

(19)日本国特許庁(JP)

(12)公表特許公報(A)

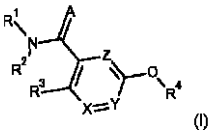
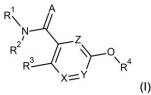
(11)公表番号
特表2025-516598
(P2025-516598A)

(43)公表日 令和7年5月30日(2025.5.30)

(51)国際特許分類		F I		テーマコード (参考)	
C 0 7 D 213/82 (2006.01)		C 0 7 D 213/82		C S P 4 H 0 1 1	
C 0 7 D 403/12 (2006.01)		C 0 7 D 403/12			
C 0 7 D 213/81 (2006.01)		C 0 7 D 213/81			
C 0 7 D 413/12 (2006.01)		C 0 7 D 413/12			
C 0 7 D 237/24 (2006.01)		C 0 7 D 237/24			
		審査請求	未請求	予備審査請求	未請求 (全265頁) 最終頁に続く
(21)出願番号	特願2024-566362(P2024-566362)	(71)出願人	520222106		
(86)(22)出願日	令和5年5月11日(2023.5.11)		シンジェンタ クロップ プロテクション		
(85)翻訳文提出日	令和6年11月8日(2024.11.8)		アクチェンゲゼルシャフト		
(86)国際出願番号	PCT/EP2023/062656		スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ		
(87)国際公開番号	WO2023/217989		ールシュトラッセ 6 7		
(87)国際公開日	令和5年11月16日(2023.11.16)	(74)代理人	100103610		
(31)優先権主張番号	22172906.4		弁理士 ▲吉▼田 和彦		
(32)優先日	令和4年5月12日(2022.5.12)	(74)代理人	100109070		
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)		弁理士 須田 洋之		
(81)指定国・地域	AP(BW,CV,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV	(74)代理人	100119013		
	最終頁に続く		弁理士 山崎 一夫		
		(74)代理人	100111796		
			弁理士 服部 博信		
		(74)代理人	100123766		
			弁理士 松田 七重		
			最終頁に続く		

(54)【発明の名称】 アルコキシヘテロアリール - カルボキサミド又はチオアミド化合物

(57)【要約】
式 (I)
【化 1】



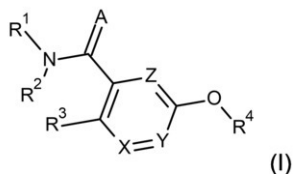
(式中、置換基は、請求項1で定義されているとおりである)
の化合物並びにこれらの化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN - オキシドは、殺虫剤として使用され得る。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、

A は、O 又は S であり；

X は、N 又は C R⁸ であり；Y は、N 又は C R⁸ であり；Z は、N 又は C R⁸ であり；

ただし、X、Y、Z の少なくとも 1 つは、N であり；

R¹ は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、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、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルコキシ-C₁～C₆-アルキル、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、シアノ-C₁～C₆-アルキル、シアノ-C₃～C₆-シクロアルキル、シアノ-C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、シアノ-ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルスルホニルオキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルコキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルチオ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルキルチオ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルスルフィニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルスルホニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₂～C₆-アルキニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシカルボニル-C₃～C₆-シクロアルキル、カルボキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、カルバモイル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルアミノカルボニル-C₃～C₆-シクロアルキル（これは、R⁸によって単置換又は多置換され得る）、C₄～C₈-ビスシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシイミノ、フェニル（これは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、フェニル-C₁～C₆-アルキル（前記フェニルは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール（前記ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール-C₁～C₃-アルキル（前記ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール-C₃～C₆-シクロアルキル（前記ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロシクロアルキル（これは、R⁸によって置換され得る）、ヘテロシクロアルキル-C₁～C₆-アルキル（これは、R⁸によって置換され得る）又はヘテロシクロアルキル-C₃～C₆-シクロアルキル（前記ヘテロシクロアルキルは、R⁸によって置換され得る）であり；

20

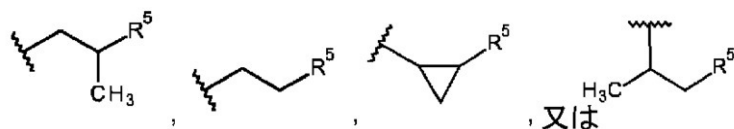
30

40

50

R² は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、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、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-アルコキシ-C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、フェニル（これは、R¹⁰によって単置換又は多置換され

得る)、フェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (前記フェニルは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る)、ヘテロアリール (前記ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る)、ヘテロアリール - $C_1 \sim C_3$ - アルキル (前記ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る)、シアノ、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルカルボニル、 R^{10} によって単置換又は多置換されているベンゾイル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシカルボニル、カルバモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、($C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ)カルボニル、($C_1 \sim C_6$ - アルキル)チオカルボニル、($C_1 \sim C_6$ - アルコキシ)チオカルボニル、チオカルバモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ - チオカルボニル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - 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、スルファモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノスルホニル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、アミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (前記アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシアミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシイミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；
 R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシであり；
 R^4 は、
【化 2】



であるか；又は

R^5 は、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ又は $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノであり、前記アミノ基のいずれかは、無置換であるか又は R^6 によって置換されており；前記シクロアルキル基のいずれかは、 R^9 によって単置換又は多置換され得；
 R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルであり；
 R^8 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノであり；
 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノであり；及び

R^{10} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -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、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -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、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルオキシ、フェニル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルから独立して選択されて単置換又は多置換され得る）、フェニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、シアノ及びニトロである）

