabolism)(例えば、アデノシン-デアミナーゼ(adenosin-deaminase)、ヒドロキシ(2-アミノ)-ピリミジン類:(C.2.3)、ブピリメート(bupirimete)；(C.2.4)、5-フルオロシトシン(5-fluorocytosine)(C.2.5)、5-フルオロ-2-(p-トリルメトキシ)ピリミジン-4-アミン(C.2.6)、5-フルオロ-2-(4-フルオロフェニルメトキシ)ピリミジン-4-アミン(C.2.7)；

【0307】

F.IV) D)細胞分裂及び又は細胞骨格阻害剤

F.IV-1) チューブリン(Tubulin)-チューブリン阻害剤:、例えば、ベンゾイミダゾール類(benzimidazoles)及びチオファネート類(thiophanates)：ベノミル(benomyl)(D1.1)、カルベンダジム(carbendazim)(D1.2)、フベリダゾール(fuberidazole)(D1.3)、チアベンダゾール(thiabendazole)(D1.4)、チオファネート-メチル(thiophanate-methyl)；(D1.5)；チアゾロピリミジン類(triazolopyrimidines)：5-クロロ-7((4-メチルピベリジンメチルピベリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニルトリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロトリアゾロ[1,5-a]ピリミジン(D1.6)；

【0308】

F.IV-2) その他 -他の細胞分裂阻害剤

ベンズアミド類(benzamides)及びフェニルアセトアミド類(phenyl acetamides)：ジエトフェンカルブ(diethofencarb)(D2.1)、エタボキサム(ethaboxam)(D2.2)、ベンシクリン(pencycuron)(D2.3)、フルオピコリド(fluopicolide)(D2.4)、ゾキサミド(zoxamide)

F.IV-3) アクチン阻害剤：ベンゾフェノン類(benzophenones):(D2.5)、メトラフェノン(metrafenone)(D2.6)、ピリオフェノン(pyriofenone)(D2.7)；

【0309】

F.V) E)アミノ酸及びタンパク質合成阻害剤

F.V-1) メチオニン(Methionine)-メチオニン合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン類(anilino-pyrimidines))

アニリノ-ピリミジン類(anilino-pyrimidines):シプロジニル(cyprodinil)、メパニピリム(mepanipyrim)、ニトラピリン(nitrapyrin)、(E.1.1)、メパニピリム(mepanipyrim)(E.1.2)、ピリメタニル(pyrimethanil)(E.1.3)；

【0310】

F.V-2) タンパク質-タンパク質合成阻害剤(アニリノ-ピリミジン類(anilino-pyrimidi

10

20

30

40

50

nes))

抗生素質: ブラストサイジン-S(blasticidin-S)(E.2.1)、カスガマイシン(kasugamycin)(E.2.2)、カスガマイシン塩酸塩水和物(kasugamycin hydrochloride-hydrate)(E.2.3)、ミルジオマイシン(mildiomycin)(E.2.4)、ストレプトマイシン(streptomycin)、オキシテトラサイクリン(oxytetracyclin)、(E.2.5)、オキシテトラサイクリン(oxytetracyclin)(E.2.6)、ポリオキシン(polyoxine)(E.2.7)、バリダマイシンA(validamycin A)(E.2.8) ;

【0311】

F.VI))シグナル伝達阻害剤

F.VI-1)- MAP/ヒスチジンヒスチジンキナーゼ阻害剤(例えば、アニリノ-ピリミジン類(anilino-pyrimidines))

10

ジカルボキシミド類(dicarboximides): フルオロイミド(fluoroimid)(F.1.1)、イプロジオン(iprodione)(F.1.2)、プロシミドン(procymidone)(F.1.3)、ビンクロゾリン(vinclozolin);

フェニルピロール類(phenylpyrroles):(F.1.4)、フェンピクロニル(fenpiclonil)(F.1.5)、フルジオキソニル(fluadioxonil);(F.1.6) ;

【0312】

F.VI-2)- Gタンパク質阻害剤: キノリン類(quinolines):キノキシフェン(quinoxyfen)(F.2.1) ;

【0313】

F.VII) G)脂質及び膜合成阻害剤

20

F.VII-1)- リン脂質生合成阻害剤

有機リン化合物(organophosphorus compounds): エディフェンホス(edifenphos)(G.1.1)、イプロベンホス(iprobenfos)、ピラゾホス(pyrazophos);

ジチオラン類(dithiolanes):(G.1.2)、ピラゾホス(pyrazophos)(G.1.3)、イソプロチオラン(isoprothiolane)(G.1.4) ;

【0314】

F.VII-2) 脂質(Lipid)-脂質過酸化物(lipid peroxidation): 芳香族炭化水素類(aromatic hydrocarbons): ジクロラン(dicloran)(G.2.1)、キントゼン(quintozene)(G.2.2)、テクナゼン(tecnazene)(G.2.3)、トルクロホス-メチル(tolclofos-methyl)(G.2.4)、ビフェニル(biphenyl)(G.2.5)、クロロネブ(chloroneb)(G.2.6)、エトリジアゾール(etridiazole)(G.2.7) ;

30

【0315】

F.VII-3) カルボン酸アミド類(Carboxyl acid amides)(CAA殺菌剤)

ケイ皮酸アミド類又はマンデル酸アミド類(cinnamic or mandelic acid amides)-リン脂質生合成及び細胞壁沈着: ジメトモルフ(dimethomorph)(G.3.1)、フルモルフ(flumorph)、マンジプロアパミド(mandiproamid)、(G.3.2)、マンジプロバミド(mandipropamid)(G.3.3)、ピリモルフ(pyrimorph);

バリンアミドカルバメート類(valinamide carbamates):(G.3.4)、ベンチアバリカルブ(benthiavalicarb)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)、ピリベンカルブ(pyribencarb)、(G.3.5)、イプロバリカルブ(iprovalicarb)(G.3.6)、バリフェナレート(valifenalate)(G.3.7)及びN-(1-(1-(4-シアノ-フェニル)エタンスルホニルエタンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸-(4-フルオロフェニル)エステル;(G.3.8) ;

40

【0316】

F.VII-4) 化合物-細胞膜浸透性及び脂肪酸に作用する化合物:

1-[4-[4-[5-(2,6-ジフルオロフェニル)-4,5-ジヒドロ-3-イソオキサゾリル]-2-チアゾリル]-1-ピペリジニル]-2-[5-メチル-3-(トリフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン、カルバミン酸類(carbamatesacides): プロパモカルブ(propamocarb)、プロパモカルブ-塩酸塩(propamocarb-hydrochlorid)、(G.4.1) ;

【0317】

F.VII-5)-脂肪酸アミド加水分解酵素阻害剤: オキサチアピプロリン(oxathiapiprolin

50

) (G.5.1-[4-[4-[5-(), 2,6-ジフルオロフェニル]-4,5-ジヒドロ--{3 イソオキサゾリル]-[2-チアゾリル]--(1-ペペリジニル]-2-[5-メチル--{[3-(トリフルオロメチル)-,5-ビス(ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル]エタノン;アセチル}ペペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニルメタンスルホネート(G.5.2)、2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ペペリジン-4-イル) 1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル} -3-クロロフェニル メタンスルホネート(G.5.3)；

【0318】

F.VIII) H) 多部位作用性の阻害剤

F.VIII-1) 無機(Inorganic)-無機活性物質：ボルドー混合液(Bordeaux mixture)(H.1.1)、酢酸銅(H.1.2)、水酸化銅(H.1.3)、オキシ塩化銅(H.1.4)、塩基性硫酸銅(H.1.5)、硫黄(H.1.6)；

【0319】

F.VIII-2) チオ(Thio)- チオカルバメート類及びジチオカルバメート類(thio- and dithiocarbamates)：ファーバム(ferbam)(H.2.1)、マンコゼブ(mancozeb)(H.2.2)、マンネブ(maneb)(H.2.3)、メタム(metam)、メタスルホカルブ(methasulphocarb)、(H.2.4)、メチラム(metiram)(H.2.5)、プロピネブ(propineb)(H.2.6)、チラム(thiram)(H.2.7)、ジネブ(zineb)(H.2.8)、ジラム(ziram)；(H.2.9)；

【0320】

F.VIII-3) 有機塩素(Organochlorine)- 有機塩素化合物(例えば、フタルイミド類(phthalimides)、スルファミド類(sulfamides)、クロロニトリル類(chloronitriles))：アニラジン(anilazine)(H.3.1)、クロロタロニル(chlorothalonil)(H.3.2)、カプタホール(captaphos)(H.3.3)、キャプタン(captan)(H.3.4)、フォルペット(folpet)(H.3.5)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)(H.3.6)、ジクロロフェン(dichlorophen)、フルスルファミド(flusulfamide)、ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)、(H.3.7)、ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)(H.3.8)、ペンタクロロフェノール(pentachlorophenol)(H.3.9)及びその塩、フタリド(phthalide)(H.3.10)、トリルフルアニド(tolylfluanid)(H.3.11)、N-((4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)-N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホニアミド；(H.3.12)；

【0321】

F.VIII-4) グアニジン類(Guanidines)- グアニジン類(guanidines)及びその他のもの：グアニジン(guanidine)(H.4.1)、ドジン(dodine)(H.4.2)、ドジン遊離塩基(dodine free base)(H.4.3)、グアザチン(guazatine)(H.4.4)、グアザチン-アセテート(guazatine-acetate)(H.4.5)、イミノクタジン(iminoctadine)(H.4.6)、イミノクタジン-トリアセテート(iminoctadine-triacetate)(H.4.7)、イミノクタジン-トリス(iminoctadine-tris)(アルベシレート(albesilate))(H.4.8)、ジチアノン(dithianon)(H.4.9)、2,6-ジメチルジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロール-1,3,5,7(2H,6H)-テトラオン；(H.4.10)；

【0322】

F.VIII-5) アントラキノン類(Ahtraquinones)：ジチアノン(dithianon)；

F.IX) I) 細胞壁合成阻害剤

F.IX-1) 阻害剤-グルカン合成阻害剤：バリダマイシン(validamycin)(I.1.1)、ポリオキシンB(polyoxin B)(I.1.2)；

【0323】

F.IX-2) メラニン(Melanin)- メラニン合成阻害剤：ピロキロン(pyroquilon)(I.2.1)、トリシクラゾール(tricyclazole)、カルプロパミド(carpropamide)、(I.2.2)、カルプロパミド(carpropamid)(I.2.3)、ジシクロメット(dicyclomet)(I.2.4)、フェノキサニル(fenoxanil)(I.2.5)；

【0324】

F.X) J) 植物防御誘導剤

10

20

30

40

50

F.X-1) サリチル酸経路(Salicylic acid pathway):-アシベンゾラル-S-メチル(acibenzo lar-S-methyl);

F.X-2) その他:(J.1.1)、プロベナゾール(probenazole)(J.1.2)、イソチアニル(isotian ill)(J.1.3)、チアジニル(tiadinil)(J.1.4)、プロヘキサジオン-カルシウム(prohexadion e-calcium);

(J.1.5); ホスホネート類(phosphonates): ホセチル(fosetyl)(J.1.6)、ホセチル-アルミニウム(fosetyl-aluminum)(J.1.7)、亜リン酸(phosphorous acid)及びその塩;(J.1.8)、重炭酸カリウム又はナトリウム(J.1.9);

【0325】

F.XI) K)作用機序不明のもの

- ブロノポール(bronopol)(K.1.1)、キノメチオネート(chinomethionat)(K.1.2)、シフルフェナミド(cyflufenamid)(K.1.3)、シモキサニル(cymoxanil)(K.1.4)、ダゾメット(dazomet)(K.1.5)、デバカルブ(debacarb)、ジクロメジン(diclomezine)、(K.1.6)、ジクロメジン(diclomezine)(K.1.7)、ジフェンゾコート(difenoquat)(K.1.8)、ジフェンゾコート-メチル硫酸塩(difenoquat-methylsulfate)(K.1.9)、ジフェニルアミン(diphenylamin)(K.1.10)、フェンピラザミン(fenpyrazamine)(K.1.11)、フルメトベル(flumetover)(K.1.12)、フルスルファミド(flusulfamide)(K.1.13)、フルチアニル(flutianil)(K.1.14)、メタスルホカルブ(methasulfocarb)(K.1.15)、ニトラピリン(nitrapyrin)(K.1.16)、ニトロタール-イソプロピル(nitrothal-isopropyl)(K.1.18)、オキサチアピプロリン(oxathiaprolin)(K.1.19)、トルプロカルブ(tolprocarb)(K.1.20)、オキシン銅(oxin-copper)(K.1.21)、プロキナジド(proquinazid)(K.1.22)、テブフロキン(tebufloquin)(K.1.23)、テクロフタラム(tecloftalam)(K.1.24)、トリアゾキシド(triazoxide)(K.1.25)、2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン(propylchromen)-4-オン(K.1.26)、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン(K.1.27)、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン(K.1.28)、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン(K.1.29)、N-(シクロプロピルメトキシイミノシクロプロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロ-メトキシ-2,3-ジフルオロジフルオロ-フェニル)-メチル)-2-フェニル アセトアミド(K.1.30)、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシトリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチル ホルムアミジン(K.1.31)、N'((4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチルトリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチル ホルムアミジン(K.1.32)、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロポキシトリメチル-シラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチル ホルムアミジン, ホルムアミジン(K.1.33)、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニルトリメチルシラニル-プロポキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチル ホルムアミジン、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル)-アミド、2-{1-[2-(5-メチル-3-トリフルオロメチル-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-チアゾール-4-カルボン酸メチル-(R)-1,2,3,4-テトラヒドロ-ナフタレン-1-イル-アミド、(K.1.34)、メトキシ-酢酸6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチル-キノリン-4-イルエステル及びN-メチル-2-{1-[5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル)-アセチル]-ピペリジン-4-イル}-N-[(1R)-1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン-1-イル]-4-チアゾールカルボキサミド、3-[(K.1.35)、3-[5-(4-メチルフェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(K.1.36)、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン、(ピリソキサゾール(pyrisoxazole)、5-アミノ-2-イソプロ

10

20

30

40

50

ピル-3-オキソ-4-オルト-トリル-2,3-ジヒドロ-ピラゾール-1 カルボチオ酸S-アリルエステル, N-(6-メトキシ)(K.1.37)、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)シクロプロパンカルボン酸シクロプロパンカルボン酸アミド(K.1.38)、5-クロロ-1((4,6-ジメトキシジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール, ベンゾイミダゾール(K.1.39)、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシ-アセトアミド,..、エチル (Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニル-プロパ-2-エノエート(K.1.40)、ピカルブトラゾクス(picarbutrazox)(K.1.41)、ベンチル N-[6-[(Z)-[(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]カルバメート(K.1.42)、2-[2-[(7,8-ジフルオロ-2-メチル-3-キノリル)オキシ]-6-フルオロ-フェニル]プロパン-2-オール(K.1.43)、2-[2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチル-3-キノリル)オキシ]フェニル]プロパン-2-オール(K.1.44)、3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(K.1.45)、3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(K.1.46)、3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(K.1.47)、9-フルオロ-2,2-ジメチル-5-(3-キノリル)-3H-1,4-ベンゾオキサゼピン(K.1.48)。

【0326】

F.XII) 生育調節剤: アブシジン酸(abscisic acid)、アミドクロル(amidochlor)、アンシミドール(ancymidol)、6-ベンジルアミノプリン(6-benzylaminopurine)、ブラシノリド(brassinolide)、ブトラリン(butralin)、クロルメコート(chlormequat)(クロルメコートクロリド(chlormequatchloride))、塩化コリン(choline chloride)、シクラニリド(cyclanilide)、ダミノジド(daminozide)、ジケグラック(dikegulac)、ジメチピン(dimethipin)、2,6-ジメチルブリジン(2,6-dimethylpuridine)、エテホン(ethephon)、フルメトラリン(flumetralin)、フルルピリミドール(flurprimidol)、フルチアセット(fluthiacet)、ホルクロルフェヌロン(forchlorfenuron)、ジベレリン酸(gibberellic acid)、イナベンフィド(inabenfide)、インドール-3-酢酸(indole-3-acetic acid)、マレイン酸ヒドラジド(maleic hydrazide)、メフルイジド(mefluidide)、メピコート(mepiquat)(メピコートクロリド(mepiquat chloride))、ナフタレン酢酸(naphthaleneacetic acid)、N6-ベンジルアデニン(N6-benzyladenine)、パクロブトラゾール(paclobutrazol)、プロ-ヘキサジオン(pro-hexadione)(プロヘキサジオン-カルシウム(prohexadione-calcium))、プロヒドロジャスモン(prohydrojasmon)、チジアズロン(thidiazuron)、トリアベンテノール(triapentenol)、トリブチルホスホトリチオエート(tributyl phosphorotri thioate)、2,3,5-トリ-ヨード安息香酸(2,3,5-tri-iodobenzoic acid)、トリネキサバック-エチル(trinexapac-ethyl)及びウニコナゾール(uniconazole)。

【0327】

上に列挙した群Fの市販されている化合物は、いくつもある刊行物の中でも、The Pesticide Manual、第15版、C. D. S. Tomlin、British Crop Protection Council (2011年)において見出すことができる。それらの一般名により記載されている殺菌剤、それらの調製法、及び例えは、有害な菌類に対するそれらの活性は知られており(<http://www.alanwood.net/pesticides/>を参照)；これらの物質は市販されている。