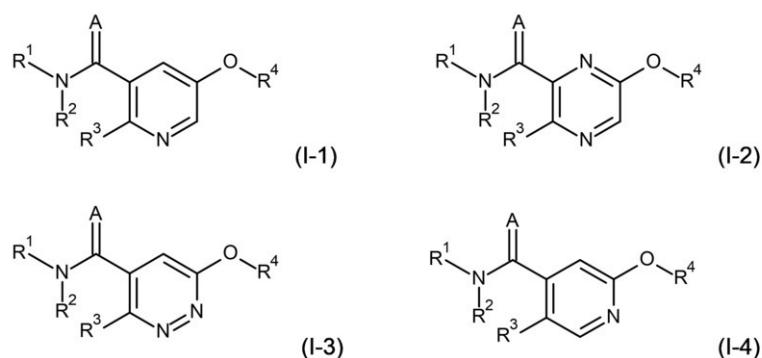
10

の化合物又は前記式（I）の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシド。

【請求項2】

式（I-1）、（I-2）、（I-3）又は（I-4）

【化3】



20

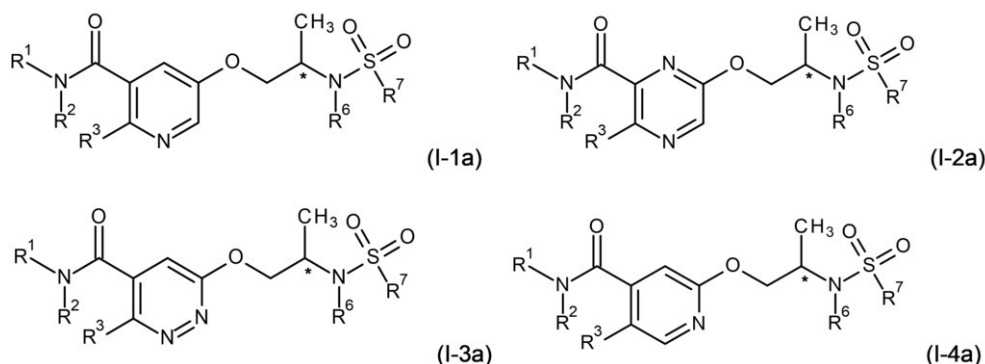
（式中、A、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、請求項1で定義されているとおりである）
によって表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

30

式（I-1a）、（I-2a）、（I-3a）又は（I-4a）

【化4】



40

（式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^6 は、請求項1で定義されているとおりであり； R^7 は、（I-1a）、（I-2a）、（I-3a）及び（I-4a）について独立して、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルから選択され、前記シクロアルキル基は、 R^9 によって単置換又は多置換され得、 R^9 は、請求項1で定義されているとおりである）

によって表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

50

前記式 (I - 1 a)、(I - 2 a)、(I - 3 a) 又は (I - 4 a) によって表される前記式 (I) の化合物は、(S) 鏡像異性体である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R¹は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₂～C₆-アルキニル、C₃～C₆-シクロアルキル、シアノ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、ヘテロシクリル又はC₁～C₆-アルコキシ-C₃～C₆-シクロアルキルであり；及びR²は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-アルコキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ-C₁～C₆-アルキル又はC₁～C₆-アルキルカルボニルである、請求項 1～4 のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項 6】

R¹は、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-ハロアルキル、C₂～C₄-アルキニル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₃-アルキル、SO₂を有する 4 員ヘテロシクリル又はシアノ-C₃～C₄-シクロアルキルであり；及びR²は、水素、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルキルカルボニル又はC₁～C₃-アルコキシカルボニルである、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R³は、ハロゲン、C₁～C₆-アルキル又はシアノである、請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項 8】

R³は、塩素、臭素又はメチルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R⁵は、イソプロピルスルホニルアミノ、ジフルオロメチルスルホニルアミノ、トリフルオロメチルスルホニルアミノ、ジフルオロメチルスルホニルアミノ又はシクロプロピルスルホニルアミノである、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R⁶は、水素、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルコキシ-C₁～C₃-アルキル、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₃-アルキル又はC₁～C₃-アルキルカルボニルである、請求項 1～8 のいずれか一項に記載の化合物。

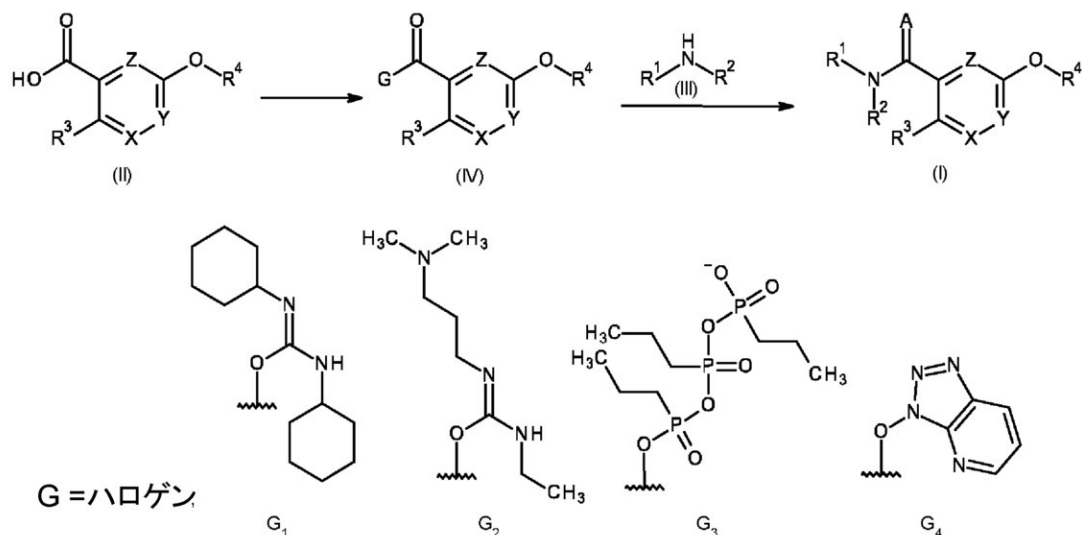
30

【請求項 11】

式 (I) の化合物 (式中、A は、O である) を調製するプロセスであって、式 (I V) の中間体酸塩化物又は活性化アシル化剤を介して、式 (I I I) の化合物 (式中、R¹及びR²は、請求項 1、5 又は 6 のいずれか一項で定義されているとおりである) を用いて式 (I I) の化合物 (式中、R³、R⁴、X、Y、Z は、請求項 1～10 のいずれか一項で定義されているとおりである) を変換することを含むプロセス。

40

【化 5】



10

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物、1 種以上の助剤及び希釈剤並びに任意に 1 種以上の他の有効成分を含む組成物。

20

【請求項 1 3】

昆虫、ダニ類又は軟体動物を駆除及び防除する方法であって、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の式 I の化合物又は請求項 1 2 に記載の組成物を適用することを含む方法。

【請求項 1 4】

昆虫、ダニ類又は軟体動物による攻撃から植物繁殖材料を保護する方法であって、前記繁殖材料又は前記繁殖材料が植えられている場所を、有効量の、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の式 I の化合物又は請求項 1 2 に記載の組成物で処理することを含む方法。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の式 I の化合物を含むか、又はそれで処理されているか若しくはそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料。

30

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0 0 0 1】

本発明は、殺有害生物的に有効である、特に殺虫的に有効であるアルコキシヘテロアリール - カルボキサミド又はチオアミド化合物、好ましくはその置換ピリジニル、ピラジニル又はピリダジニル化合物、その調製プロセス、これらの化合物を含む組成物及び節足動物、特に昆虫を含む動物有害生物を防除するためのそれらの使用に関する。

【背景技術】

40

【0 0 0 2】

国際公開第 2 0 2 1 1 5 3 7 2 0 号は、特定のアルコキシ安息香酸アミド誘導体を記載している。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

【0 0 0 3】

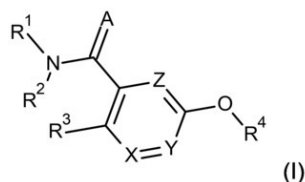
ここで、殺有害生物的に有効な特定の新規なアルコキシ及びシクロアルコキシヘテロアリール - カルボキサミド又はチオアミド化合物が見出された。

【0 0 0 4】

本発明は、従って、第 1 の態様では、式 (I)

50

【化 1】



(式中、

A は、O 又は S であり；

X は、N 又は C R⁸ であり；

Y は、N 又は C R⁸ であり；

Z は、N 又は C R⁸ であり；

ただし、X、Y、Z の少なくとも 1 つは、N であり；

R¹ は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、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、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₁～C₆-アルコキシ-C₁～C₆-アルキル、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、シアノ-C₁～C₆-アルキル、シアノ-C₃～C₆-シクロアルキル、シアノ-C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、シアノ-ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキル-カルボニルオキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルスルホニルオキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルコキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルチオ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルキルチオ-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルスルフィニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルキルスルフィニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルスルホニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-ハロアルキルスルホニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₂～C₆-アルキニル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシカルボニル-C₃～C₆-シクロアルキル、カルボキシ-C₃～C₆-シクロアルキル、カルバモイル-C₃～C₆-シクロアルキル、C₁～C₆-アルキルアミノカルボニル-C₃～C₆-シクロアルキル（これは、R⁸によって単置換又は多置換され得る）、C₄～C₈-ビスシクロアルキル、C₁～C₆-アルコキシイミノ、フェニル（これは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、フェニル-C₁～C₆-アルキル（フェニルは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール（ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール-C₁～C₃-アルキル（ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール-C₃～C₆-シクロアルキル（ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロシクロアルキル（これは、R⁸によって置換され得る）、ヘテロシクロアルキル-C₁～C₆-アルキル（これは、R⁸によって置換され得る）又はヘテロシクロアルキル-C₃～C₆-シクロアルキル（ヘテロシクロアルキルは、R⁸によって置換され得る）であり；

R² は、水素、C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルキル、C₃～C₆-シクロアルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル、C₂～C₆-アルケニル、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、C₁～C₆-アルコキシ、C₁～C₆-アルコキシ-C₁～C₆-アルキル、C₁～C₆-ハロアルコキシ、C₃～C₆-シクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、C₃～C₆-ハロシクロアルキル-C₁～C₆-アルキル、フェニル（これは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、フェニル-C₁～C₆-アルキル（フェニルは、R¹⁰によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール（ヘテロアリールは、R¹⁰によって単置換又は多置換され

10

20

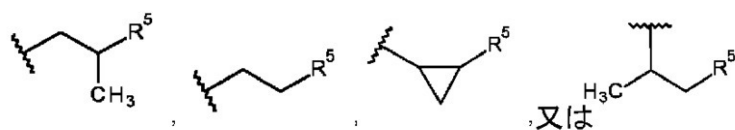
30

40

50

得る)、ヘテロアリール - $C_1 \sim C_3$ - アルキル (ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る)、シアノ、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルカルボニル、 R^{10} によって単置換又は多置換されているベンゾイル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシカルボニル、カルバモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、($C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ)カルボニル、($C_1 \sim C_6$ - アルキル)チオカルボニル、($C_1 \sim C_6$ - アルコキシ)チオカルボニル、チオカルバモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ - チオカルボニル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - 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、スルファモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノスルホニル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、アミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル (アミノ基は、 R^8 によって置換され得る)、ヒドロキシイミノ、ヒドロシミアミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシイミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；
 R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシであり；
 R^4 は、