【0328】

IUPAC命名法により記載されている化合物、殺菌剤、それらの調製法、及びそれらの殺菌性の殺有害生物活性もまた、公知である(Can. J. Plant Sci. 48(6)、587-94、1968；欧洲特許出願公開第141 317号明細書；欧洲特許出願公開第152 031号明細書；欧洲特許出願公開第226 917号明細書；欧洲特許出願公開第243 970号明細書；欧洲特許出願公開第256 503号明細書；欧洲特許出願公開第428 941号明細書；欧洲特許出願公開第532 022号明細書；欧洲特許出願公開第1 028 125号明細書；欧洲特許出願公開第1 035 122号明細書；欧洲特許出願公開第1 201 648号明細書；欧洲特許出願公開第1 122 244号明細書、特開2002316902号公報；獨国特許出願公開第(DE)19650197号明細書；獨国特許出願公開第(DE)10021412号明細書；獨国特許出願公開第(DE)102005009458号明細書；米国特許第3,296,272号明細書；米国特許3,325,503号明細書；国際公開第98/46608号；国際

公開第99/14187号；国際公開第99/24413号；国際公開第99/27783号；国際公開第00/29404号；国際公開第00/46148号；国際公開第00/65913号；国際公開第01/54501号；国際公開第01/56358号；国際公開第02/22583号；国際公開第02/40431号；国際公開第03/10149号；国際公開第03/11853号；国際公開第03/14103号；国際公開第03/16286号；国際公開第03/53145号；国際公開第03/61388号；国際公開第03/66609号；国際公開第03/74491号；国際公開第04/49804号；国際公開第04/83193号；国際公開第05/120234号；国際公開第05/123689号；国際公開第05/123690号；国際公開第05/63721号；国際公開第05/87772号；国際公開第05/87773号；国際公開第06/15866号；国際公開第06/87325号；国際公開第06/87343号；国際公開第07/82098号；国際公開第07/90624号、国際公開第11/028657号、国際公開第2012/168188号、国際公開第2007/006670号、国際公開第2011/77514号；国際公開第13/047749号、国際公開第10/069882号、国際公開第13/047441号、国際公開第03/16303号、国際公開第09/90181号、国際公開第13/007767号、国際公開第13/010862号、国際公開第13/127704号、国際公開第13/024009号、国際公開第13/024010号及び国際公開第13/047441号、国際公開第13/162072号、国際公開第13/092224号、国際公開第11/135833号を参照)。 10

【0329】

本発明の化合物は、種子伝染、土壤伝染又は葉の菌症に対する植物の保護のために、土壤、ピート又は他の発根媒体と混合することができる。

【0330】

組成物中に使用するための適切な相乗剤の例には、ピペロニルブтокシド、セサメックス、サフロキサン及びドデシルイミダゾールが挙げられる。 20

【0331】

組成物中の包含物として適切な除草剤及び植物生育調節剤は、標的及び必要とする効果に依存する。

【0332】

含まれ得るイネ用選択性除草剤の例には、プロパニルが挙げられる。綿に使用するための植物生育調節剤の例は、PIX(商標)である。

【0333】

いくつかの混合物は、混合物が容易に同じにならないように、著しく異なる物理学的、化学的又は生物学的性質を有する活性成分を含むことができる。 30

【0334】

無脊椎有害生物(「動物有害生物」とも呼ばれる)、すなわち、昆虫、クモ及び線虫等、植物、この植物が生育中であるか又は生育し得る土壤又は水を、当技術分野で公知の任意の施用方法により、本発明の化合物又はそれらを含む組成物(複数可)に接触させることができる。よって、「接触させること」は、直接的接触(化合物/組成物を、無脊椎有害生物又は植物、典型的には、植物の葉、茎又は根に直接施用する)と、間接的接触(化合物/組成物を、無脊椎有害生物又は植物の居場所に施用する)との両方を含む。

【0335】

本発明の化合物又はそれらを含む殺有害生物組成物を使用して、植物/作物を、殺有害生物有効量の本発明の化合物と接触させることによって、動物有害生物、とりわけ昆虫、コナダニ又はクモによる攻撃又は寄生から生育中の植物及び作物を保護することができる。「作物」という用語は、生育中の作物及び収穫した作物の両方を指す。 40

【0336】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、様々な栽培植物、例えば穀物、根菜作物、油料作物、野菜植物、香辛料、観賞植物、例えばデュラム小麦及び他の小麦、オオムギ、カラスムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシ及びシュガートウモロコシ/スウィートコーン及びフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、綿、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料用ピート、ナス、ジャガイモ、イネ科草本、ローン、芝、飼料用イネ科草本、トマト、リーキ、パンプキン/カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種(Brassica sp 50

ecies)、メロン、マメ、エンドウマメ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えばジャガイモ、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジー及びツリフネソウ等における多数の昆虫の防除に特に重要である。

【0337】

本発明の化合物は、そのまま又は組成物の形態で、昆虫又は殺虫性攻撃から保護すべき植物、植物繁殖材料、例えば種子、土壤、表面、材料又は空間等を、殺虫有効量の活性化合物で処理することによって使用される。この施用は、昆虫が植物、植物繁殖材料、例えば種子、土壤、表面、材料又は空間等に感染する前及び感染した後の両方において行うことができる。

【0338】

さらに、無脊椎有害生物は、標的の有害生物、その餌供給源、生息地、繁殖地又はその居場所を、殺有害生物有効量の本発明の化合物と接触させることによって防除することができる。よって、この施用は、有害生物が居場所、生育中の作物、又は収穫された作物に感染する前又は感染した後に行うことができる。

【0339】

本発明の化合物はまた、有害生物の出現が予想される場所に予防的に施用することができる。

【0340】

本発明の化合物はまた、生育中の植物を、殺有害生物有効量の本発明の化合物と接触させることによって、この植物を有害生物による攻撃又は寄生から保護するために使用することもできる。よって、「接触させること」は、直接的接触(化合物/組成物を、有害生物及び/又は植物、典型的には、植物の葉、茎又は根に直接施用する)と、間接的接触(化合物/組成物を、有害生物及び/又は植物の居場所に施用する)との両方を含む。

【0341】

「居場所」とは、有害生物又は寄生生物が成長中であるか又は成長し得る、生息地、繁殖地、植物、種子、土壤、領域、材料又は環境を意味する。

【0342】

一般に、「殺有害生物有効量」とは、標的生物体の壊死、死亡、抑制、予防及び除去、破壊、又はそうでなければ発生及び活性を軽減する効果を含む、成長に対する観察可能な効果を達成するために必要とされる活性成分の量を意味する。殺有害生物有効量は、本発明において使用される様々な化合物/組成物に関して変動し得る。組成物の殺有害生物有効量はまた、所望の殺有害生物の効果及び持続期間、天候、標的種、居場所、及び施用の様式等一般的な条件によっても変動する。

【0343】

土壤の処理又は有害生物の滞留場所又は巣への施用の場合、活性成分の量は、100m²当たり、0.0001～500g、好ましくは100m²当たり、0.001～20gの範囲である。

【0344】

材料の保護における慣習的な施用量は、例えば、処理される材料1m²当たり活性化合物0.01g～1000gであり、望ましくは1m²当たり0.1g～50gである。

【0345】

材料を含浸して使用するための殺虫組成物は、典型的には、0.001～95重量%、好ましくは0.1～45重量%、より好ましくは1～25重量%の少なくとも1種の忌避剤及び/又は殺虫剤を含有する。

【0346】

作物植物を処理する使用のためには、本発明の活性成分の施用量は、1ヘクタール当たり0.1g～4000g、望ましくは1ヘクタール当たり5g～500g、さらに望ましくは1ヘクタール当たり5g～200gの範囲であってよい。

【0347】

本発明の化合物は、接触(土壤、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物部位又は動物部位を介して)及び摂取(ベイト剤、又は植物部位)の両方により効果的である。

10

20

30

40

50

【0348】

本発明の化合物はまた、非作物の昆虫有害生物、例えばアリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、蚊、コオロギ、又はゴキブリ等に対して施用することもできる。上記非作物有害生物に対する使用のため、本発明の化合物は、好ましくはベイト剤組成物で使用される。

【0349】

ベイト剤は、液体、固体又は半固体の調製物(例えばゲル)であってよい。固体ベイト剤は、それぞれの適用に対して適切な様々な形状及び形態、例えば粒剤、ブロック剤、ステイック剤、ディスク剤に形成することができる。液体ベイト剤は、適切な適用を確実にするための様々なデバイス、例えば開放容器、噴霧デバイス、液滴源、又は蒸発源の中に充填することができる。ゲル剤は、水性又は油性のマトリクスをベースとすることができ、粘着性、水分保持又はエージング特性に関する特定の必要品に製剤化することができる。

10

【0350】

組成物に採用されているベイト剤は、昆虫、例えばアリ、シロアリ、カリバチ、ハエ、蚊、コオロギ等又はゴキブリがそれを食べるように駆り立てるのに十分な誘引性のある製品である。誘引性は、摂食刺激剤又は性フェロモンを使用することで操作することができる。食物刺激剤は、例えば、動物及び/又は植物タンパク質(肉粉、魚粉又は血粉、昆虫部分、卵黄)から、動物及び/又は植物由来の脂肪及び油から、又は単糖類、オリゴ糖類又はポリ有機糖類から、とりわけスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチン又は糖蜜若しくは蜂蜜からさえも選ばれるが、これらだけに限らない。果実、作物、植物、動物、昆虫又はその特異的な部分の新鮮若しくは腐りかけの部分もまた、摂食刺激剤としての役目を果たすことができる。性フェロモンは、より昆虫特異的であることが知られている。特異的フェロモンは、文献に記載されており、当業者に知られている。

20

【0351】

ベイト剤組成物での使用に対して、活性成分の典型的な含有量は、0.001重量%~15重量%、望ましくは0.001重量%~5%重量%の活性成分である。

【0352】

エアゾール剤(例えば、スプレー缶中)、オイルスプレー剤又はポンプスプレー剤としての本発明の化合物の製剤は、専門家ではないユーザーが、有害生物、例えばハエ、ノミ、マダニ、蚊又はゴキブリ等を防除するために極めて適切である。エアゾール処方剤は、活性化合物、溶媒、例えば低級アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)、ケトン(例えばアセトン、メチルエチルケトン)、およそ50~250の沸騰範囲を有するパラフィン炭化水素(例えばケロシン)、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン等、水、さらには補助剤、例えば乳化剤、例えばソルビトールモノオレエート、3~7モルのエチレンオキシドを有するオレイルエトキシレート、脂肪族アルコールエトキシレート等、香油、例えばエーテル油、中間脂肪酸の低級アルコールとのエステル、芳香族カルボニル化合物等、適当な場合、安定剤、例えば安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル等、並びに、必要な場合、噴霧剤、例えばプロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素、又はこれらのガスの混合物等で構成するのが好ましい。

30

【0353】

オイルスプレー製剤は、噴霧剤が使用されないという点でエアゾール処方剤とは異なる。

【0354】

スプレー組成物での使用に対して、活性成分の含有量は、0.001~80重量%、好ましくは0.01~50重量%及び最も好ましくは0.01~15重量%である。

【0355】

本発明の化合物及びそのそれぞれの組成物はまた、蚊取線香及び燻蒸コイル、煙カートリッジ、気化器プレート又は長時間気化器において、さらに、モスペーパー、モスパッド

40

50

又は他の熱非依存性気化器システムにおいて使用することができる。

【0356】

本発明の化合物及びそのそれぞれの組成物を使用して、昆虫により伝染される感染症(例えばマラリア、デング熱及び黄熱病、リンパ節フィラリア症、及びリーシュマニア症)を防除する方法はまた、小屋及び家屋の表面を処理すること、カーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェバエトラップ等の空気噴霧及び含浸も含む。纖維、織物、ニット製品、不織布、製網材料又はホイル及び防水布への施用のための殺虫組成物は、殺虫剤、場合によって忌避剤及び少なくとも1種の結合剤を含む混合物を含むことが好ましい。適切な忌避剤は、例えばN,N-ジエチル-メタ-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサンジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、{(+/-)-3-アリル-2-メチル-4-オキソシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-trans-クリサンテメート(エスピオスリン)等の昆虫防除に対して使用されないピレスロイド、リモネン、オイゲノール、(+)-オイカマロール(1)、(-)-1-エピ-オイカマロール等の植物抽出物、又はエウカリプツス・マクラタ(Eucalyptus maculata)、ハマゴウ(Vitex rotundifolia)、シムボポガン・マルチニ(Cymbopogon martinii)、シムボポガン・シトラツス(Cymbopogon citratus)(レモングラス)、シモポガン・ナルツズス(Cymbopogon nardus)(シトロネラ)等の植物からの粗製の植物抽出物由来の又はこれらと同一の忌避剤である。適切な結合剤は、例えば脂肪族酸のビニルエステル(例えば酢酸ビニル及びベルサチン酸ビニル等)、アルコールのアクリル酸エステル及びメタクリル酸エステル、例えばアクリル酸ブチル、アクリル酸2-エチルヘキシル、及びアクリル酸メチル等、モノエチレン性及びジエチレン性不飽和炭化水素、例えばスチレン等、及び脂肪族ジエン、例えばブタジエン等のポリマー及びコポリマーから選択される。

【0357】

カーテン及び蚊帳の含浸は、一般に、布地材料を殺虫剤のエマルション剤若しくは分散液中に浸漬するか、又はネット上にこれらを噴霧することによって行う。

【0358】

本発明の化合物及びそれらの組成物は、木質材料、例えば木、板塀、枕木等、及び建築物、例えば家屋、納屋、工場ばかりでなく、建設材料、家具、皮革、纖維、ビニル製品、電線及びケーブル等を、アリ及び/又はシロアリから保護するため、並びにアリ及びシロアリが作物又はヒトに被害を与える(例えば、有害生物が家屋及び公共施設に侵入した場合)のを防除するために使用することができる。本発明の化合物は、木質材料を保護するために周辺の土壤表面又は床下土壤に施用するばかりでなく、製材品、例えば、床下コンクリートの表面、床柱、梁、ベニヤ板、家具等、木製品、例えばパーティクルボード、ハーフボード等、及びビニル製品、例えばコーティングされた電線、ビニルシート等、断熱材、例えばスチレン発泡体等にも施用することができる。作物又はヒトに被害を与えるアリに対して施用する場合、本発明のアリ防除剤を作物又は周辺の土壤に施用するか、又はアリの巣等に直接施用する。

【0359】

本発明の化合物は、植物繁殖材料、とりわけ種子の処理に対しても適切であり、これによって、これらの種子を昆虫有害生物、特に土壤に生息する昆虫有害生物から保護し、さらに生じた植物の根及び苗条を土壤有害生物及び葉面昆虫から保護する。

【0360】

本発明の化合物は、土壤有害生物から種子を保護し、生じた植物の根及び苗条を土壤有害生物及び葉面昆虫から保護するのに特に有用である。生じた植物の根及び苗条の保護が好ましい。より好ましいのは、生じた植物の苗条を、刺す昆虫及び吸汁性昆虫から保護することであり、アブラムシからの保護が最も好ましい。

【0361】

したがって、本発明は、昆虫、特に土壤昆虫から種子を保護するため、及び昆虫、特に土壤及び葉面昆虫から苗木の根及び苗条を保護するための方法であって、播種前及び/又

は発芽前処理後に、種子を本発明の化合物（その塩を含む）と接触させるステップを含む方法を含む。特に好ましいのは、植物の根及び苗条が保護される方法であり、より好ましいのは、植物苗条が刺す昆虫及び吸汁性昆虫から保護される方法であり、最も好ましいのは、植物苗条がアブラムシから保護される方法である。

【0362】

種子という用語は、すべての種類の種子及び植物栄養繁殖体を包含し、以下に限定されないが、真の種子、種子小片、吸枝、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、挿し木、切り取った苗条等を含み、好ましい実施形態では真の種子を意味する。

【0363】

種子処理という用語は、当技術分野で公知のすべての適切な種子処理技術、例えば種子粉衣法、種子コーティング法、種子散粉法、種子浸漬法及び種子ペレット化法を含む。

10

【0364】

本発明はまた、活性化合物でコーティングされた又は活性化合物を含有する種子を含む。

【0365】

「～でコーティングされた、及び/又は～を含有する」という用語は、一般に、施用時に活性成分が繁殖材料の表面上の大部分にあることを意味するが、施用方法に応じて、成分の一部が多かれ少なかれ繁殖材料中に浸透し得ることを表す。上記繁殖材料が(再び)植えられる場合、それは活性成分を吸収することができる。

【0366】

適切な種子は、穀物、根菜作物、油料作物、野菜植物、香辛料、観賞植物の種子、例えばデュラム小麦及び他の小麦、オオムギ、カラスムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシ及びシュガートウモロコシ/スウィートコーン及びフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、綿、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科草本、ローン、芝、飼料用イネ科草本、トマト、リーキ、パンプキン/カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種 (*Brassica species*)、メロン、マメ、エンドウマメ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物、例えばジャガイモ等、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム/テンジクアオイ、パンジー及びツリフネソウの種子である。

20

【0367】

さらに、活性化合物はまた、遺伝子操作法を含めた品種改良により、除草剤又は殺菌剤又は殺虫剤の作用に耐性を示す植物由来の種子の処理に使用することもできる。

【0368】

例えば、スルホニル尿素、イミダゾリノン、グルホシネート-アンモニウム又はグリホセート-イソプロピルアンモニウム及び類似の活性物質からなる群からの除草剤に対して抵抗性を示す植物(例えば、欧州特許出願公開第242236号明細書、欧州特許出願公開第242246号明細書) (国際公開第92/00377号) (欧州特許出願公開第257993号明細書、米国特許第5,013,659号明細書を参照されたい)、あるいは遺伝子組換え作物植物、例えば植物を特定の有害生物に対して抵抗性とするバシラス・チューリングンシス毒 (*Bacillus thuringiensis toxin*) (Bt毒)を產生する能力がある綿(欧州特許出願公開第142924号明細書、欧州特許出願公開第193259号明細書)由来の種子の処理において、活性化合物を採用することができる。

30

40

【0369】

さらに、例えば従来の品種改良法及び/又は突然変異体の生成、あるいは組換え手順により発生させることができる現存する植物が構成している特徴と比較して修飾された特徴を有する植物由来の種子の処理に活性化合物を使用することもできる。例えば、植物内で合成されるデンプンを修飾するという目的のための作物植物の組換え修飾(例えば国際公開第92/11376号、国際公開第92/14827号、国際公開第91/19806号)、又は脂肪酸組成物が修飾された遺伝子組換え作物植物(国際公開第91/1397号)

50

2号)について、多くの事例が記載されている。

【0370】

活性化合物の種子処理施用は、植物の播種前及び植物の出芽前に種子に噴霧又は散粉することによって行う。

【0371】

とりわけ種子処理に対して有用な組成物は、例えば以下である：

- A 水溶性濃縮剤(SL、LS)
- D エマルション剤(EW、EO、ES)
- E 懸濁剤(SC、OD、FS)
- F 水分散性粒剤及び水溶性粒剤(WG、SG) 10
- G 水分散性散剤及び水溶性散剤(WP、SP、WS)
- H ゲル剤(GF)
- I 散粉性散剤(DP、DS)

【0372】

従来の種子処理製剤は、例えば流動性のある濃縮剤(FS)、液剤(LS)、乾燥処理用散剤(DS)、スラリー処理用分散性散剤(WS)、水溶性散剤(SS)及びエマルション剤(ES及びEC)及びゲル製剤(GF)を含む。これらの製剤は、希釈して又は希釈しないで種子に施用することができる。種子への施用は、播種前に種子に直接、又は種子を発芽前処理した後に行う。

【0373】

好ましい実施形態では、FS製剤は種子処理用に使用する。典型的には、FS製剤は、1~800g/lの活性成分、1~200g/lの界面活性剤、0~200g/lの抗凍結剤、0~400g/lの結合剤、0~200g/lの色素及び1リットルまでの溶媒、好ましくは水を含み得る。 20

【0374】

種子処理用のとりわけ好ましい本発明の化合物のFS製剤は、通常0.1~80重量%(1~800g/l)の活性成分、0.1~20重量%(1~200g/l)の少なくとも1種の界面活性剤、例えば0.05~5重量%の湿潤剤及び0.5~15重量%の分散剤、20重量%まで、例えば5~20%の抗凍結剤、0~15重量%、例えば1~15重量%の顔料及び/又は染料、0~40重量%、例えば1~40重量%の結合剤(固着剤/付着剤)、場合によって5重量%まで、例えば0.1~5重量%の増粘剤、場合によって0.1~2%の抗発泡剤、並びに場合によって保存剤、例えば、殺生物剤、抗酸化剤等を、例えば0.01~1重量%の量で、及び充填剤/ビヒクルを100重量%まで含む。 30

【0375】

種子処理製剤は、結合剤、及び場合によって着色剤もさらに含んでもよい。

【0376】

結合剤を加えることによって、処理後の種子上の活性物質の付着を改善することができる。適切な結合剤は、エチレンオキシド又はプロピレンオキシドのようなアルキレンオキシドからのホモ-及びコポリマー、ポリビニルアセテート、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン及びそれらのコポリマー、エチレン-ビニルアセテートコポリマー、アクリルホモ-及びコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド及びポリエチレンイミン、多糖類、例えば、セルロース、チロース及びデンプン、ポリオレフィンホモ-及びコポリマー、例えばオレフィン/マレイン酸無水物コポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモ及びコポリマーである。 40

【0377】

場合によって、また着色剤も製剤に含めることができる。種子処理製剤に対して適切な着色剤又は色素は、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112、C.I.ソルベントレッド1、ピグメントブルー15:4、ピグメントブルー15:3、ピグメントブルー15:2、ピグメントブルー15:1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー-1、ピグメントイエロー-13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48:2、ピグメントレッド48:1、ピグメントレッド57:1、ピグメントレッド53:1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド 50

51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108である。

【0378】

ゲル化剤の例は、カラギーン(Satiagel(登録商標))である。

【0379】

種子の処理において、本発明の化合物の施用量は、通常種子100kg当たり0.01g～10kg、好ましくは種子100kg当たり0.05g～5kg、より好ましくは種子100kg当たり0.1g～1000g、特に種子100kg当たり0.1g～200gである。

【0380】

したがって本発明はまた、本明細書で定義したような本発明の化合物（農業上有用なその塩を含む）を含む種子にも関する。本発明の化合物（農業上有用なその塩を含む）の量は、通常種子100kg当たり0.01g～10kg、好ましくは種子100kg当たり0.05g～5kg、特に種子100kg当たり0.1g～1000gで変動することになる。レタス等特定の作物については、この割合はより高くてよい。

【0381】

種子を処理するために採用することができる方法は、原則として、すべての適切な種子処理、とりわけ当技術分野で公知の種子粉衣法技法、例えば、種子コーティング法(例えば種子ペレット化)、種子散粉法及び種子吸収(例えば種子浸漬)等である。ここで「種子処理」とは、種子と、本発明の化合物を互いに接触させるすべての方法を指し、「種子粉衣法」とは、特定量の本発明の化合物を有する種子を提供する、すなわち本発明の化合物を含む種子を作り出す種子処理の方法を指す。原則として、処理は、種子の収穫から種子の播種までの任意の時点において種子に施用することができる。種子は、例えば「プランターズボックス」法を使用して、種子の定植の直前又はその間に処理することができる。しかし、処理は、効力の大幅な減少が観察されることなく、例えば種子粉衣処理の形態で、種子の定植の数週間又は数カ月前、例えば最大12カ月前まで行うこともできる。

【0382】

適切には、この処理は、未播種種子に施用する。本明細書で使用される場合、「未播種種子」という用語は、種子の収穫から、植物の発芽及び生育を目的とする地中への種子の播種までの任意の期間における種子を含むことを意図する。

【0383】

具体的には、手順は、種子を、適切なデバイス、例えば、固体又は固体/液体混合パートナーのための混合装置内で、所定量の種子処理剤と、そのまま又は水による事前の希釈後に、組成物が種子上で均一に分布されるまで混合する処理に従う。適当な場合、この後に乾燥ステップが続く。

【0384】

本発明の化合物（それらの立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN-オキシドを含む）はまた、特に動物の体内及び体の上の寄生生物を駆除するために使用するのに適切である。

【0385】

したがって、本発明の目的はまた、動物の体内及び体の上の寄生生物を防除するための新規方法を提供することである。本発明の別の目的は、動物にとってより安全な殺有害生物剤を提供することである。さらに、本発明の別の目的は、現存する殺有害生物剤よりも低い投与量で使用することができる動物用の殺有害生物剤を提供することである。本発明の別の目的は、寄生生物の長期残留防除を提供する、動物用の殺有害生物剤を提供することである。

【0386】

本発明はまた、動物の体内及び体の上の寄生生物を駆除するための、殺寄生生物有効量の本発明の化合物（それらの立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN-オキシドを含む）と、許容される担体とを含む組成物にも関する。

【0387】

10

20

30

40

50

本発明はまた、寄生生物の寄生及び感染に対して動物を処理、管理、予防及び保護するための方法であって、動物に、殺寄生生物有効量の本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN-オキシドを含む）又はそれを含む組成物を、経口的、局所的又は非経口的に投与又は適用させるステップを含む方法を提供する。

【0388】

本発明はまた、無脊椎有害生物に寄生され若しくは感染している動物を処理し又は無脊椎有害生物による寄生若しくは感染から動物を保護するための、本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩、又はN-オキシドを含む）の使用を提供する。

【0389】

本発明はまた、殺寄生生物有効量の本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN-オキシドを含む）又はそれを含む組成物を含む、寄生生物の寄生又は感染に対して、動物を処理、管理、予防又は保護するための組成物を調製するための方法を提供する。

【0390】

農業有害生物に対する化合物の活性は、例えば、経口適用の場合における低い非催吐性用量、動物との代謝適合性、低毒性、及び安全な取扱いを必要とする動物の体内及び体の上の内部寄生生物及び外部寄生生物の防除について、これらの適性を示唆するものではない。

【0391】

驚くことに、本発明において、式(1)の化合物及びそれらの立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体及びN-オキシドは、動物の体内及び体の上の内部寄生生物及び外部寄生生物を駆除するのに適切であることが判明した。

【0392】

本発明の化合物、特に式(1)の化合物及びそれらの立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体及びN-オキシド、並びにそれらを含む組成物は、温血動物(ヒトを含む)及び魚類を含む動物において、寄生及び感染を防除及び予防するために使用するのが好ましい。これらは、例えば哺乳動物、例えばウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、家禽類、ウサギ、ヤギ、イヌ及びネコ、水牛、ロバ、ダマジカ及びトナカイ、さらに毛皮動物、例えばミンク、チンチラ及びアライグマ等、鳥類、例えば雌鳥、ガチョウ、シチメンチョウ及びアヒル等、並びに魚類、例えば淡水魚及び塩水魚、例えばマス、コイ及びウナギ等における寄生及び感染を防除及び予防するのに適切である。

【0393】

本発明の化合物（それらの立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN-オキシドを含む）及びそれらを含む組成物は、家畜、例えばイヌ又はネコ等における寄生及び感染を防除及び予防するのに使用されるのが好ましい。

【0394】

温血動物及び魚類における寄生として、以下に限定されないが、シラミ、ハジラミ、マダニ、ハナウマバエ、ヒツジシラミバエ、刺咬性ハエ、キンバエ、ハエ、ミアシティックハエ幼虫、ツツガムシ、ブヨ、蚊及びノミが挙げられる。

【0395】

本発明の化合物（それらの立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN-オキシドを含む）及びそれらを含む組成物は、外部寄生生物及び/又は内部寄生生物の浸透性及び/又は非浸透性防除に対して適切である。これらは、発達のすべて又は一部の段階に対して活性である。

【0396】

本発明の化合物は、とりわけ以下の目及び種の寄生生物をそれぞれ駆除するのに有用である：

ノミ(隠翅目(Siphonaptera))、例えばネコノミ(Ctenocephalides felis)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ケオプスネズミノミ(Xenopsylla cheopis)、ヒトノミ(Pulex irritans)、スナノミ(Tunga penetrans)、及びヨーロッパネズミノミ(Nosopsyllus fasciatus)

10

20

30

40

50

、ゴキブリ(ゴキブリ目(Blattaria)-プラトデア(Blattodea))、例えばチャバネゴキブリ(*Blattella germanica*)、プラテラ・アサヒナエ(*Blattella asahinae*)、ワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)、ヤマトゴキブリ(*Periplaneta japonica*)、トビイロゴキブリ(*Periplaneta brunnea*)、ペリプラネタ・フリギノサ(*Periplaneta fuligginosa*)、コワモンゴキブリ(*Periplaneta australasiae*)、及びトウヨウゴキブリ(*Blatta orientalis*)、
ハエ、蚊(双翅目(Diptera))、例えばネッタイシマカ(*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ(*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ(*Aedes vexans*)、メキシコミバエ(*Anastrepha ludens*)、アノフェレス・マクリペニス(*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・クルシアンス(*Anopheles crucians*)、アノフェレス・アルビマヌス(*Anopheles albimanus*)、ガニビエハマダラカ(*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・フレエボルニ(*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ロイコスフィルス(*Anopheles leucosphyrus*)、コガタハマダラカ(*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラツス(*Anopheles quadrimaculatus*)、ホホアカクロバエ(*Calliphora vicina*)、クリソミア・ベジアナ(*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラクス(*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア(*Chrysomya macellaria*)、クリソップス・ジスカリス(*Chrysops discalis*)、クリソップス・シラセア(*Chrysops silacea*)、クリソップス・アトランチクス(*Chrysops atlanticus*)、アメリカオビキンバエ(*Cochliomyia hominivorax*)、コルジロビア・アントロポファガ(*Cordylobia anthropophaga*)、クリコイデス・フレンス(*Culicoides furens*)、アカイエカ(*Culex pipiens*)、クレクス・ニグリパルpus(*Culex nigripalpus*)、ネッタイイエカ(*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・タルサリス(*Culex tarsalis*)、クリセタ・イノルナタ(*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ(*Culiseta melanura*)、ヒトヒフバエ(*Dermatobia hominis*)、
ヒメイエバエ(*Fannia canicularis*)、ウマバエ(*Gasterophilus intestinalis*)、グロシナ・モルシタンス(*Glossina morsitans*)、グロシナ・パルパリス(*Glossina palpalis*)、グロシナ・フスシペス(*Glossina fuscipes*)、グロシナ・タキノイデス(*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ(*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス(*Haplodiplosis equestris*)、ヒペラテス属の種(*Hippelates spp.*)、ヒポデルマ・リネアタ(*Hypoderma lineata*)、レプトコノpus・トレンス(*Leptoconops torrens*)、ルシリア・カプリナ(*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ(*Lucilia cuprina*)、ヒロズキンバエ(*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス(*Lycoria pectoralis*)、マンソニア属の種(*Mansonia spp.*)、イエバエ(*Musca domestica*)、オオイエバエ(*Muscina stabulans*)、ヒツジバエ(*Oestrus ovis*)、フェレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、プソロフォラ・コロムビアエ(*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ジスコロル(*Psorophora discolor*)、プロシムリウム・ミクスツム(*Prosimulium mixtum*)、サルコファガ・ヘモロイダリス(*Sarcophaga haemorrhoidalis*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga spp.*)、シムリウム・ビタツム(*Simulium vittatum*)、サシバエ(*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス・ボビヌス(*Tabanus bovinus*)、タバヌス・アトラツス(*Tabanus atratus*)、タバヌス・リネオラ(*Tabanus lineola*)、及びタバヌス・シミリス(*Tabanus similis*)、
シラミ(シラミ目(Phthiraptera))、例えばアタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Pthirus pubis*)、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ(*Linognathus vituli*)、ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)及びケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*)。

【0397】

マダニ及び寄生ダニ(パラシチフォルメス(Parasitiformes))：マダニ(イクソジダ(Ixodida))、例えばクロアシマダニ(*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス(*Ixodes holocyclus*)、西部クロアシマダニ(*Ixodes pacificus*)、リフィセファルス・サンギネウス(*Rhipicephalus sanguineus*)、デルマセントル・アンデルソニ(*Dermacentor andersoni*)、アメリカイヌカクマダニ(*Dermacentor variabilis*)、アメリカキララマダニ(*Amblyomma americanum*)

mericanum)、アンブリオマ・マクラツム(*Ambryomma maculatum*)、オルニソドルス・ヘルムシ(*Ornithodoros hermsi*)、オルニソドルス・ツリカタ(*Ornithodoros turicata*)及び寄生ダニ(メソスチグマタ(*Mesostigmata*))、例えばイエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)及びワクモ(*Dermanyssus gallinae*)、

アクチネジダ(*Actinedida*)(ケダニ亜目(*Prostigmata*))及びアカリジダ(*Acaridida*)(コナダニ亜目(*Astigmata*))、例えばアカラピス属の種(*Acarapis spp.*)、ケイレチエラ属の種(*Cheyletiella spp.*)、オルニトケイレチア属の種(*Ornithochyletia spp.*)、ミオビア属の種(*Myobia spp.*)、プソレルガテス属の種(*Psorergates spp.*)、デモデクス属の種(*Demodex spp.*)、トロムビクラ属の種(*Trombicula spp.*)、リストロホルス属の種(*Listrophorus spp.*)、アカルス属の種(*Acarus spp.*)、チロファグス属の種(*Tyrophagus spp.*)、カログリフス属の種(*Caloglyphus spp.*)、ヒポデクテス属の種(*Hypodectes spp.*)、プテロリクス属の種(*Pterolichus spp.*)、プソロプテス属の種(*Psoroptes spp.*)、コリオプテス属の種(*Chorioptes spp.*)、オトデクテス属の種(*Otodectes spp.*)、サルコプテス属の種(*Sarcoptes spp.*)、ノトエドレス属の種(*Notoedres spp.*)、クネミドコプテス属の種(*Knemidocoptes spp.*)、シトジテス属の種(*Cytodites spp.*)、及びラミノシオプテス属の種(*Laminoiopites spp.*)、

バグ(ヘテロプテリダ(*Heteropterida*)):トコジラミ(*Cimex lectularius*)、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、レジュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma spp.*)、ロドニウス属の種(*Rhodnius spp.*)、パンストロンギルス属の種(*Panstrongylus spp.*)及びアリルス・クリタツス(*Arius crinitatus*)、

アノプルリダ(*Anoplurida*)、例えばハエマトピヌス属の種(*Haematopinus spp.*)、リノグナツス属の種(*Linognathus spp.*)、ペジクルス属の種(*Pediculus spp.*)、フチルス属の種(*Phtirus spp.*)、及びソレノポテス属の種(*Solenopotes spp.*)、

マロファギダ(*Mallophagida*)(アルンブリセリナ亜目(*suborder Arnblycerina*)及びイスクノセリナ亜目(*suborder Ischnocerina*))、例えばトリメノポン属の種(*Trimenopon spp.*)、メノポン属の種(*Menopon spp.*)、トリノトン属の種(*Trinoton spp.*)、ボビコラ属の種(*Bovicola spp.*)、ウエルネキエラ属の種(*Werneckiella spp.*)、レピケントロン属の種(*Leptikentron spp.*)、トリコデクテス属の種(*Trichodectes spp.*)、及びフェリコラ属の種(*Felicola spp.*)、

線形動物門線虫(*Roundworms Nematoda*):

ワイプワーム(*Wipeworms*)及びトリチノーシス(*Trichinosis*)(トリコシリンギダ(*Trichosyringida*))、例えばトリキネリダエ(*Trichinellidae*)(トリチネラ属の種(*Trichinella spp.*))、(トリクリダエ(*Trichuridae*))トリクリス属の種(*Trichuris spp.*)、カピラリア属の種(*Capillaria spp.*)、