【化2】



であり；

R^5 は、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ又は $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノであり、前記アミノ基のいずれかは、無置換であるか又は R^6 によって置換されており；前記シクロアルキル基のいずれかは、 R^9 によって単置換又は多置換され得；

R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルであり；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノであり；

R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノであり；及び

R^{10} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - 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、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - 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、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルチオ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルチオ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルオキシ、フェニル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルから独立して選択されて単置換又は多置換され得る）、フェニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、シアノ又はニトロである）

の化合物又は式（I）の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN-オキシドに関する。

10

【発明を実施するための形態】

【0005】

少なくとも1つの塩基性中心（basic centre）を有する式（I）の化合物は、例えば、酸付加塩、例えば無機強酸、例えば鉱酸、例えば過塩素酸、硫酸、硝酸、亜硝酸、リン酸又はハロゲン化水素酸との酸付加塩、強有機カルボン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカンカルボン酸、例えば酢酸、例えば飽和又は不飽和ジカルボン酸、例えばシュウ酸、マロン酸、コハク酸、マレイン酸、フマル酸又はフタル酸、例えばヒドロキシカルボン酸、例えばアスコルビン酸、乳酸、リンゴ酸、酒石酸又はクエン酸、又は例えば安息香酸との酸付加塩、又は有機スルホン酸、例えば非置換であるか又は例えばハロゲンで置換される $C_1 \sim C_4$ アルカン-又はアリールスルホン酸、例えばメタン-又はp-トルエンスルホン酸との酸付加塩を形成することができる。少なくとも1つの酸性基を有する式（I）の化合物は、例えば、塩基との塩、例えば無機塩、例えばアルカリ金属塩又はアルカリ土類金属塩、例えばナトリウム塩、カリウム塩若しくはマグネシウム塩又はアンモニア若しくは有機アミンとの塩、例えばモルホリン、ピペリジン、ピロリジン、モノ-、ジ-又はトリ-低級アルキルアミン、例えばエチル-、ジエチル-、トリエチル-若しくはジメチルプロピルアミン又はモノ-、ジ-若しくはトリヒドロキシ-低級アルキルアミン、例えばモノ-、ジ-又はトリエタノールアミンを形成することができる。

20

【0006】

各事例において、本発明に係る式（I）の化合物は、遊離形態、N-オキシドとして酸化型又は塩形態であり、例えば農学的に使用可能な塩形態である。

30

【0007】

N-オキシドは、第三級アミンの酸化型又は窒素含有芳香族複素環式化合物の酸化型である。これらは、例えば、書籍“Heterocyclic N-oxides”，A. Albini and S. Pietra, CRC Press, Boca Raton 1991に記載されている。

【0008】

本発明に係る式（I）の化合物は、塩形成中に形成され得る水和物も含む。

【0009】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1～n個の炭素原子を有する飽和直鎖又は分岐炭化水素ラジカルを指し、例えばラジカルであるメチル、エチル、n-プロピル、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、n-ヘキシル、n-ペンチル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、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-メチルプロピルのいずれか

40

50

1つである。

【0010】

本明細書で用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ -アルケニル」という用語は、2～n個の炭素原子及び1つ又は2つの二重結合を有する直鎖又は分岐アルケニル鎖部分を指し、例えばエテニル、プロブ-1-エニル、ブタ-2-エニルである。

【0011】

本明細書で用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ -アルキニル」という用語は、2～n個の炭素原子及び1つの三重結合を有する直鎖又は分岐アルキニル鎖部分を指し、例えばエチニル、プロブ-2-イニル、ブタ-3-イニルである。

【0012】

本明細書で用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルなどの3～n員シクロアルキル基を指す。

10

【0013】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合する1～n個の炭素原子(上記のとおり)を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基を指し、すなわち例えばメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、1-メチルエトキシ、n-ブトキシ、1-メチルプロポキシ、2-メチルプロポキシ及び1,1-ジメチルエトキシといったいずれか1つの基を指す。本明細書で用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ -アルケニルオキシ」という用語は、酸素原子を介して結合する1～n個の炭素原子(上記のとおり)を有する直鎖又は分岐アルケニル鎖を指す。

20

【0014】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ基で置換されたアルキル基(上記のとおり)を指す。例は、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシメチル及びプロポキシメチルである。

【0015】

本明細書で用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、 $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル基で置換されたアルキル基(上記のとおり)を指す。例は、シクロプロピルメチル、シクロプロピルエチルである。同様に、「 $C_3 \sim C_n$ -ハロシクロアルキル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、シクロアルキル基で置換されたアルキル基を指し、ここで、シクロアルキル基は、1つ以上の同じ又は異なるハロゲン原子で置換されている。例は、3,3-ジフルオロブチルメチル及び1-クロロシクロプロピルメチルである。

30

【0016】

本明細書で用いられる場合、「ヘテロシクロアルキル」又は「ヘテロシクリル」という用語は、窒素、酸素、硫黄、 $S=O$ 及び SO_2 から独立して選択される1、2又は3つのヘテロ原子/基を含む安定な3-、4-、5-又は6員非芳香族単環式環基を指す。ヘテロシクリル基は、炭素原子又はヘテロ原子を介して分子の残部に結合し得る。ヘテロシクリルの例としては、これらに限定されないが、エポキシド、アジリジニル、ピロリニル、ピロリジル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペリジル、ピペラジニル、テトラヒドロピラニル、ジオキソラニル、モルホリニル、オキサジナニル、オキセタニル、1,1-ジオキソチエタン-3-イル又は δ -ラクタミルが挙げられる。ヘテロシクロアルキル基は、ヘテロ原子及び/又は炭素原子において置換され得る。「シアノヘテロシクロアルキル」という用語は、ヘテロシクロアルキル基における炭素原子がシアノ基で置換されていることを示す。