ラブジチダ目(*Rhabditida*)、例えばラブジチス属の種(*Rhabditis spp.*)、ストロンギロイデス属の種(*Strongyloides spp.*)、ヘリセファロブス属の種(*Helicephalobus spp.*)、

ストロンギリダ亜目(*Strongylida*)、例えばストロンギルス属の種(*Strongylus spp.*)、アンシロストマ属の種(*Ancylostoma spp.*)、ネカトル・アメリカヌス(*Necator americanus*)、ブノストムム属の種(*Bunostomum spp.*)(鉤虫(Hookworm))、トリコストロンギルス属の種(*Trichostrongylus spp.*)、捻転胃虫(*Haemonchus contortus*)、オステルタギア属の種(*Ostertagia spp.*)、コオペリア属の種(*Cooperia spp.*)、ネマトジルス属の種(*Nematodirus spp.*)、ジクチオカウルス属の種(*Dictyocaulus spp.*)、シアトストマ属の種(*Cyathostoma spp.*)、エソファゴストムム属の種(*Oesophagostomum spp.*)、ステファヌルス・デンタツス(*Stephanurus dentatus*)、オルラヌス属の種(*Ollulanus spp.*)、カベルチア属の種(*Chabertia spp.*)、ステファヌルス・デンタツス(*Stephanurus dentatus*)、シンガムス・トラケア(*Syngamus trachea*)、アンシロストマ属の種(*Ancylostoma spp.*)、ウンシナリア属の種(*Uncinaria spp.*)、グロボセファルス属の種(*Globocephalus spp.*)、ネカトル属の種(*Necator spp.*)、メタストロンギルス属の種(*Metastrongylus spp.*)、ムエルレリウス・カピラリス(*Muellerius capillaris*)、プロトストロンギルス属の種(*Protostrongylus spp.*)、アンギオストロンギルス属の種(*Angiostrongylus spp.*)、パレラフォストロンギル

10

20

30

40

50

ス属の種(*Parelaphostrongylus* spp.)、アレウロストロンギルス・アブストルスス(*Aleurostrongylus abstrusus*)、及びジオクトフィマ・レナレ(*Dioctophyma renale*)、腸管内線虫(*Intestinal roundworm*)(回虫目(Ascaridida))、例えばアスカリス・ルムブリコイデス(*Ascaris lumbricoides*)、ブタ回虫(*Ascaris suum*)、アスカリジア・ガリ(*Ascaridia galli*)、パラスカリス・エクオルム(*Parascaris equorum*)、エンテロビウス・ベルミクラリス(*Enterobius vermicularis*)(線虫(Threadworm))、トキソカラ・カニス(*Toxocara canis*)、トキサスカリス・レオニン(*Toxascaris leonine*)、スクルジヤビネマ属の種(*Skrjabinema* spp.)、及びオキシウリス・エキ(*Oxyuris equi*)、カマラニダ(*Camallanida*)、例えばドラクンクルス・メジネンシス(*Dracunculus medinensis*)(ギニア虫(*guinea worm*))

センビセンチュウ目(Spirurida)、例えばテラジア属の種(*Thelazia* spp.)、ウケレリア属の種(*Wuchereria* spp.)、ブルギア属の種(*Brugia* spp.)、オンコセルカ属の種(*Onchocerca* spp.)、ジロフィラリ属の種(*Dirofilaria* spp.a)、ジペタロネマ属の種(*Dipetalonema* spp.)、セタリア属の種(*Setaria* spp.)、エレオフォラ属の種(*Elaeophora* spp.)、スピロセルカ・ルピ(*Spirocerca lupi*)、及びハブロネマ属の種(*Habronema* spp.)、鉤頭虫(Thorny headed worm)(鉤頭動物門(Acanthocephala))、例えばアカントセファルス属の種(*Acanthocephalus* spp.)、マクラカントリンクス・ヒルジナセウス(*Macracanthorhynchus hirudinaceus*)及びオンシコラ属の種(*Oncicola* spp.)、

プラナリア(*Planarians*)(プラテルミンテス(*Plathelminthes*)):

吸虫(Flukes)(吸虫綱(Trematoda))、例えばファシオラ属の種(*Fasciola* spp.)、ファシオロイデス・マグナ(*Fascioloides magna*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、ジクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium* spp.)、ファシオロプシス・ブスキ(*Fasciolopsis buski*)、肝吸虫(*Clonorchis sinensis*)、住血吸虫属の種(*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属の種(*Trichobilharzia* spp.)、アラリア・アラタ(*Alaria alata*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、及びナノシエテス属の種(*Nanocyetes* spp.)、

セルコメロモルファ(Cercoconeromorpha)、特に条虫綱(Cestoda)(条虫(Tapeworms))、例えばジフィロボトリウム属の種(*Diphyllobothrium* spp.)、テニア属の種(*Tenia* spp.)、エキノコックス属の種(*Echinococcus* spp.)、ジピリジウム・カニヌム(*Dipylidium caninum*)、マルチセプス属の種(*Multiceps* spp.)、ヒメノレピス属の種(*Hymenolepis* spp.)、メソセトイデス属の種(*Mesocestoides* spp.)、バンピロレピス属の種(*Vampirolepis* spp.)、モニエジア属の種(*Moniezia* spp.)、アノプロセファラ属の種(*Anoplocephala* spp.)、シロメトラ属の種(*Sirometra* spp.)、アノプロセファラ属の種(*Anoplocephala* spp.)、及びヒメノレピス属の種(*Hymenolepis* spp.)。

【0398】

本発明は、動物の体内及び/又は体の上の寄生生物を防除及び/又は駆除するための、本発明の化合物及びそれらを含む組成物の治療的及び非治療的使用に関する。本発明の化合物及びそれらを含む組成物を使用して、動物を殺寄生生物有効量の本発明の化合物及びそれらを含有する組成物と接触させることによって、寄生生物による攻撃又は寄生から動物を保護することができる。

【0399】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、接触(土壤、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、プランケット又は動物部位を介して)及び摂取(例えばベイト剤)の両方により効果的になり得る。よって、「接触させること」は、直接的接触(本発明の化合物を含有する殺有害生物性混合物/組成物を直接寄生生物に施用することであり、これは、その居場所-Pで間接接触させること、場合によって、殺有害生物性混合物/組成物を保護すべき動物に直接投与することも含み得る)及び間接的接触(化合物/組成物を寄生生物の居場所に施用する)の両方を含む。その居場所への施用を介して寄生生物を接触させることは、本発明の化合物の非治療的使用の例である。上記で使用された「居場所-P」とは、動物の外側で、寄生生物が成長中であるか又は成長し得る、生息地、餌供給源、繁殖地、領域、材料又は環境を意味する。

10

20

30

40

50

【0400】

一般に、「殺寄生生物有効量」は、標的生物体の壊死、死亡、抑制、予防及び除去、破壊、又はそうでなければ発生及び活性を軽減する効果を含む、成長に対する観察可能な効果を達成するために必要とされる活性成分の量を意味する。殺寄生生物有効量は、本発明の様々な化合物/組成物に関して変動し得る。組成物の殺寄生生物有効量はまた、所望の殺寄生生物効果及び持続期間、標的種、施用の様式等一般的な条件によっても変動する。

【0401】

本発明の化合物はまた、有害生物又は寄生生物の出現が予想される場所に予防的に施用することができる。

【0402】

10

投与は、防止的及び治療的の両方で行うことができる。

【0403】

活性化合物の投与は、直接又は適切な調製物の形態で、経口的に、局所的に/経皮的に又は非経口的に行われる。

【0404】

本発明の化合物は、従来技術におけるものよりも、生物分解性が良好であり、加えて、高水準の有害生物防除を維持する。これによって、本発明の化合物は、環境の安全に関して優れたものになる。式Iの化合物の構造的類似性に照らして、本発明の化合物の利益となる、生物分解性におけるこの重要な違いは、予期されないものであり、従来技術で知られる事項から導き出すことはできない。

20

【実施例】

【0405】

本発明はここで、以下の実施例によりさらに詳細に説明されるが、それに対するいかなる制限を課すものではない。

【0406】

略語

TLC 薄層クロマトグラフィー

r.t. 室温(20~25)

PE ペトロールエーテル(petrol ether)

TFA トリフルオロ酢酸

30

EtOAc 酢酸エチル

THF テトラヒドロフラン

t-BuOH tert-ブタノール

DMAP 4-(ジメチルアミノ)-ピリジン

LDA リチウムジイソプロピルアミド

TsCl トシリクロリド

MTBE メチル-tert-ブチルエーテル

DMF N,N-ジメチルホルムアミド

DCM ジクロロメタン

PyBrOP プロモ-トリス-ピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート

40

NBS N-プロモスクシンイミド

MeOH メタノール

TEA トリメチルアミン

dppf 1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン

MeCN アセトニトリル

EtOH エタノール

m-CPBA メタ-クロロ過安息香酸

PPh₃ トリフェニルホスフィン

【0407】

I. 調製例

50

化合物は、例えば結合高速液体クロマトグラフィー/質量分析(HPLC/MS)、¹H-NMR及び/又はそれらの融点によって特徴づけることができる。

【0408】

分析用HPLCカラム：

HPLC法1:Phenomenex Kinetex 1.7 μ m XB-C18 100A; 50 \times 2.1mm; 移動相:A:水+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA); B:アセトニトリル+0.1%TFA; グラジエント:5-100%Bを1.50分間; 100%Bを0.20分間; 流量:60 において、1.51分間で0.8-1.0ml/分。

【0409】

HPLC法2:Phenomenex Kinetex 1.7 μ m XB-C18 100A; 50 \times 2.1mm; 移動相:A:水+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA); B:アセトニトリル+0.1%TFA; グラジエント:5-100%Bを1.25分間; 100%Bを0.70分間; 流量:60 において、1.51分間で0.8-1.0ml/分。

MS法:ESIポジティブ、質量範囲(m/z):100 ~ 700。

【0410】

¹H-NMR:シグナルは、テトラメチルシランに対する化学シフト(ppm)、それらの多重度及びそれらの積分値(所与の水素原子の相対数)によって特徴づけられる。シグナルの多重度を特徴づけるために、以下の略語が使用される。m=多重線、q=四重線、t=三重線、d=二重線及びs=一重線。

【0411】

調製例：

[実施例1]

4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-N-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボキサミド(化合物I-7)の合成

ステップ1:4-プロモ-2-フルオロ-安息香酸tert-ブチルの調製

4-プロモ-2-フルオロ-安息香酸(100.0g、0.46mol)のTHF/t-BuOH(800mL/400mL)中溶液に、Boc₂O(150.0g、0.69mol)及びDMAP(5.6g、46.0mmol)を添加し、混合物を80 で13時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=10:1)は、反応が完了したことを示した。溶媒を除去した後、残渣を水に溶解し、EtOAc(500mL \times 3回)で抽出し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。その粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=100:1)で精製して、表題化合物を無色油としてを得た(120.0g、95.5%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.69 - 7.78 (m, 1 H) 7.26 - 7.34 (m, 2 H) 1.58 (s, 9 H)

【0412】

ステップ2:4-プロモ-2-フルオロ-3-(2-ヒドロキシエチル)安息香酸tert-ブチル

4-プロモ-2-フルオロ-安息香酸tert-ブチル(60.0g、0.22mol)のTHF中溶液に、-78 でLiDA(130mL、0.26mol)を滴下添加し、混合物をこの温度で4時間攪拌し、次いでオキシラン(77.0 g、1.75mol)を添加した。混合物をこの温度でさらに6時間攪拌し、次いで、反応混合物をNH₄Cl水溶液(300mL)に注ぎ込み、EtOAc(400mL \times 3回)で抽出した。有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。その粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(PE:EtOAc=10:1 ~ 5:1)で精製して、表題化合物を黄色固体としてを得た(14.0g、20.0%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.61 (t, J=8.03 Hz, 1 H) 7.40 (d, J=8.28 Hz, 1 H) 3.87 (t, J=6.90 Hz, 2 H) 3.16 (t, J=6.90, 2.51 Hz, 2 H) 1.60 (s, 9 H)

【0413】

ステップ3:4-プロモ-2-フルオロ-3-[2-(p-トリルスルホニルオキシ)エチル]安息香酸tert-ブチル

4-プロモ-2-フルオロ-3-(2-ヒドロキシエチル)安息香酸tert-ブチル(10.0g、31.4mmol)のピリジン中溶液に、0 でTsCl(9.0g、47.2mmol)を少量ずつ添加した。混合物を15 で14時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=10:1)は、反応が完了したことを示した。溶媒を除去した後、残渣を水に溶解し、MTBE(200mL \times 3回)で抽出し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物(17g)を得た。その粗生成物を、さらに精製することなく次のステップで直

20

30

40

50

接使用した。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.61 (t, J=8.16 Hz, 1 H) 7.40 (d, J=8.82 Hz, 1 H) 3.87 (t, J=6.84 Hz, 2 H) 3.15 (td, J=6.84, 2.65 Hz, 2 H) 1.59 (s, 9 H)

【0414】

ステップ4:4-プロモ-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル

4-プロモ-2-フルオロ-3-[2-(p-トリルスルホニルオキシ)エチル]安息香酸tert-ブチル(粗生成物17.0g、54.1mmol)のDMF(200mL)中溶液に、Na₂S(5.0g、65.0mmol)を添加し、混合物を60℃で14時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=10:1)は、反応が完了したことを示した。溶媒を除去した後、残渣をEtOAcに溶解し、水(100mL×2回)で洗浄し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。その粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=10:1)で精製して、表題化合物を無色油として得た(6.9g、2ステップで70.0%)。 10

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.62 (d, J=8.38 Hz, 1 H) 7.19 (d, J=8.38 Hz, 1 H) 3.38 (d, J=7.06 Hz, 2 H) 3.31 (d, J=7.06 Hz, 2 H) 1.60 (s, 9 H)

【0415】

ステップ5:4-アセチル-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル

4-プロモ-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル(6.9g、22.0mmol)のDMF/H₂O(200mL/60mL)中溶液に、K₂CO₃(6.2g、44.9mmol)及びPd(PPh₃)₄Cl₂(0.34g、0.44mmol)を添加し、次いでトリプチル(1-エトキシビニル)スタンナン(9.5g、26.4mmol)を添加し、混合物をN₂下、110℃で3時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=5:1)は、反応が完了したことを示した。得られた混合物に、KF(50g)を添加し、さらに1時間攪拌した。溶媒を除去した後、残渣を水に溶解し、EtOAc(100mL×3回)で抽出し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、次いで残渣をHCl水溶液/THF(0.6M)に溶解し、12時間攪拌した。その後、それをEtOAc(100mL×3回)で抽出し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。その粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=20:1)で精製して、表題化合物を黄色固体として得た(2.8g、45.8%)。 20

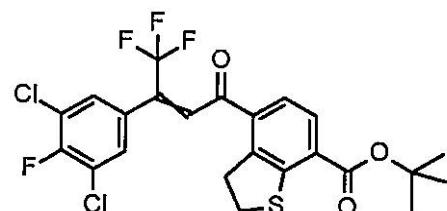
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.86 (d, J=7.94 Hz, 1 H) 7.48 (d, J=7.94 Hz, 1 H) 3.62 (t, J=8.16 Hz, 2 H), 3.21 - 3.31 (m, 2 H) 2.60 (s, 3 H) 1.62 (s, 9 H)

【0416】

ステップ6:4-[*(E/Z)*-3-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-4,4,4-トリフルオロ-ブタ-2-エノイル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル 30

【0417】

【化23】



4-アセチル-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル(2.8g、10.1mmol)及び1-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-2,2,2-トリフルオロ-エタノン3(5.2g、20.1mol)の1,2-ジクロロエタン(80mL)中溶液に、K₂CO₃(2.1g、15.1mmol)を添加し、次いで、トリエチルアミン(1.5g、15.1mmol)を添加した。混合物をN₂下、120℃で14時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=10:1)は、反応が完了したことを示した。溶媒を除去した後、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(PE:EtOAc=80:1)で精製して、表題化合物を黄色固体として得た(6.0g、*E/Z*異性体の混合物としての粗生成物)。 40

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.30 - 7.36 (m, 2 H) 7.21 (d, J=6.02 Hz, 2 H) 3.45 - 3.53 (m, 2 H) 3.22 - 3.32 (m, 2 H), 1.64 (s, 9 H)

【0418】

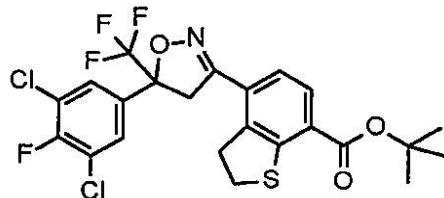
ステップ7:4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソ

50

オキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル

【0419】

【化24】



4-[(E/Z)-3-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-4,4,4-トリフルオロ-ブタ-2-エノイル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル(粗生成物6.0g、11.5mol)の1,2-ジクロロエタン(120mL)中溶液に、NH₂OH·HCl(1.6g、23.0mmol)及び臭化テトラブチルアンモニウム(0.6g、1.9mmol)を添加し、次いで、NaOH(1.8g、45.0mmol)の水(30mL)中溶液を滴下添加した。混合物を3時間攪拌し、TLC(PE:EtOAc=10:1)は、反応が完了したことを示した。次いで、反応溶液を分液し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。その粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(PE:EtOAc=80:1)で精製して、表題化合物を固体として得た(3.8g、2ステップで70.3%)。

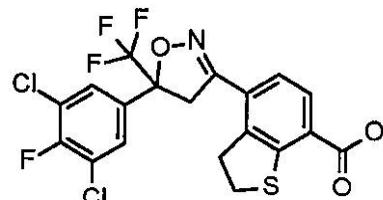
¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.84 (d, J=7.94 Hz, 1 H) 7.59 (d, J=6.17 Hz, 2 H) 7.01 (d, J=8.38 Hz, 1 H) 4.14 (d, J=17.20 Hz, 1 H) 3.75 (d, J=17.20 Hz, 1 H) 3.64 (q, J=8.09 Hz, 2 H) 3.29 - 3.38 (m, 2 H) 1.63 (s, 9 H)

【0420】

ステップ8:4-[(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸

【0421】

【化25】



4-[(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸tert-ブチル(3.8g、7.1mmol)のDCM(100mL)中溶液に、TFA(30mL)を添加し、次いで混合物を室温で3時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=10:1)は、反応が完了したことを示した。溶媒を除去した後、残渣をヘキサンで洗浄して、表題化合物を固体として得た(2.8g、82%)。

¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆): δ = 13.29 (br. s., 1 H) 7.75 - 7.91 (m, 4 H) 7.35 (d, J=7.94 Hz, 1 H) 4.30 - 4.43 (m, 2 H), 3.45 - 3.52 (m, 2 H) 3.21 - 3.28 (m, 2 H)

【0422】

ステップ9:4-[(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-N-(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボキサミド(化合物I-7)

【0423】

10

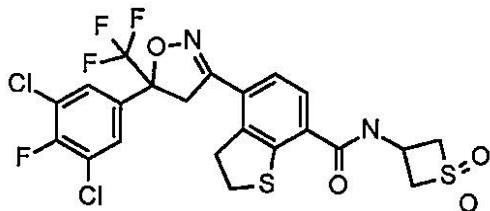
20

20

30

40

【化26】



4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾチオフェン-7-カルボン酸(200mg、0.42mmol)、1,1-ジオキソチエタン-3-アミン塩酸塩(0.08g、0.5mmol、1.2当量)及びPyBrop(0.23g、0.5mmol、1.2当量)のジクロロメタン(20mL)中溶液に、室温でヒューニッヒ塩基(0.17g、1.33mmol、3.2当量)を添加した。混合物を終夜攪拌し、飽和NH₄Cl水溶液を添加した。ジクロロメタン(50mL×2回)で抽出することによって、有機層が得られ、これを、水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、真空下で濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製することによって、表題化合物が得られた(190mg、76%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.59 (m, 3H), 7.28 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 4.86 (m, 1H), 4.61 (m, 2H), 4.15 (m, 3H), 3.76 (d, 1H), 3.50-3.68 (m, 2H), 3.31 (m, 2H).

【0424】

[実施例2]

20

実施例1のステップ5~9と類似して、式I-1~I-5、I-11~I-12、I-14~I-19及びI-28の化合物を調製した。出発物質として4-プロモ-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸tert-ブチルを代わりに使用した。

【0425】

ステップ1:4-プロモ-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸tert-ブチル

4-プロモ-2-フルオロ-3-(2-ヒドロキシエチル)安息香酸tert-ブチル(10.0g、31.4mmol)のDMF(2L)中溶液に、Cs₂CO₃(15.4g、47.2mmol)を添加し、混合物を90℃で14時間攪拌した。TLC(PE:EtOAc=5:1)は、反応が完了したことを示した。溶媒を除去した後、残渣を水に溶解し、EtOAc(300mL×3回)で抽出し、有機層をNa₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、粗生成物を得た。その粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=10:1)で精製して、表題化合物を固体として得た(6.5g、69.5%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.52 (d, J=8.38 Hz, 1H) 6.98 (d, J=8.82 Hz, 1H) 4.75 (t, J=8.82 Hz, 2H) 3.21 (t, J=8.82 Hz, 2H) 1.57 (s, 9H)。

【0426】

[実施例3]

実施例1のステップ5~9と類似して、式I-22~I-24、I-29、I-35~I-41の化合物を調製した。出発物質として7-プロモ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-カルボン酸メチルを代わりに使用した。

【0427】

ステップ1:1,2-ビス(プロモメチル)-3-ニトロ-ベンゼン

40

1,2-ジメチル-3-ニトロ-ベンゼン(102g、0.675mol)及びNBS(258.3g、1.45mol)のCCl₄(450mL)中溶液に、過酸化ベンゾイル(1.68g、6.8mmol)を一度に添加した。反応混合物をN₂下、90℃で2時間攪拌還流し、追加の過酸化ベンゾイル(6.5g、0.027mol)を添加し、反応混合物をN₂下、90℃で2時間攪拌還流し、次いで室温に冷却した。反応混合物を濾過し、CCl₄で洗浄した。黄色濾液を濃縮して、1,2-ビス(プロモメチル)-3-ニトロベンゼンを粗製油として得た。粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=60:1)で精製して、表題化合物を油として得た(粗生成物180g、87.3%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.85 (d, J=7.94 Hz, 1H) 7.73 (d, J=7.94 Hz, 1H) 7.47 - 7.55 (m, 1H) 4.87 (s, 2H) 4.78 (s, 2H)。

【0428】

50

ステップ2:4-ニトロ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン

1,2-ビス(ブロモメチル)-3-ニトロ-ベンゼン(180g、0.59mol)を入れたフラスコに、中性アルミナ(816g、8mol)及びトルエン(1L)を添加し、懸濁液を外部温度120°で18時間加熱した。反応混合物を濾過して、アルミナを除去し、酢酸エチルで洗浄した。濾液を濃縮して、黄色固体を得た。その固体をシリカゲルクロマトグラフィー(PE:EtOAc=20:1)で精製して、表題化合物を油として得た(17.5g、18%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 8.14 (d, J=7.94 Hz, 1 H), 7.55 - 7.59 (m, 1 H), 7.47 - 7.52 (m, 1 H), 5.54 (s, 2 H), 5.21 (s, 2H)。

【0429】

ステップ3:1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-アミン

10

4-ニトロ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン(50g、0.303mol)のMeOH(800mL)中溶液を、Pd/C(5g)を用いて50psiのH₂下で水素化した。反応物を濾過し、次いで濃縮して、所望の表題化合物を固体として得た(35g、85.5%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.05 - 7.15 (m, 1 H), 6.68 (d, J=7.15 Hz, 1 H), 6.58 (d, J=7.65 Hz, 1 H), 5.12 (br. s., 2 H), 5.04 (br. s., 2 H), 3.56 (br. s., 2 H)。

【0430】

ステップ4:N-(1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-イル)カルバミン酸tert-ブチル

1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-アミン(36g、0.267mol)のTHF(500mL)中溶液に、TEA(54.4g、0.533mol)及びBoc₂O(87.2g、0.400mol)を滴下添加した。混合物を攪拌し、外部温度80°で6時間加熱した。反応物を濾過し、水(300mL)に希釈し、EtOAc(500mL × 3回)で抽出し、有機層をブライン(100mL)で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、濾過し、減圧濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=30:1)で精製して、表題化合物を固体として得た(35g、55.9%)。

20

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.59 (d, J=7.94 Hz, 1 H), 7.23 - 7.32 (m, 1 H), 6.98 (d, J=7.50 Hz, 1 H), 6.30 (br. s., 1 H), 5.15 (s, 2 H), 5.11 (s, 2 H), 1.55 (s, 9 H)。

【0431】

ステップ5:N-(7-ブロモ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-イル)カルバミン酸tert-ブチル

30

N-(1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-イル)カルバミン酸tert-ブチル(25g、0.085mol)のDMF(300mL)中溶液に、0°でNBS(16.6g、0.094mol)を少量ずつ添加した。反応混合物をN₂下、25°で3時間攪拌した。反応物を濾過し、水(1000mL)に希釈し、EtOAc(500mL × 3回)で抽出し、有機層をブライン(300mL)で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、濾過し、減圧濃縮して、粗生成物を得た。粗生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=50:1)で精製して、表題化合物を得た(25g、74.8%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.49 (d, J=8.28 Hz, 1 H), 7.33 (d, J=8.53 Hz, 1 H), 6.26 (br. s., 1 H), 5.16 (s, 2 H), 5.08 (s, 2H), 1.51 (s, 9 H)。

【0432】

ステップ6:7-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-カルボン酸メチル

40

1Lのオートクレーブ中で攪拌されたN-(7-ブロモ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-イル)カルバミン酸tert-ブチル(30g、0.095mol)のMeOH(800mL)中溶液に、Na₂CO₃(30.4g、0.286mol)及びPd(dppf)Cl₂(5g)を添加し、混合物を攪拌し、1MPaのCO下、120°で18時間加熱した。室温に冷却した後、混合物を濾過し、濃縮し、残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィー(PE:EtOAc=10:1)で精製して、表題化合物を得た(24g、85.7%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.93 (q, J=8.53 Hz, 2 H) 6.28 (br. s., 1 H) 5.42 (s, 2 H) 5.10 (s, 2 H) 3.90 (s, 3 H) 1.55 (s, 9 H)。

【0433】

ステップ7:7-アミノ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-カルボン酸メチル

50

搅拌された7-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-カルボン酸メチル(20g、0.095mol)のDCM(800mL)中溶液に、0℃でTFA(80mL)を滴下添加し、混合物を18℃で18時間搅拌した。混合物を濃縮し、Na₂CO₃水溶液(500mL)に希釈し、EtOAc(300mL×3回)で抽出し、Na₂SO₄で乾燥させ、濃縮して、表題化合物を得た(15g、粗生成物)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 7.76 (d, J=8.28 Hz, 1 H) 6.56 (d, J=8.28 Hz, 1 H) 5.35 (s, 2 H) 4.99 (s, 2 H) 3.83 (s, 3 H)

【0434】

ステップ8:7-ブロモ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-カルボン酸メチル

搅拌された7-アミノ-1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-4-カルボン酸メチル(15g、0.078mol)のMeCN(500mL)中溶液に、CuBr(16.8g、0.116mol)及び亜硝酸tert-ブチル(12g、0.116mol)を添加し、混合物を68℃で18時間搅拌した。混合物を濾過し、濃縮し、残渣をシリカゲルによるクロマトグラフィー(PE:EtOAc=50:1)で精製して、表題化合物を得た(15g、粗生成物)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 8.05 (d, J=7.94 Hz, 1 H) 7.86 (d, J=7.94 Hz, 1 H) 5.38 (dd, J=10.36, 1.54 Hz, 4 H) 3.95 (s, 3 H) 2.64 (s, 3 H).

【0435】

[実施例4]

実施例3と類似して、式I-51及びI-52の化合物を、出発物質として4-ニトロ-1,3-ジヒドロ-2-ベンゾチオフェンを使用して調製した。

【0436】

1,2-ビス(ブロモメチル)-3-ニトロ-ベンゼン(185.0g、0.6mol)のEtOH(3L)中溶液に、Na₂S·9H₂O(144.2g、0.6mol)を添加し、次いで混合物を10時間加熱還流した。混合物を濃縮して、EtOHを除去し、次いで水(500mL)を添加し、DCM(500mL×4回)で抽出し、合わせた有機層を、ブライン(300mL×2回)で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=50:1~20:1)で精製して、表題化合物を得た(80.1g、収率36.9%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 4.34 (s, 2 H) 4.72 (s, 2 H) 7.38 - 7.48 (m, 1 H) 7.57 (d, J=7.5 Hz, 1 H) 8.11 (d, J=8.4 Hz, 1 H)。

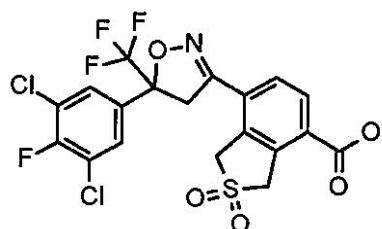
【0437】

[実施例5]

7-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,2-ジオキソ-1,3-ジヒドロ-2-ベンゾチオフェン-4-カルボン酸

【0438】

【化27】



7-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-1,3-ジヒドロ-2-ベンゾチオフェン-4-カルボン酸(2.5g、0.0052mol)のDCM(100mL)中溶液に、0℃でm-CPBA(2.4g、0.0115mol)を添加した。次いで、それをN₂下、20℃で12時間搅拌した。反応混合物を濃縮した。粗生成物を分取HPLCで精製して、表題化合物を得た(1.5g、58%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 4.33 - 4.51 (m, 2 H) 4.63 (d, J=5.29 Hz, 2 H) 4.77 (s, 2 H) 7.71 - 7.85 (m, 3 H) 8.07 (d, J=8.38 Hz, 1 H)。

【0439】

10

20

30

40

50

[実施例6]

実施例5と類似して、化合物I-42～I-50などの他のすべての硫黄酸化生成物を調製した。

【0440】

[実施例7]

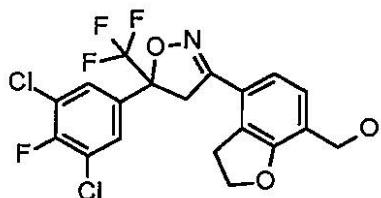
N-[[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メチル]ブタンアミド(化合物I-16)の合成

ステップ1:[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メタノール

10

【0441】

【化28】



4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-カルボン酸(6g、13mmol)のTHF(100mL)中溶液に、0℃でBH₃·Me₂S(3.9mL、39mmol)を添加した。混合物を25℃で15時間攪拌した。反応混合物をMeOH(39mL)でクエンチし、濃縮して、生成物を得た。その生成物をカラムクロマトグラフィー(PE:EtOAc=20:1～10:1)で精製して、表題化合物を得た(4g、69%)。

20

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 3.42 - 3.52 (m, 2 H) 3.73 (d, J=17.07 Hz, 1 H) 4.14 (br. s., 1 H) 4.64 - 4.73 (m, 4 H) 6.82 (d, J=7.78 Hz, 1 H) 7.20 (d, J=7.78 Hz, 1 H) 7.59 (d, J=6.02 Hz, 2 H)。

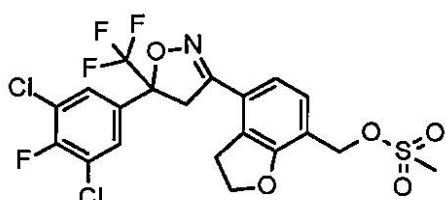
【0442】

ステップ2:[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メチルメタンスルホネート

【0443】

30

【化29】



[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メタノール(4g、9mmol)のDCM(60mL)中溶液に、0℃でTEA(2.7g、27mmol)及びMsCl(2g、18mmol)を添加した。混合物を25℃で10時間攪拌した。次いで、反応混合物をNH₄Cl水溶液(100mL)で希釈し、EtOAc(100mL×3回)で抽出し、合わせた有機層を、Na₂SO₄で乾燥させ、濃縮し、次いで、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(PE:EtOAc=15:1～10:1)で精製して、表題化合物を得た(4.6g、98%)。

40

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ = 3.16 (s, 3 H) 3.46 - 3.57 (m, 2 H) 3.70 (s, 1 H) 4.16 (s, 1 H) 4.61 (s, 2 H) 4.72 (t, J=8.91 Hz, 2 H) 6.84 (d, J=8.03 Hz, 1 H) 7.23 - 7.29 (m, 1 H) 7.60 (d, J=6.02 Hz, 2 H)

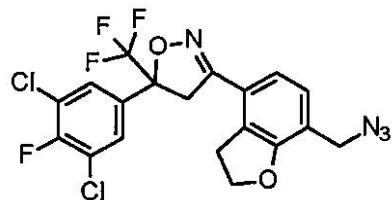
【0444】

ステップ3:3-[7-(アジドメチル)-2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イル]-5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール

【0445】

50

【化30】



[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メチルメタンスルホネート(4.6g、9mol)のDMF(60mL)中溶液に、 NaN_3 (1.2g、18mmol)を添加し、混合物を N_2 下、25 $^{\circ}\text{C}$ で13時間攪拌した。反応混合物を水(100mL)で希釈し、MTBE(100mL×3回)で抽出し、合わせた有機層を、 Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮して、表題化合物を得た(4g、97.6%)。

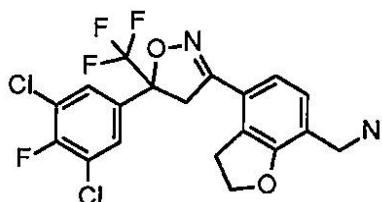
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ = 3.38 - 3.49 (m, 2 H) 3.71 (d, $J=17.64$ Hz, 1 H) 4.06 - 4.11 (m, 1 H) 4.27 (br. s., 2 H) 4.60 (t, $J=8.82$ Hz, 2 H) 6.80 (d, $J=7.94$ Hz, 1 H) 7.08 (d, $J=7.94$ Hz, 1 H) 7.53 (d, $J=5.73$ Hz, 2 H)。

【0446】

ステップ4:[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メタンアミン

【0447】

【化31】



3-[7-(アジドメチル)-2,3-ジヒドロベンゾフラン-4-イル]-5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール(4g、8mmol)の、THF(80mL)及び H_2O (80mL)中溶液に、 PPh_3 (2.7g、10mmol)を添加し、混合物を N_2 下、85 $^{\circ}\text{C}$ で2時間攪拌した。混合物をEtOAc(100mL×3回)で抽出し、合わせた有機層を、 Na_2SO_4 で乾燥させ、濃縮し、次いで残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(DCM:MeOH=15:1~10:1)で精製して、表題化合物を得た(1.5g、40%)。

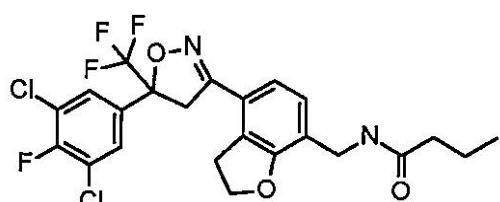
$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ = 3.39 - 3.54 (m, 2 H) 3.72 (d, $J=17.20$ Hz, 1 H) 3.83 (s, 2 H) 4.12 (d, $J=17.20$ Hz, 1 H), 4.66 (t, $J=8.82$ Hz, 2 H) 6.80 (d, $J=7.50$ Hz, 1 H) 7.13 (d, $J=7.94$ Hz, 1 H) 7.59 (d, $J=6.17$ Hz, 2 H)。