40

【0017】

本明細書で用いられる場合、「ヘテロシクロアルキル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、ヘテロシクロアルキル基で置換されたシクロアルキル基(上記のとおり)を指す。ヘテロシクロアルキル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル基は、ヘテロシクロアルキル基及び/又はシクロアルキル基において置換され得る。例は、1-(テトラヒドロ-3

50

- フラニル)シクロプロピル、1 - (テトラヒドロ - 2 - フラニル)シクロプロピル、1 - (テトラヒドロ - 3 - チエニル)シクロプロピル、1 - (3 - ピロリジニル)シクロプロピル、1 - (テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 4 - イル)シクロプロピル、1 - (テトラヒドロ - 3 - フラニル)シクロブタニル、1 - 及び (テトラヒドロ - 3 - フラニル)シクロペンタニルである。

【0018】

本明細書で用いられる場合、「ヘテロシクロアルキル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、ヘテロシクロアルキル基で置換されたアルキル基(上記のとおり)を指す。ヘテロシクロアルキル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル基は、ヘテロシクロアルキル基及び/又はアルキル基において置換され得る。例は、(テトラヒドロフラン - 3 - イル)メタニル(又は(テトラヒドロフラン - 3 - イル)メチル)、1, 3 - ジオキソラン - 2 - メタニル(又は1, 3 - ジオキソラン - 2 - メチル)、2 - ピロリジンメタニル(又は2 - ピロリジンメチル)及び α - メチル - 2 - ピロリジンメタニル(又は α - メチル - 2 - ピロリジンメチル)である。

10

【0019】

本明細書で用いられる場合、「シアノ - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、1 ~ n 個の炭素原子(上記のとおり)を有する $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指し、ここで、基における水素原子の1つがシアノ基で置換されており、例えばシアノ - メチル、2 - シアノ - エチル、2 - シアノ - プロピル、3 - シアノ - プロピル、1 - (シアノ - メチル) - 2 - エチル、1 - (メチル) - 2 - シアノ - エチル、4 - シアノブチル等である。同様に、「シアノ - $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル」という用語は、水素原子の1つがシアノ基で置換された $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル基を指し、及び「シアノ - $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、シアノ - $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル基を有する $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。

20

【0020】

ハロゲンは、一般に、フッ素、塩素、臭素又はヨウ素である。これは、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルキニル、ハロアルコキシ及びハロシクロアルキルなど、他の意味と組み合わせられたハロゲンにも同様に適用される。

【0021】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキル」という用語は、炭素原子のいずれかを介して結合している、1 ~ n 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキルラジカルを指し(上記のとおり)、ここで、これらのラジカル中の水素原子のいくつか又はすべては、フッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素によって置換され得、すなわち例えばクロロメチル、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、2 - フルオロエチル、2 - クロロエチル、2 - プロモエチル、2 - ヨードエチル、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、ペンタフルオロエチル、2 - フルオロプロピル、3 - フルオロプロピル、2, 2 - ジフルオロプロピル、2, 3 - ジフルオロプロピル、2 - クロロプロピル、3 - クロロプロピル、2, 3 - ジクロロプロピル、2 - プロモプロピル、3 - プロモプロピル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、3, 3, 3 - トリクロロプロピル、2, 2, 3, 3, 3 - ペンタフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1 - (フルオロメチル) - 2 - フルオロエチル、1 - (クロロメチル) - 2 - クロロエチル、1 - (プロモメチル) - 2 - プロモエチル、4 - フルオロブチル、4 - クロロブチル、4 - プロモブチル又はノナフルオロブチルのいずれか1つである。「 $C_1 \sim C_2$ フルオロアルキル」という用語は、1、2、3、4又は5つのフッ素原子を有する $C_1 \sim C_2$ アルキルラジカルを指し、例えばジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、1, 1, 2, 2 - テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルのいずれか1

30

40

50

つであろう。同様に、本明細書で用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ -ハロアルケニル」又は「 $C_2 \sim C_n$ -ハロアルキニル」という用語は、それぞれ同じであるか又は異なり得る1つ以上のハロ原子で置換された $C_2 \sim C_n$ -アルケニル又は $C_2 \sim C_n$ -アルキニル基を指す。同様に、本明細書で用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ -ハロシクロアルキル」又は「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルコキシ」という用語は、それぞれ同じであるか又は異なり得る1つ以上のハロ原子で置換された $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル基又は $C_1 \sim C_n$ -アルコキシル基を指す。

【0022】

本明細書で用いられる場合、「ヒドロキシ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」又は「カルバモイル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、ヒドロキシ(OH)基又はカルバモイル(NHC(=O))基で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

10

【0023】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキル-カルボニルオキシ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、 $R_aC(=O)O$ -部分(式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ -アルキル基である)で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

【0024】

本明細書で用いられる場合、「カルボキシ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、 $C(=O)(O)$ -部分で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

【0025】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシカルボニル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、 $R_cC(=O)$ -部分(式中、 R_c は、上記で定義されている $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ基である)で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルホニルオキシ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、 $R_aS(O)_2O$ -部分(式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ -アルキル基である)で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

20

【0026】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、上記で定義されている $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ基で置換された3～n員シクロアルキル基を指し、同様に、本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルコキシ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」又は「 $C_2 \sim C_n$ -アルキニル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、それぞれ上記で定義されている $C_1 \sim C_n$ -ハロアルコキシ基又は $C_2 \sim C_n$ -アルキニル基で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

30

【0027】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルチオ」又は「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルファニル」という用語は、硫黄原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【0028】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルチオ」又は「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルファニル」という用語は、硫黄原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキル基を指す。

40

【0029】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルフィニル」という用語は、スルフィニル(又は $S(=O)-$)基の硫黄原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【0030】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルホニル」という用語は、スルホニル(又は $S(=O)_2-$)基の硫黄原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【0031】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルホニル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル

50

」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ アルキルスルホニル基で置換された $C_1 \sim C_n$ アルキル基を指す。

【0032】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルチオ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ -アルキルチオ（又は R_aS -）部分（式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ -アルキル基である）で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。同様に、本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルフィニル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」又は「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルホニル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、それぞれ $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルフィニル（又は $R_aS(O)$ -）又は $C_1 \sim C_n$ -アルキルスルホニル（又は $R_aS(O)_2$ -）部分（式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ -アルキル基である）で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

10

【0033】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルチオ- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルチオ（又は R_bS -）部分（式中、 R_b は、 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキル基である）で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。同様に、本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルフィニル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」又は「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルホニル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、それぞれ $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルフィニル（若しくは $R_bS(O)$ -）又は $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルホニル（若しくは $R_bS(O)_2$ -）部分（式中、 R_b は、 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキル基である）で置換された3～n員シクロアルキル基を指す。

20

【0034】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルホニルアミノ」という用語は、アミノ（又は $N-H$ ）基の窒素原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキルスルホニル（又は $R_bS(O)_2$ -）基（式中、 R_b は、上記で定義されている $C_1 \sim C_n$ -ハロアルキル基である）を指す。

【0035】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルカルボニル」という用語は、カルボニル（ $C=O$ ）基の炭素原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【0036】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル（又は $C=O$ ）基の炭素原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ部分を指す。

30

【0037】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシカルボニル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル」という用語は、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシカルボニル基」で置換された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【0038】

本明細書で用いられる場合、「ベンゾイル」という用語は、カルボニル（ $C=O$ ）基の炭素原子を介して結合されたフェニル基を指す。

40

【0039】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルコキシカルボニル」という用語は、カルボニル（ $C=O$ ）基の炭素原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -ハロアルコキシ基を指す。

【0040】

本明細書で用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ -アルケニルオキシカルボニル」という用語は、カルボニル（ $C=O$ ）基の炭素原子を介して結合された $C_2 \sim C_n$ -アルケニルオキシカルボニル基を指す。

【0041】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルアミノカルボニル」という用語は

50

、カルボニル ($C=O$) 基の炭素原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ - アルキルアミノ基 (又は $R_aNH C(=O) -$ (式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ - アルキル基である)) を指す。

【 0 0 4 2 】

本明細書で用いられる場合、「アミノカルボニル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、アミノカルボニル (又は $NH_2 C(=O) -$) 基で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。

【 0 0 4 3 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - アルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ - アルキルアミノカルボニル (又は $R_aNH C(=O) -$) 基 (式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ - アルキル基である) で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。窒素に結合した $C_1 \sim C_n$ - アルキル基は、置換され得る。

10

【 0 0 4 4 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、 $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキルアミノカルボニル (又は $R_dNH C(=O) -$) 基 (式中、 R_d は、 $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル基である) で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。窒素に結合した $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル基は、置換され得る。

【 0 0 4 5 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキルアミノカルボニル (又は $R_bNH C(=O) -$) 基 (式中、 R_b は、 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキル基である) で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。窒素に結合した $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキル基は、置換され得る。

20

【 0 0 4 6 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキルカルボニル - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキルカルボニル (又は $R_b C(=O) -$) 基 (式中、 R_b は、 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキル基である) で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。

【 0 0 4 7 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - アルキルカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ - アルキルカルボニルオキシ (又は $R_a C(=O) O -$) 基 (式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ - ハロアルキル基である) で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。

30

【 0 0 4 8 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - アルコキシカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_n$ - アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ - アルコキシカルボニルオキシ (又は $R_c C(=O) O -$) 基 (式中、 R_c は、 $C_1 \sim C_n$ - アルコキシ基である) で置換された $C_1 \sim C_n$ - アルキル基を指す。窒素に結合した $C_1 \sim C_n$ - アルコキシ基は、置換され得る。

【 0 0 4 9 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ - アルキルアミノカルボニル - $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ - アルキルアミノカルボニル (又は $R_aNH C(=O) -$) 基 (式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ - アルキル基である) で置換された $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル基を指す。 $C_1 \sim C_n$ - アルキルアミノカルボニル - $C_3 \sim C_n$ - シクロアルキル基は、アルキル基及び / 又はシクロアルキル基において置換され得る。

40

【 0 0 5 0 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_4 \sim C_n$ - ビシクロアルキル」という用語は、縮合された 2 つの環 (すなわち 2 つの炭素原子を共有) を含むと共に、炭素原子及び水素原子のみからなる環化非芳香族二環系を指す。例は、ビシクロ [3 . 1 . 0] ヘキサン - 6 - イル、ビシクロ [4 . 1 . 0] ヘプタン - 7 - イル、ビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタン - 6 - イル、ビシクロ [3 . 2 . 0] ヘプタン - 3 - イル、オクタヒドロ - 2 - ペンタレニル、オクタヒドロ - 1 - ペンタレニルである。