【0448】

ステップ5:N-[[4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メチル]ブタンアミド(化合物I-16)

【0449】

【化32】



4-[5-(3,5-ジクロロ-4-フルオロ-フェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2,3-ジヒドロベンゾフラン-7-イル]メタンアミン(0.15g、0.33mmol)のTHF(10mL)中溶液に、室温でトリエチルアミン(0.07g、0.67mmol、2.0当量)、その後続けてn-

10

20

30

40

50

酪酸クロリド(0.04g、0.4mmol、1.2当量)を添加し、終夜攪拌した。反応混合物を真空中で濃縮し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィーで精製して、表題化合物を得た(0.11g、65%)。

¹H-NMR (400 MHz, CDCl₃): δ=0.93 (t, 3H), 1.63 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 3.37 -3.55 (m, 2H), 3.72 (d, 1H), 4.11 (d, 1H), 4.40 (m, 1H), 4.65 (m, 2H), 6.10 (br. s, 1H), 6.79 (m, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.69 (m, 2H)。

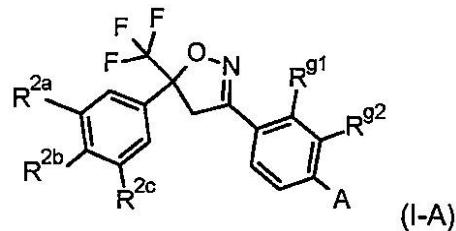
【0450】

上記の実施例と類似して、表C.1及びC.2に示す化合物I-1～I-57を調製した。

【0451】

【化33】

10



【0452】

【表2】

表C.1:式I-Aの化合物(式中、R^{2a}=R^{2c}=Cl、R^{2b}=F)

No.	R ^{g1}	R ^{g2}	A	方法	t _R [分]	m/z [M+H] ⁺
I-1	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.354	554.9
I-2	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)カルバモイル	1	1.341	567.0
I-3	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチル]カルバモイル	1	1.366	602.1
I-4	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		2-ピリジルメチルカルバモイル	1	1.169	554.1
I-5	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		[2-(アリルアミノ)-2-オキソ-エチル]カルバモイル	1	1.336	560.1
I-6	#-CH ₂ -CH ₂ -S-*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.356	570.9
I-7	#-CH ₂ -CH ₂ -S-*		(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)カルバモイル	実施例1を参照		
I-8	#-CH ₂ -CH ₂ -S-*		[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチル]カルバモイル	1	1.353	618.0
I-9	#-CH ₂ -CH ₂ -S-*		2-ピリジルメチルカルバモイル	1	1.192	570.0
I-10	#-CH ₂ -CH ₂ -S-*		[2-(アリルアミノ)-2-オキソ-エチル]カルバモイル	1	1.347	576.0
I-11	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		(3,3,3-トリフルオロプロパノイルアミノ)メチル	1	1.407	559.0
I-12	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		[(4S)-2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イル]カルバモイル	1	1.387	576.0
I-13	#-CH ₂ -CH ₂ -S-*		[(4S)-2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イル]カルバモイル	1	1.385	592.0
I-14	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		[(2-エチルスルホニルアセチル)アミノ]メチル	1	1.334	583.0
I-15	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		(シクロプロパンカルボニルアミノ)メチル	1	1.385	517.0
I-16	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		(ブタノイルアミノ)メチル	1	1.402	519.0
I-17	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		アセトアミドメチル	1	1.318	491.0
I-18	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		(プロパノイルアミノ)メチル	1	1.360	505.0
I-19	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		[(2-メチルスルホニルアセチル)アミノ]メチル	1	1.306	569.1
I-20	#-CH ₂ -CH ₂ -S(=O)-*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.146	586.9
I-21	#-CH ₂ -CH ₂ -S(=O) ₂ -*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.215	602.9
I-22	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチル]カルバモイル	1	1.331	601.9
I-23	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		(2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イル)カルバモイル	1	1.336	576.0
I-24	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.303	555.0
I-26	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		メトキシカルボニル	1	1.443	492.0
I-27	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		CO ₂ H	1	1.341	477.9
I-28	#-CH ₂ -CH ₂ -O-*		(2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4-イル)カルバモイル	1	1.404	576.0

10

20

30

40

No.	R ^{g1}	R ^{g2}	A	方法	t _R [分]	m/z [M+H] ⁺
I-29	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		2-ピリジルメチルカルバモイル	1	1.154	554.0
I-30	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.352	569.0
I-31	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		2-ピリジルメチルカルバモイル	2	1.162	568.0
I-32	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ) エチル]カルバモイル	1	1.357	616.0
I-33	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)カルバモイル	1	1.328	580.9
I-34	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		[(4R)-2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4- イル]カルバモイル	1	1.376	590.0
I-35	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		[2-(アリルアミノ)-2-オキソ-エチル]カルバモイル	1	1.300	229.6
I-36	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		シクロブチルカルバモイル	1	1.423	516.7
I-37	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		チエタン-3-イルカルバモイル	1	1.372	534.9
I-38	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		シクロプロピルメチルカルバモイル	1	1.377	517.0
I-39	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		シクロプロピルカルバモイル	1	1.325	502.9
I-40	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		[(4S)-2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4- イル]カルバモイル	1	1.296	575.9
I-41	#-CH ₂ -O-CH ₂ -*		(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)カルバモイル	1	1.259	567.0
I-42	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.239	602.6
I-43	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		2-ピリジルメチルカルバモイル	1	1.137	603.4
I-44	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ) エチル]カルバモイル	1	1.235	649.9
I-45	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		[2-(アリルアミノ)-2-オキソ-エチル]カルバモイル	1	1.206	608.0
I-46	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		シクロブチルカルバモイル	1	1.297	565.0
I-47	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		シクロプロピルメチルカルバモイル	1	1.332	564.6
I-48	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		シクロプロピルカルバモイル	1	1.248	550.9
I-49	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		[(4S)-2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4- イル]カルバモイル	1	1.266	623.6
I-50	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		チエタン-3-イルカルバモイル	1	1.322	582.5
I-51	#-CH ₂ -S-CH ₂ -*		(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)カルバモイル	1	1.380	580.8
I-52	#-CH ₂ -S-CH ₂ -*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.333	571.0
I-53	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		(1,1-ジオキソチエタン-3-イル)カルバモイル	1	1.332	564.6
I-54	#-CH ₂ -S(=O) ₂ -CH ₂ -*		[(4R)-2-エチル-3-オキソ-イソオキサゾリジン-4- イル]カルバモイル	1	1.249	624.0
I-58	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		(ブタノイルアミノ)メチル	1	1.344	519.1 ^a

^a I-58の¹H-NMR(400MHz, CDCl₃): δ = 1.15 (m, 3H), 1.94-2.08 (m, 2H), 2.22 (m, 2H), 3.01 (m, 2H), 3.73 (d, 1H), 4.09 (d, 1H), 4.18-4.29 (m, 2H), 4.40 (d, 2H), 5.97 (m, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.58 (m, 2H)。

R^{g1}の位置における結合点

* R^{g2}の位置における結合点

【表3】

表C.2:式I-Aの化合物(式中、R^{2a}=R^{2c}=Cl、R^{2b}=H)

No.	R ^{g1}	R ^{g2}	A	方法	t _R [分]	m/z [M+H] ⁺
I-56	#-O-CH ₂ -O-*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.272	539.0
I-57	#-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-*		ピリミジン-2-イルメチルカルバモイル	1	1.377	552.4

【0454】

II. 殺有害生物活性の評価:

本発明の式Iの化合物の活性は、以下の生物試験により実証して評価した。

【0455】

B.1 コナガ(Diamond back moth)(プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella))

活性化合物を、蒸留水:アセトンの1:1(vol:vol)の混合物中に所望の濃度で溶解した。界面活性剤(カイネティック(Kinetic)HV)を0.01%(vol/vol)の割合で添加した。試験溶液を使用する日に調製した。

キャベツの葉を試験溶液中に浸漬して空気乾燥した。処理した葉を、湿潤ろ紙を並べたペトリ皿に入れ、10匹の三齢の幼虫と一緒にインキュベートした。処理から72時間後に致死率を記録した。食害もまた、0~100%の尺度を使用して記録した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-41、I-42、I-44、I-46、I-47、I-48、I-51、I-52、I-56、I-57は、300ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0456】

B.2 モモアカアブラムシ(Green Peach Aphid)(ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae))

浸透的手段によるモモアカアブラムシ(ミズス・ペルシカエ)の防除を評価するため、人工膜下で人工液状食餌を含有する96ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物を、水75%v/v及びDMSO25%v/vを含有する溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物を、注文製のピペッターを使用して2回反復でアブラムシ用食餌にピペット注入した。

施用後、5~8匹の成体アブラムシをマイクロタイタープレートウェル内部の人工膜上に置いた。次に、処理済みアブラムシ用食餌をアブラムシに吸汁させて、約23±1及び相対湿度約50±5%で3日間インキュベートした。その後、アブラムシの致死率及び繁殖性を目視で評価した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-26、I-28、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-37、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-54、I-56、I-57は、2500ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0457】

B.3 ソラマメヒゲナガアブラムシ(Vetch aphid)(メゴウラ・ウィキアエ(Megoura viciae))

接触手段又は浸透的手段によりソラマメヒゲナガアブラムシ(メゴウラ・ウィキアエ)の防除を評価するため、ソラマメの葉の幅広いディスクを含有する24ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75%v/v及びDMSO25%v/vを含有する溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物2.5μlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して2回反復で葉のディスクにスプレーした。

10

20

30

40

50

施用後、葉のディスクを空気乾燥し、マイクロタイタープレートウェル内部の葉のディスク上に5~8匹の成体アブラムシを置いた。次に、処理済みの葉のディスクをアブラムシに吸汁させて、約23±1 及び相対湿度約50±5%で5日間インキュベートした。その後、アブラムシの致死率及び繁殖性を目視で評価した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-28、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-37、I-41、I-43、I-46、I-47、I-48、I-50、I-54は、2500ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0458】

B.4 オオタバコガ(Tobacco budworm)(ヘリオティス・ウィレスケンス(*Heliothis virescens*))

オオタバコガ(ヘリオティス・ウィレスケンス)の防除を評価するために、昆虫の食餌及び15~25個のH・ウィレスケンスの卵を含有する96ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75%v/v及びDMSO25%v/vを含有する溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物10μlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して2回反復で昆虫用食餌にスプレーした。

施用後、マイクロタイタープレートを約28±1 及び相対湿度約80±5%で5日間インキュベートした。次に、卵及び幼虫の致死率を目視で評価した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-26、I-28、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-37、I-40、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-54、I-56、I-57は、2500ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0459】

B.5 ワタミハナゾウムシ(Boll weevil)(アントノムス・グランディス(*Anthonomus grandis*))

ワタミハナゾウムシ(アントノムス・グランディス)の防除を評価するため、昆虫の食餌及び5~10個のA・グランディスの卵を含有する96ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75%v/v及びDMSO25%v/vを含有する溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物5μlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して2回反復で昆虫用食餌にスプレーした。

施用後、マイクロタイタープレートを約25±1 及び相対湿度約75±5%で5日間インキュベートした。その後、卵及び幼虫の致死率を目視で評価した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-26、I-27、I-28、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-37、I-40、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-54、I-56、I-57は、2500ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0460】

B.6 チチュウカイミバエ(Mediterranean fruitfly)(ケラティティス・カピタタ(*Ceratitis capitata*))

チチュウカイミバエ(ケラティティス・カピタタ)の防除を評価するため、昆虫用食餌及び50~80個のC・カピタタの卵を含有するマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75%v/v及びDMSO25%v/vを含有する溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物5μlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して2回反復で昆虫用食餌にスプレーした。

施用後、マイクロタイタープレートを約28±1 及び相対湿度約80±5%で5日間インキュ

10

20

30

40

50

ペートした。その後、卵及び幼虫の致死率を目視で評価した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-28、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-37、I-40、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-54は、2500ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0461】

B.7 ランアザミウマ(Orchid thrips)(ジクロモトリップス・コルベッティ(dichromothrips corbetti))

バイオアッセイに使用する成体ジクロモトリップス・コルベッティを実験室条件下で連続的に維持したコロニーから得た。試験目的のため、試験化合物を、アセトン:水の1:1 (vol/vol)の混合物中に希釈し、さらに、Kinetic HVを0.01% v/vの割合で添加する。

各化合物のアザミウマに対する効力は、花浸漬技術を用いて評価した。健全な個々のランの花の花弁をすべて処理溶液中に浸漬し、ペトリ皿中で乾燥させた。処理した花弁を、約20匹の成体アザミウマと一緒に各再封可能なプラスチック中に置いた。アッセイの間、すべての試験場所を、連続光及び約28°Cの温度下にて保持した。3日後、各花弁上の生存しているアザミウマの数を数えた。処理から72時間後に致死率(%)を記録した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-40、I-41、I-42、I-43、I-44、I-45、I-46、I-47、I-48、I-49、I-50、I-51、I-52、I-53、I-54、I-56、I-57は、300ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0462】

B.8 イネツマグロヨコバイ(Rice green leafhopper)(ネホテッテティクス・ヴィレスケンス(Nephrotettix virescens))

スプレーの24時間前に、イネ苗木をきれいにして洗浄した。活性化合物を1:1(vol:vol)のアセトン:水の中に配合し、0.01%vol/volの界面活性剤(Kinetic HV)を添加した。鉢植えのイネ苗木に5~6mlの試験溶液をスプレーして空気乾燥させ、マイラーケージ(Mylar cage)で覆い、10匹の成体を接種した。処理したイネ植物を約28~29°C及び相対湿度約50~60%で保持した。72時間後に致死率(%)を記録した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-4、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-12、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-28、I-30、I-31、I-33、I-34、I-36、I-37、I-38、I-39、I-52は、300ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0463】

B.9 ハダニ(Red spider Mite)(カンザワハダニ(Tetranychus kanzawai))

活性化合物を、蒸留水:アセトンの1:1(vol/vol)の混合物中に所望の濃度で溶解した。界面活性剤(Kinetic HV)を、0.01%(vol/vol)の割合で添加した。試験溶液を使用する日に調製した。

4~5日齢の鉢植えパウピービーンズを水道水で洗浄し、空気駆動式携帯型噴霧器を使用して試験溶液1~2mlをスプレーした。処理した植物を空気乾燥させ、その後、飼育集団からキャッサバの葉の一部分を切り取ることにより、30匹以上のダニと共にインキュベートした。処理した植物を約25~27°C及び相対湿度約50~60%の維持室の内部に置いた。処理から72時間後に致死率(%)を評価した。

この試験において、化合物I-7、I-9、I-11、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-28、I-29、I-34、I-54は、300ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0464】

B.10 アワヨトウ(Southern armyworm)(スパドプテラ・エリダニア(Spodoptera eridania))

10

20

30

40

50

活性化合物を、チューブ中で供給される10,000ppmの溶液として、シクロヘキサン中に製剤化した。噴霧ノズルを装備した自動式静電噴霧装置に、これらのチューブを装着し、これらを50%アセトン:50%水(v/v)中でさらに低い希釈度とするための原液として役立てた。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))を0.01%(v/v)の体積でこの溶液に含まれた。

ライマメ植物(Sieva品種)を1鉢に2植物生育させ、処理のために第一本葉段階で選抜した。試験溶液を、噴霧スプレー ノズルを備えた自動静電植物噴霧器によって葉上にスプレーした。この植物を、噴霧器のドラフト中で乾燥させ、その後噴霧器から取り出した。各鉢を、ジップクロージャーを有する有孔プラスチック製バッグに入れた。このバッグに約10~11匹のアワヨトウ幼虫を入れ、バッグをジッパーで閉じた。試験植物を、蛍光灯(24時間光周期)への直接曝露を避けてバッグ内に熱がこもるのを防ぎながら、約25¹⁰、及び約20~40%の相対湿度の生育室中で4日間保持した。致死率及び低下した摂食を、処理の4日後に未処理の対照植物と比較して評価した。

この試験において、化合物I-6、I-7、I-9、I-10、I-11、I-15、I-17、I-18、I-20、I-21、I-33、I-34、I-37、I-38、I-39、I-42、I-43、I-47、I-48は、10ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0465】

B.11 ミナミアオカメムシ(Green Soldier Stink Bug)(ネザラ・ビリデュラ(*Nezara viridula*))

活性化合物を、蒸留水:アセトンの1:1(vol/vol)の混合物中に所望の濃度で溶解した。
界面活性剤(Kinetic HV)を、0.01%(vol/vol)の割合で添加した。試験溶液を使用する日に調製した。

湿潤ろ紙を敷いたガラス製ペトリ皿にサイズのさやを置き、10匹の第3齢後期のN.ビリデュラ(*N. viridula*)を接種した。携帯型噴霧器を使用して、およそ2mlの溶液を各ペトリ皿にスプレーする。アッセイ領域を、約25²⁰に維持した。5日後の致死率(%)を記録した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-6、I-7、I-8、I-9、I-10、I-11、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-28、I-29、I-33、I-34は、300ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0466】

B.12 ネオトロピカルブラウンカメムシ(neotropical brown stink bug)(エウスキスツス・ヘロス(*Euschistus heros*))

活性化合物を、蒸留水:アセトンの1:1(vol/vol)の混合物中に所望の濃度で溶解した。
界面活性剤(Kinetic HV)を、0.01%(vol/vol)の割合で添加した。試験溶液を使用する日に調製した。