50

【 0 0 5 1 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシミノ」という用語は、イミノ ($N =$) 部分の窒素原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ基を指す。

【 0 0 5 2 】

本明細書で用いられる場合、「ヒドロキシイミノ」という用語は、イミノ ($N =$) 部分の窒素原子を介して結合されたヒドロキシ基を指す。

【 0 0 5 3 】

本明細書で用いられる場合、「ヒドロキシアミノ- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、ヒドロキシアミノ (又は $(OH)NH-$) 部分で置換された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

10

【 0 0 5 4 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシイミノ- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシイミノ部分で置換された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【 0 0 5 5 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -ハロアルコキシイミノ- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシイミノ部分 (式中、 $C_1 \sim C_n$ -アルコキシ基は、1つ以上の同じ又は異なるハロゲン原子で置換されている) で置換された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。

【 0 0 5 6 】

「フェニル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」という用語は、フェニル環で置換された $C_1 \sim C_n$ -アルキル基を指す。例としては、ベンジルが挙げられる。フェニル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル基は、アルキル基及び/又はフェニル基において置換され得る。

20

【 0 0 5 7 】

「ヘテロアリアル」という用語は、N、O及びSから独立して選択される1、2、3又は4つのヘテロ原子を含む5員又は6員芳香族単環式環基を指す。ヘテロアリアル例としては、これらに限定されないが、フラニル、ピロリル、チエニル、ピラゾリル、イミダゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、ピラジニル、ピリダジニル、ピリミジル又はピリジルが挙げられる。「ヘテロアリアル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル」又は「ヘテロアリアル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル」という用語は、それぞれヘテロアリアル基で置換された $C_1 \sim C_n$ -アルキル又は $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル基を指す。ヘテロアリアル- $C_1 \sim C_n$ -アルキル又はヘテロアリアル- $C_3 \sim C_n$ -シクロアルキル基は、ヘテロアリアル、アルキル及び/又はシクロアルキル基において適切に置換され得る。

30

【 0 0 5 8 】

本明細書で用いられる場合、「スルファモイル」という用語は、スルホニル (SO_2) 部分の硫黄原子を介して結合されたアミノ (NH_2) 部分を指す。

【 0 0 5 9 】

本明細書で用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ -アルキルアミノスルホニル」という用語は、スルホニル (SO_2) 部分の硫黄原子を介して結合された $C_1 \sim C_n$ -アルキルアミノ (又は $R_aNHC(=O)-$) 部分 (式中、 R_a は、 $C_1 \sim C_n$ -アルキル基である) を指す。

40

【 0 0 6 0 】

本明細書で用いられる場合、「置換され得る」という用語は、置換基は、1つ以上の同一の又は異なる置換基であり、例えば1、2又は3つの R^x 置換基を有しても又は有しなくてもよいことを意味する。例えば、1、2又は3つのハロゲンで置換された $C_1 \sim C_6$ アルキルは、特に限定されないが、 $-CH_2Cl$ 、 $-CHCl_2$ 、 $-CCl_3$ 、 $-CH_2F$ 、 $-CHF_2$ 、 $-CF_3$ 、 $-CH_2CF_3$ 又は $-CF_2CH_3$ 基をみ得る。他の例として、1、2又は3つのハロゲンで置換された $C_1 \sim C_6$ アルコキシは、特に限定されないが、 CH_2ClO- 、 $CHCl_2O-$ 、 CCl_3O- 、 CH_2FO- 、 CHF_2O- 、 CF_3O- 、

50

$\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ - 又は $\text{CH}_3\text{CF}_2\text{O}$ - 基を含み得る。「置換され得る」という用語は、用語「無置換又は置換」と同義に使用可能である。

【0061】

本明細書で用いられる場合、「防除する」という用語は、植物又は植物由来産物に対する被害が低減するように有害生物の数を低減させ、有害生物を駆除し、且つ/又はさらなる有害生物による被害を予防することを指す。

【0062】

本明細書で用いられる場合、「有害生物」という用語は、農業、園芸、林業、植物由来産物（果実、穀粒及びひき材など）の保管で見られる昆虫及び軟体動物；並びに人工構造物の被害に関連する有害生物を指す。有害生物という用語は、有害生物のライフサイクルにおけるすべてのステージを包含する。

10

【0063】

本明細書で用いられる場合、「有効量」という用語は、単一回又は複数回の適用で所望の効果がもたらされる化合物又はその塩の量を指す。

【0064】

本明細書で用いられる場合、「室温」、又は「RT」、又は「rt」という用語は、約 $15 \sim 35$ の温度を指す。例えば、rt は、約 $20 \sim 30$ の温度を指し得、rt は、約 25 の温度を指し得る。

【0065】

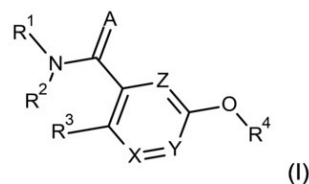
有効量は、公知の技術の使用により及び類似する状況下で得られる結果を観察することにより、当業者によって容易に判定される。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、適用される植物の種類又は植物に由来する産物の種類；防除される有害生物及びそのライフサイクル；適用される特定の化合物；適用の種類；並びに他の関連する状況を含む多数の要因が考慮される。

20

【0066】

本発明の一実施形態では、式 (I)