電子レンジで使えるプラスチック製カップにサイズのさやを置き、10匹の成虫期のE.ヘロス(*E. heros*)を接種した。携帯型噴霧器を使用して、およそ1mlの溶液を各カップ及び存在する餌にスプレーする。水源を与えた(水を含む綿芯(cotton wick))。各処理を2回繰り返した。アッセイ領域を約25³⁰で維持した。致死率(%)を5日後に記録した。

この試験において、化合物I-1、I-2、I-6、I-7、I-9、I-10、I-11、I-15、I-17、I-18、I-20、I-23は、100ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。⁴⁰

【0467】

B.13 クサギカメムシ(Brown Marmorated Stink Bug)(ハリオモルファ・ハリス(*Halyomorpha halys*))

活性化合物を、蒸留水:アセトンの1:1(vol/vol)の混合物中に所望の濃度で溶解した。
界面活性剤(Kinetic HV)を、0.01%(vol/vol)の割合で添加した。試験溶液を使用する日に調製した。

生のピーナッツ(Row peanuts)及びサイズの種を電子レンジで使えるプラスチック製カップに置き、5匹の成虫期のH.ハリス(*H. halys*)を接種した。携帯型噴霧器を使用して、およそ1mlの溶液を各カップ、昆虫及び存在する餌にスプレーする。水源を与えた(水を含む綿芯(cotton wick))。各処理を4回繰り返した。アッセイ領域を約25⁵⁰で維持した。致

死率(%)を5日後に記録した。

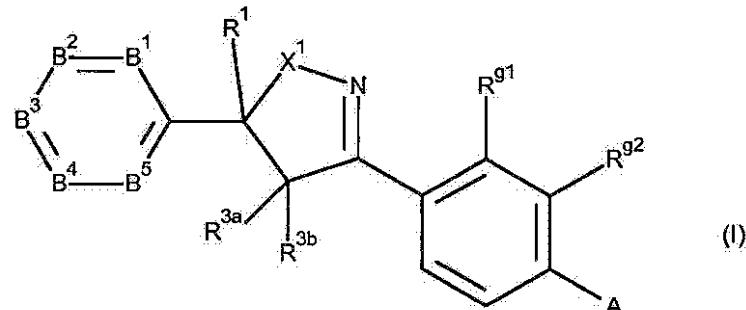
この試験において、化合物I-6、I-7、I-8、I-9、I-15、I-17、I-18、I-20、I-21、I-34、I-37は、100ppmで、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

いくつかの実施形態を以下に示す。

項1

式Iのアゾリン化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的又は獣医学的に許容される塩

【化34】



10

{式中、

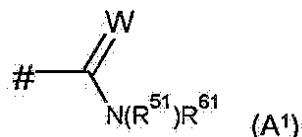
X¹は、O又はCH₂であり、

Aは、基A¹又は基A²であり、

ここで、

A¹は、次式

【化35】



20

[式中、

#は、式(I)の芳香族環への結合を表し、

Wは、O及びSから選択される]

30

の基であり、

A²は、基-C(R^{7a})(R^{7b})-N(R⁵²)-C(=O)-R⁶²であり、

B¹、B²、B³、B⁴及びB⁵は、独立して、N及びCR²からなる群から選択され、ただし、B¹、B²、B³、B⁴及びB⁵のうち、最大で1つは、Nであることを条件とし、

R^{g1}及びR^{g2}は、一緒にになって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂CH₂-、-CH₂S(O)_pCH₂-、-S(O)_pCH₂S(O)_p-、-OCH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂O-、-CH₂CH₂OCH₂-、-CH₂CH₂OCH₂-、-OCH₂CH₂O-、-OCH₂OCH₂-、-CH₂OCH₂O-、-S(O)_pCH₂CH₂CH₂-、-CH₂CH₂CH₂S(O)_p-、-CH₂S(O)_pCH₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)_pCH₂-、-S(O)_pCH₂CH₂O-、-CH₂CH₂S(O)_p-、-S(O)_pCH₂OCH₂-、-OCH₂S(O)_pCH₂-、-CH₂OCH₂S(O)_p-及び-CH₂S(O)_pCH₂O-から選択される架橋基を形成しており、

40

ここで、pは、0、1又は2であり、

上記の基の水素原子は、ハロゲン、メチル、ハロゲン化メチル、ヒドロキシル、メトキシ及びハロゲン化メトキシから選択される1個以上の置換基で置換されていてもよく、かつ/又は上記の基の1若しくは2個のCH₂基は、C=O基で置換されていてもよく、

R¹は、C₁-ハロアルキルであり、

各R²は、独立して、水素、ハロゲン、C₁～C₂-ハロアルコキシ及びC₁～C₂-ハロアルキルからなる群から選択され、

R^{3a}及びR^{3b}は、互いに独立して、水素及びハロゲンから選択され、

R^{7a}及びR^{7b}は、互いに独立して、水素、シアノ、メチル及びC₁-ハロアルキルから選択さ

50

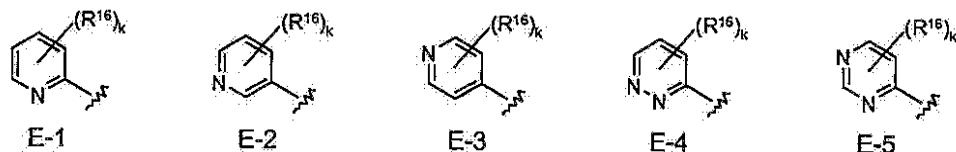
れ、

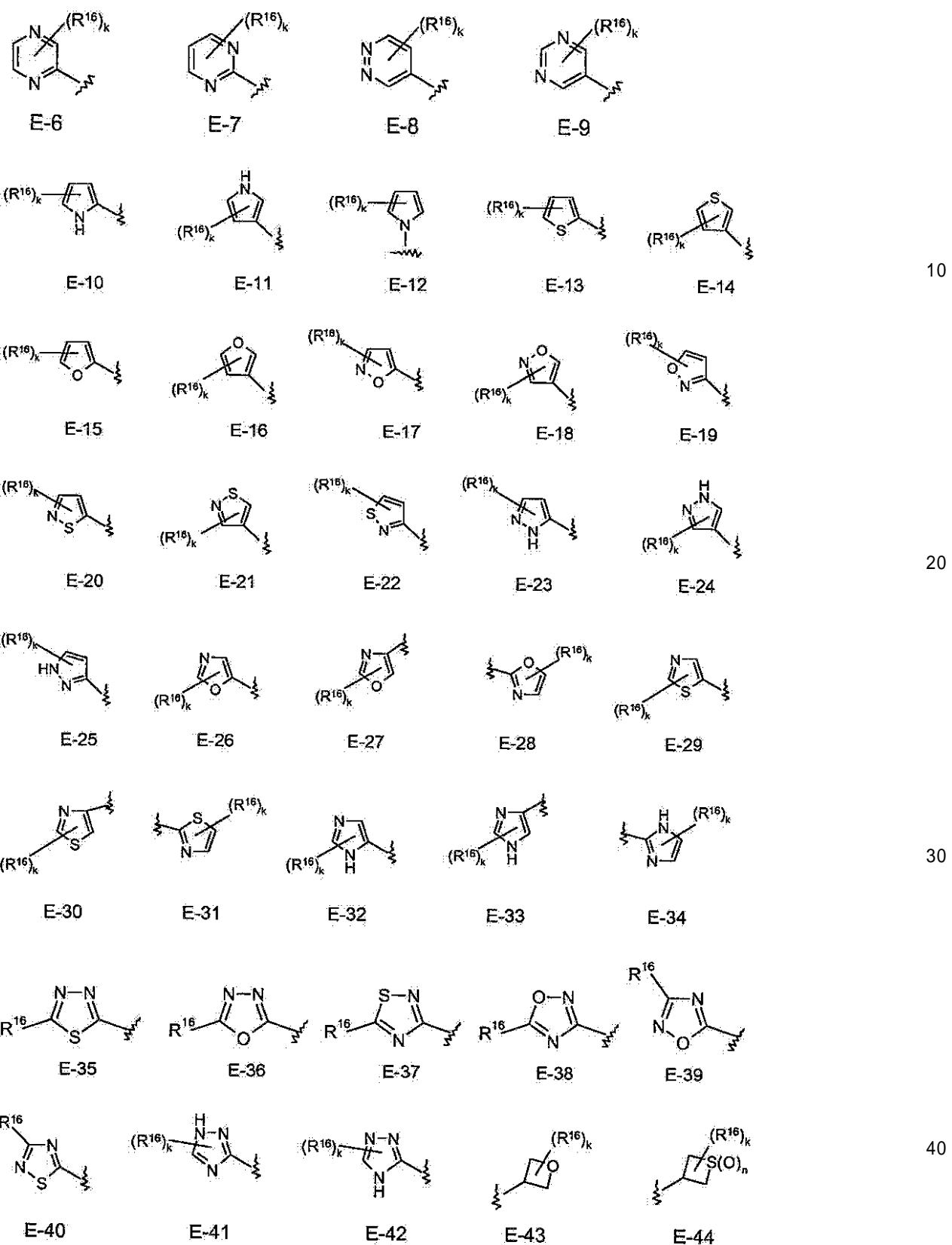
R^{51} 及び R^{52} は、互いに独立して、水素、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ -アルキニル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシメチル及び CH_2-CN からなる群から選択され、

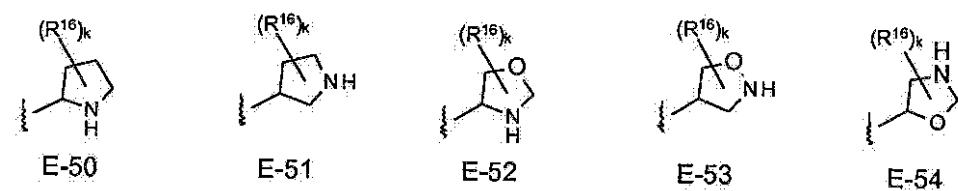
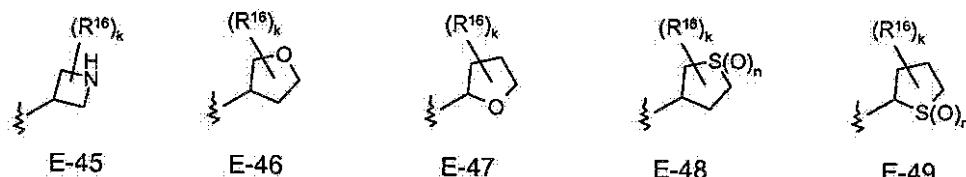
R^{61} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、1又は2個の基 R^{81} を有する $C_1 \sim C_6$ -アルキル、1個の基 R^{81} を有する $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、1又は2個のCN置換基で置換されていてもよい $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $-N(R^{101a})R^{101b}$ 、 $-CH=NOR^{91}$ 、1、2、3、4、又は5個の置換基 R^{16} で置換されていてもよいフェニル、及び環E-1～E-63

【化36】

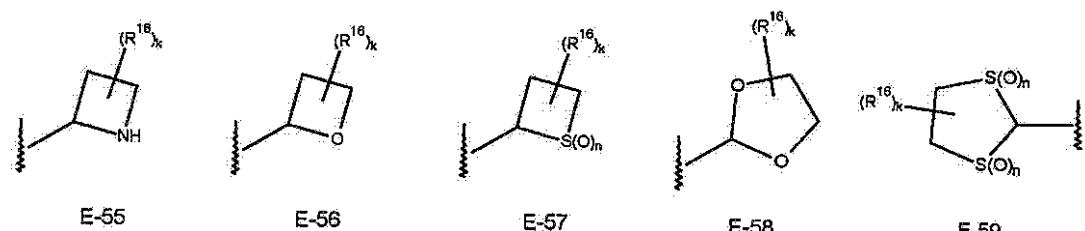
10



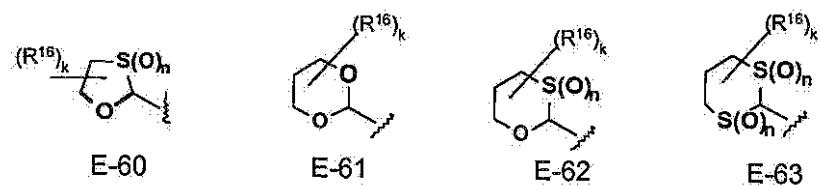




10



20



30

[ここで、環E-1～E-63において、

ジグザグの線は、分子の残部への結合点を表し、

k は、0、1、2又は3であり、

n は、0、1又は2であり、

R^{16} は、以下に定義する通りである]

から選択される複素環式環からなる群から選択され、

R^{62} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、1又は2個の基 R^{82} で置換されるい
る C_1 ～ C_6 -アルキル、1個の基 R^{82} を有する C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_6 -アルケニル、 C_2
～ C_6 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_6 -アルキニル、 C_2 ～ C_6 -ハロアルキニル、CN置換基を場合に
よって有する C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 $-N(R^{102a})R^{102b}$ 、 $-C
(=O)N(R^{112a})R^{112b}$ 、 $-CH=NOR^{92}$ 、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によつて置換され
ているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環からな
る群から選択され、

各 R^{81} は、独立して、OH、CN、CN又は C_1 -ハロアルキル置換基を場合によつて有する C_3 ～ C_8
-シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 ～ C_6 -アルコキシ、 C_1 ～ C_6 -ハロアルコ
キシ、 C_1 ～ C_6 -アルキルチオ、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1 ～ C_6 -アルキルスルフィニル
、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1 ～ C_6 -アルキルスルホニル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキ
ルスルホニル、 $-C(=O)N(R^{101c})R^{101d}$ 、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によつて置
換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から
選択され、

各 R^{82} は、独立して、OH、CN、CN又は C_1 -ハロアルキル置換基を場合によつて有する C_3 ～ C_6
-シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 ～ C_6 -アルコキシ、 C_1 ～ C_6 -ハロアルコ
キシ、 C_1 ～ C_6 -アルキルチオ、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1 ～ C_6 -アルキルスルフィニル
、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1 ～ C_6 -アルキルスルホニル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキ

40

50

ルスルホニル、 $-C(=O)N(R^{102c})R^{102d}$ 、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

R^{91} 及び R^{92} は、互いに独立して、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル及び C_1 ～ C_6 -ハロアルキルから選択され、

R^{101a} 、 R^{102a} 、 R^{102c} 及び R^{112a} は、互いに独立して、水素及び C_1 ～ C_6 -アルキルから選択され、

R^{101b} は、水素、 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-42の環から選択される複素環式環から選択され、

R^{102b} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 CH_2-CN 、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキルメチル、1、2、3、4又は5個の置換基 R^{16} で場合によって置換されているフェニル、及び上記で定義した式E-1～E-42の環から選択される複素環式環から選択され、

R^{101c} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_2 ～ C_3 -アルキニル及び CH_2-CN からなる群から選択され、

R^{101d} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 CH_2-CN 、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキルメチル、 C_1 ～ C_6 -アルコキシ、 C_1 ～ C_6 -ハロアルコキシ、フェニル(フェニルは、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシ、 C_1 ～ C_4 -アルキルチオ及び C_1 ～ C_4 -ハロアルキルチオからなる群から選択される1、2、3、4又は5個の置換基で場合によって置換されている)、並びに上記で定義した式E-1～E-63の環から選択される複素環式環からなる群から選択され、

R^{102d} 及び R^{112b} は、互いに独立して、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_6 -アルケニル、 C_2 ～ C_6 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_6 -アルキニル、 C_2 ～ C_6 -ハロアルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル及び C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキルメチルから選択され、

R^{14a} は、水素及び C_1 ～ C_6 -アルキルからなる群から選択され、

R^{14b} は、水素、 C_1 ～ C_6 -アルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 CH_2-CN 、 C_1 ～ C_6 -ハロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキルメチル、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ及び C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシからなる群から選択され、

各 R^{16} は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキル、 C_2 ～ C_4 -アルケニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルケニル、 C_2 ～ C_4 -アルキニル、 C_2 ～ C_4 -ハロアルキニル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_3 ～ C_6 -シクロアルキル、 C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_3 ～ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 ～ C_4 -アルキル、 C_1 ～ C_4 -アルコキシ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルコキシ、 C_1 ～ C_4 -アルキルチオ、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルチオ、 C_1 ～ C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1 ～ C_4 -アルキルスルホニル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルスルホニル、 C_1 ～ C_4 -アルキルカルボニル、 C_1 ～ C_4 -ハロアルキルカルボニル、アミノカルボニル、 C_1 ～ C_4 -アルキルアミノカルボニル及びジ-(C_1 ～ C_4 -アルキル)アミノカルボニルからなる群から選択され、又は

飽和環の同じ炭素原子上に存在する2個の R^{16} は、一緒になって、 $=O$ 若しくは $=S$ を形成してもよく、又は

複素環式環の同じS若しくはSO環員上に存在する2個の R^{16} は、一緒になって、基 $=N(C_1$ ～ C_6 -アルキル)、 $=NO(C_1$ ～ C_6 -アルキル)、 $=NN(H)(C_1$ ～ C_6 -アルキル)若しくは $=NN(C_1$ ～ C_6 -アルキル)₂を形成してもよい}。

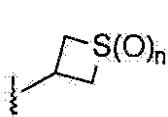
10

20

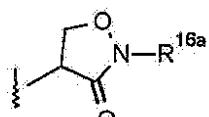
30

40

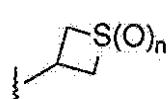
50

項 2 X^1 が 0 である、項 1 に記載の化合物。項 3 X^1 が CH_2 である、項 1 に記載の化合物。項 4 W が 0 である、項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。項 5 A が 基 A^1 であり、ここで、 R^{51} は 水素 であり、 R^{61} は 項 1 で 定義される 通り である、項 1 ~ 4 の い ず れ か 1 項 に 記 載 の 化 合 物。項 6 R^{61} が、1 個 の 基 R^{81} を 有 す る C_1 ~ C_2 -アルキル、1 個 の 基 R^{81} を 有 す る C_1 ~ C_2 -ハロアルキル、1 又 は 2 個 の CN 置換 基 で 置換 さ れ て い て も よ い C_3 ~ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ~ C_6 -ハロシクロアルキル、並びに 環 E-44 及 び 環 E-53 か ら 選 択 さ れ る 複 素 環 式 環 か ら な る 群 か ら 選 択 さ れ、こ こ で、 R^{81} は、CN 又 は C_1 -ハロアルキル 置換 基 を 場 合 に よ つて 有 す る C_3 ~ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ~ C_6 -ハロシクロアルキル、 $-C(=O)N(R^{101c})R^{101d}$ 、及 び 項 1 で 定義 さ れ る 環 E-1 ~ E-63、特 に 環 E-1 ~ E-9 か ら 選 択 さ れ る 複 素 環 式 環 か ら な る 群 か ら 選 択 さ れ、こ こ で、 R^{101c} は、水 素 及 び C_1 ~ C_4 -アルキル か ら な る 群 か ら 選 択 さ れ、 R^{101d} は、水 素、 C_1 ~ C_6 -アルキル 及 び C_1 ~ C_6 -ハロアルキル か ら な る 群 か ら 選 択 さ れ る、項 1 ~ 5 の い ず れ か 1 項 に 記 載 の 化 合 物。項 7 R^{61} が、環 E-44-1 及 び 環 E-53-1【化 3 7】

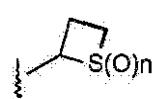
E-44-1



E-53-1

か ら 選 択 さ れ、 R^{81} が、環 E-44-1 及 び 環 E-57-1【化 3 8】

E-44-1



E-57-1

か ら 選 択 さ れ、こ こ で、 n は、0、1 又 は 2 で あ り、 R^{16a} は、水 素、 C_1 ~ C_4 -アルキル、 C_1 ~ C_4 -ハロアルキル、 C_3 ~ C_6 -シクロアルキル、 C_3 ~ C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 ~ C_4 -アルケニル、 C_2 ~ C_4 -ハロアルケニル、 C_2 ~ C_4 -アルキニル、 C_2 ~ C_4 -ハロアルキニル 及 び CH_2 -(C_3 ~ C_6 -シクロアルキル) か ら な る 群 か ら 選 択 さ れ、特 に 水 素 及 び C_1 ~ C_4 -アルキル か ら 選 択 さ れ る、項 1 ~ 6 の い ず れ か 1 項 に 記 載 の 化 合 物。項 8 A が 基 A^2 で あ り、こ こ で、 R^{7a} は、水 素 で あ り、 R^{7b} は、水 素、 CH_3 、 CF_3 及 び CN か ら 選 択 さ れ、 R^{52} は、水 素 及 び C_1 ~ C_3 -アルキル か ら 選 択 さ れ、

10

20

40

50

R⁶²は、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1個の基R⁸²で置換されているC₁～C₄-アルキル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、1、2、3、4又は5個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び項1で定義される式E-1～E-63の環から選択される複素環式環から選択され、ここで、

R⁸²は、CN、CN又はCF₃置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル、1、2又は3個の置換基R¹⁶で場合によって置換されているフェニル、及び項1で定義される環E-1～E-63から選択される複素環式環から選択され、

フェニル及び環E-1～E-63におけるR¹⁶は、ハロゲン、シアノ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₁～C₄-アルコキシ及びC₁～C₄-ハロアルコキシから選択される、項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

項 9

R^{7a}及びR^{7b}が、水素であり、

R⁵²が、水素であり、

R⁶²が、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、1個の基R⁸²で置換されているC₁～C₄-アルキル、CN置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、及びC₃～C₆-ハロシクロアルキルから選択され、ここで、

R⁸²は、CN、CN又はCF₃置換基を場合によって有するC₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルキルチオ、C₁～C₆-ハロアルキルチオ、C₁～C₆-アルキルスルフィニル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆-アルキルスルホニル及びC₁～C₆-ハロアルキルスルホニルから選択され、特にC₁～C₆-アルキルスルホニル及びC₁～C₆-ハロアルキルスルホニルから選択される、項8に記載の化合物。

項 10

B¹、B³、B⁴及びB⁵がCR²であり、ここで、R²は項1で定義される通りであり、B²がCR²であり、ここで、R²は項1で定義される通りであるが、水素ではない、項1～9のいずれか1項に記載の化合物。

項 11

R²が、水素、F、Cl、Br、OCF₃及びCF₃から選択され、特に水素、F及びClから選択される、項1～10のいずれか1項に記載の化合物。

項 12

R⁹¹及びR⁹²が、一緒になって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-SCH₂CH₂-、-CH₂SCH₂-、-SCH₂S-、-OCH₂S-、-SCH₂O-、-CH₂CH₂S(O)-、-S(O)CH₂CH₂-、-CH₂S(O)CH₂-、-CH₂CH₂S(O)₂-、-S(O)₂CH₂CH₂-、-CH₂S(O)₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)₂CH₂O-及び-OCH₂CH₂CH₂-から選択される架橋基を形成しており、特に-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-SCH₂CH₂-、-CH₂SCH₂-、-SCH₂S-、-OCH₂S-及び-SCH₂O-から選択される架橋基を形成している、項1～11のいずれか1項に記載の化合物。

項 13

R⁹¹及びR⁹²が、一緒になって、-CH₂CH₂O-、-OCH₂CH₂-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-及び-SCH₂CH₂-から選択される架橋基を形成しており、特に-CH₂CH₂O-(ここで、OはR⁹²の位置において結合している)を形成している、項12に記載の化合物。

項 14

R⁹¹及びR⁹²が、一緒になって、-CH₂CH₂O-、-CH₂OCH₂-、-OCH₂O-、-CH₂CH₂S-、-SCH₂CH₂-、-CH₂CH₂S(O)-、-CH₂S(O)CH₂-、-CH₂CH₂S(O)₂-、-CH₂S(O)₂CH₂-及び-CH₂CH₂CH₂O-から選択される架橋基を形成している、項12に記載の化合物。

項 15

R¹がCF₃である、項1～14のいずれか1項に記載の化合物。

項 16

10

20

30

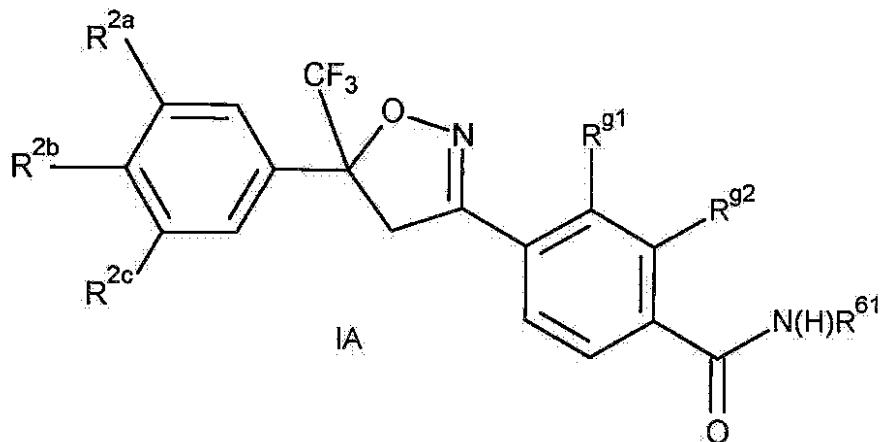
40

50

R^{3a}及びR^{3b}が、互いに独立して、水素又はフッ素であり、特に水素である、項1～15のいずれか1項に記載の化合物。

項 1 7

項1、2、4～7及び10～16のいずれか1項に記載の化合物であって、式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩
【化39】



{式中、

R^{g1} 及び R^{g2} は、項1又は12~14のいずれか1項で定義される通りであり、

R^{2a} は、CI であり、 R^{2b} は、F であり、 R^{2c} は、CI であり、

$R^{6,1}$ は、 $CH_2-C(O)-N(H)-R^{1,0,1,d}$

「式中、

R^{101d} は、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル、1又は2個のフッ素原子で置換されている $C_2 \sim C_4$ -アルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 CH_2-CN 、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル及び $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルメチルからなる群から選択される]である]

頂 1 8

項1～2 4～7及び10～16のいずれか1項に記載の化合物であつて

頂1、2、4、7及び10-100%の割合で1項に記載の化合物であると、

R^{2a} が C である R^{2b} が E である R^{2c} が C である

R⁶ が、Cl であり

「由式」

R^{8^1} は、項1～7で定義される環E-5、E-6、E-7、E-19、E-25、E-27、E-44-1及びE-57-1から選択され、ここで、環E-5、E-6、E-7、E-19、及びE-27は、非置換であり(k は0である)、又は1若しくは2個の置換基 R^{16} を有し(k は1又は2である)、ここで、

各R¹⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-ハロアルキル、C₁～C₂-アルコキシ、C₁～C₂-ハロアルコキシ、C₁～C₂-アルキルチオ、C₁～C₂-ハロアルキルチオ、C₁～C₂-アルキルスルフィニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₂-アルキルスルホニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルホニル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₂～C₃-アルケニル、C₂～C₃-アルキニルから選択され、

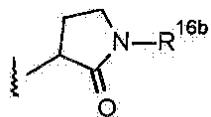
ここで、環E-25は、1位の窒素原子上に1個のR¹⁶置換基を有し、1又は2個のさらなる置換基R¹⁶を場合によって有し、ここで、

R¹⁶は、上記で定義した通りであるが、E-25の1位に結合しているR¹⁶は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁～C₂-アルコキシ、C₁～C₂-ハロアルコキシ、C₁～C₂-アルキルチオ、C₁～C₂-ハロアルキルチオ、C₁～C₂-アルキルスルフィニル、C₁～C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₂-アルキルスルホニル又はC₁～C₂-ハロアルキルスルホニルではない】
である、項17で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獸医学的に許容される塩。

項 1 9

項1、2、4~7及び10~16のいずれか1項に記載の化合物であって、
R⁹¹及びR⁹²が、項1又は12~14のいずれか1項で定義される通りであり、
R²^aが、CIであり、R²^bが、Fであり、R²^cが、CIであり、
R⁶¹が、項1又は7で定義される環E-2、E-4、E-6、E-8、E-9、E-44-1、E-46、E-51及びE-53
-1から選択され、ここで、環E-2、E-4、E-6、E-8、E-9、及びE-46は、非置換であり(kは0
である)、又は1若しくは2個の置換基R¹⁶を有し(kは1又は2である)、ここで、
各R¹⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₂-アルキル、C₁~C₂-ハロアル
キル、C₁~C₂-アルコキシ、C₁~C₂-ハロアルコキシ、C₁~C₂-アルキルチオ、C₁~C₂-ハロ
アルキルチオ、C₁~C₂-アルキルスルフィニル、C₁~C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁~
C₂-アルキルスルホニル、C₁~C₂-ハロアルキルスルホニル、C₃~C₄-シクロアルキル、C₃
~C₄-ハロシクロアルキル、C₂~C₃-アルケニル、及びC₂~C₃-アルキニルから選択され、
ここで、環E-51は、式E-51-1

【化 4 0】



E-51-1

[式中、

R¹⁶^bは、水素、C₁~C₂-アルキル、C₁~C₂-ハロアルキル、C₃~C₄-シクロアルキル、C₃~C₄-ハロシクロアルキル、C₂~C₃-アルケニル及びC₂~C₃-アルキニルからなる群から選択される】

の環である、項17で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩。

項 2 0

項1~7及び10~16のいずれか1項に記載の化合物であって、
R⁹¹及びR⁹²が、項1又は12~14のいずれか1項で定義される通りであり、
R²^aが、CIであり、R²^bが、Fであり、R²^cが、CIであり、
R⁶¹が、1又は2個のフッ素原子で置換されていてもよいC₂~C₄-アルキル、シクロプロピル
、C₃~C₅-ハロシクロアルキル、CH₂-(C₃~C₅-ハロシクロアルキル)、CH₂-(1-シアノ-(C₃
~C₅-シクロアルキル))、C₂~C₄-アルケニル、C₂~C₄-アルキニル、CH₂-CN及び-CH=NOR⁹¹
(式中、R⁹¹は、C₁~C₃-アルキル及びC₁~C₃-ハロアルキルから選択される)から選択され
る、項17で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若し
くは獣医学的に許容される塩。

項 2 1

項1~7及び10~16のいずれか1項に記載の化合物であって、
R⁹¹及びR⁹²が、項1又は12~14のいずれか1項で定義される通りであり、
R²^aが、CIであり、R²^bが、Fであり、R²^cが、CIであり、
R⁶¹が、N(H)R¹⁰¹^b

[式中、

R¹⁰¹^bは、-C(O)-N(H)R¹⁴^b、並びに項1で定義される環E-1及び環E-7から選択され、
ここで、
R¹⁴^bは、C₁~C₃-アルキル、C₁~C₃-ハロアルキル及びシクロプロピルから選択され、
環E-1及び環E-7において、

kは、0、1又は2であり、

各R¹⁶は、独立して、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁~C₂-アルキル、C₁~C₂-ハロアル

キル、C₁~C₂-アルコキシ、C₁~C₂-ハロアルコキシ、C₁~C₂-アルキルチオ、C₁~C₂-ハ

ロアルキルチオ、C₁~C₂-アルキルスルフィニル、C₁~C₂-ハロアルキルスルフィニル、C₁

~C₂-アルキルスルホニル、C₁~C₂-ハロアルキルスルホニル、C₃~C₄-シクロアルキル、C

10

20

30

40

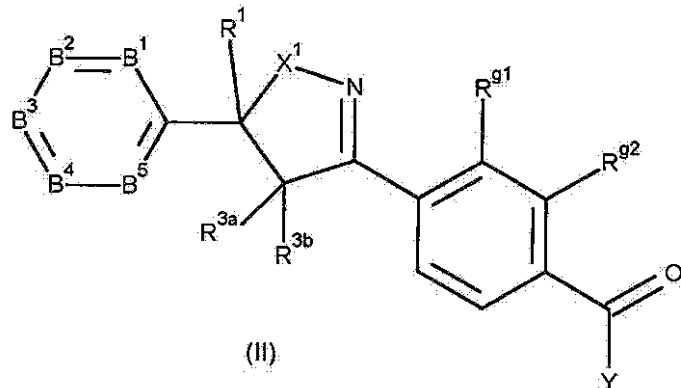
50

$C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_3$ -アルケニル、 $C_2 \sim C_3$ -アルキニルから選択される】
 である、項17で定義される式IAの化合物、並びにそのN-オキシド、立体異性体及び農業的若しくは獣医学的に許容される塩。

項22

式IIの化合物

【化41】



10

[式中、

 B^1 、 B^2 、 B^3 、 B^4 、 B^5 、 X^1 、 R^1 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{g1} 及び R^{g2} は、項1～3及び10～21のいずれか1項で定義される通りであり、

20

Yは、水素及びOR¹⁷

(式中、

 R^{17} は、水素、 $C_1 \sim C_4$ -アルキル及び $C_1 \sim C_4$ -ハロアルキルから選択される)から選択される]。

項23

項1～22のいずれか1項で定義される、少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的若しくは獣医学的に許容される塩と、少なくとも1種の不活性な液体及び/又は固体の農業的又は獣医学的に許容される担体とを含む農業用又は獣医用組成物。

項24

30

無脊椎有害生物を駆除するための、項1～22のいずれか1項で定義される化合物、その立体異性体及び/又は農業的若しくは獣医学的に許容される塩の使用。

項25

無脊椎有害生物による寄生又は感染から動物を治療又は保護するための、項1～22のいずれか1項で定義される化合物、その立体異性体及び/又は獣医学的に許容される塩の使用。

項26

植物繁殖材料及び/又はそれから生育する植物を無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から保護する方法であって、植物繁殖材料を、殺有害生物有効量の、項1～22のいずれか1項で定義される、少なくとも1種の式Iの化合物、その立体異性体及び/又は少なくとも1種のその農業的に許容される塩で処理することを含む、方法。

40

フロントページの続き

(51)Int.Cl.		F I		
A 6 1 K	31/4439	(2006.01)	A 6 1 K	31/4439
A 6 1 P	31/00	(2006.01)	A 6 1 P	31/00 1 7 1
A 6 1 P	33/00	(2006.01)	A 6 1 P	33/00 1 7 1
A 0 1 P	5/00	(2006.01)	A 0 1 P	5/00
A 0 1 P	7/00	(2006.01)	A 0 1 P	7/00
A 0 1 N	43/80	(2006.01)	A 0 1 N	43/80 1 0 1

(72)発明者 ピントシェドラー, パスカル

ドイツ連邦共和国 6 7 3 5 4 レーマーベルク, ガルテンシュトラーセ 3 4 アー

(72)発明者 ダッタ, ゴパル クリシナ

ドイツ連邦共和国 3 7 0 7 9 ゲッティンゲン, イム ケルブヒエン 3 3

(72)発明者 フォン ダイン, ヴォルフガング

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット, アン デア ブライヒェ 2 4

(72)発明者 ポールマン, マティアス

アメリカ合衆国 2 7 7 0 9 ノースカロライナ州, リサーチ トライアングル パーク, デイヴィス ドライヴ 2 6

(72)発明者 ブラウン, フランツ - ヨセフ

アメリカ合衆国 2 7 7 1 2 ノースカロライナ州, ダラム, ワイルド ハーベスト コート 3 5 0 2

審査官 水島 英一郎

(56)参考文献 國際公開第2 0 1 2 / 0 0 7 4 2 6 (WO, A 1)

(58)調査した分野(Int.Cl., DB名)

C 0 7 D

C A p l u s (S T N)

R E G I S T R Y (S T N)