【化3】



30

(式中、

A は、O 又は S であり；

X は、N 又は CR^8 であり；

Y は、N 又は CR^8 であり；

Z は、N 又は CR^8 であり；

ただし、X、Y、Z の少なくとも 1 つは、N であり；

40

R^1 は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - ハロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - ハロシクロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ - アルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ - ハロアルケニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ - アルキニル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ - ハロアルキニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - ハロアルコキシ、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルコキシ - $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル - $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - ハロシクロアルキル - $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル、シアノ - $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル、シアノ - $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル、シアノ - $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル - $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル、シアノ - ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシ - $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキル - カルボニルオキシ - $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルキルスルホニルオキシ - $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - アルコキシ - $\text{C}_3 \sim \text{C}_6$ - シクロアルキル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ - ハロアルコキシ - C

50

$C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルフィニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルスルフィニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルスルホニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、カルボキシ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、カルバモイル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル（これは、 R^8 によって単置換又は多置換され得る）、 $C_4 \sim C_8$ - ビシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ、フェニル（これは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、フェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（フェニルは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール（ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール - $C_1 \sim C_3$ - アルキル（ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル（ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロシクロアルキル（これは、 R^8 によって置換され得る）、ヘテロシクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（これは、 R^8 によって置換され得る）又はヘテロシクロアルキル - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル（ヘテロシクロアルキルは、 R^8 によって置換され得る）であり；

R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - 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、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニル、 $C_2 \sim C_6$ - 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、 $C_2 \sim C_6$ - ハロアルキニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、フェニル（これは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、フェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（フェニルは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール（ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、ヘテロアリール - $C_1 \sim C_3$ - アルキル（ヘテロアリールは、 R^{10} によって単置換又は多置換され得る）、シアノ、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、ヒドロキシ、ホルミル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルカルボニル、 R^{10} によって単置換又は多置換されているベンゾイル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシカルボニル、 $C_2 \sim C_6$ - アルケニルオキシカルボニル、カルバモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、（ $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ）カルボニル、（ $C_1 \sim C_6$ - アルキル）チオカルボニル、（ $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ）チオカルボニル、チオカルバモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノ - チオカルボニル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - 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、スルファモイル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノスルホニル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、アミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルアミノカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルカルボニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルオキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルアミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル（アミノ基は、 R^8 によって置換され得る）、ヒドロキシイミノ、ヒドロキシアミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシイミノ - $C_1 \sim C_6$ - ア

ルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシミノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキルであり；

R^3 は、ハロゲン、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシであり；

R^4 は、 R^5 で単置換若しくは多置換されている $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は R^5 で単置換若しくは多置換されている $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルであり；

R^5 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）及び R^8 で単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）から独立して選択され；

R^6 は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、シアノ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル及び $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルから独立して選択され；

R^8 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル及びシアノから独立して選択され；

R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル及びシアノから独立して選択され；及び

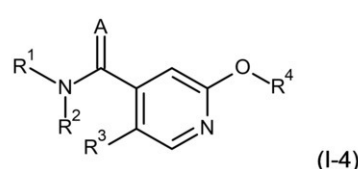
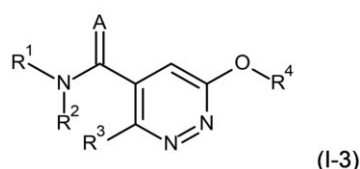
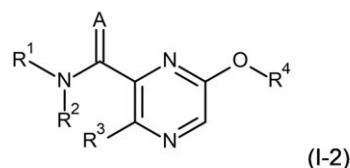
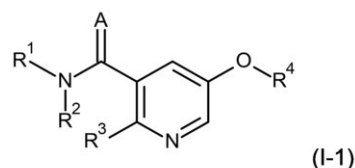
R^{10} は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 \sim C_6$ - 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、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルチオ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルチオ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルスルホニルオキシ、フェニル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル及び $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルから独立して選択されて単置換又は多置換され得る）、フェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、フェニル - $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、シアノ及びニトロから独立して選択される）

の化合物又は式（I）の化合物の農芸化学的に許容可能な塩、立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及びN - オキシドである。

【0067】

一実施形態では、式（I）の化合物は、式（I - 1）、（I - 2）、（I - 3）又は（I - 4）

【化4】



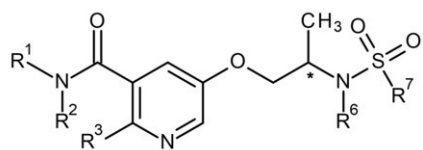
（式中、A、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^4 は、第1の態様で定義されているとおりである）

によって表される。

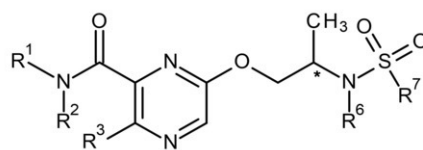
【 0 0 6 8 】

一実施形態では、式 (I) の化合物は、式 (I - 1 a) 、 (I - 2 a) 、 (I - 3 a)
又は (I - 4 a)

【 化 5 】

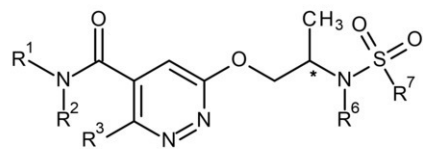


(I-1a)

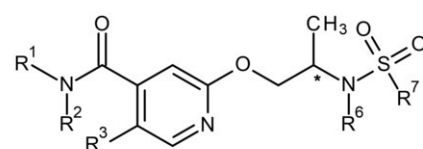


(I-2a)

10



(I-3a)



(I-4a)

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^6 は、第 1 の態様で定義されているとおりであり；及び R^7
は、(I - 1 a) 、 (I - 2 a) 、 (I - 3 a) 及び (I - 4 a) について独立して、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル及び R^9 によって単置換又は多置換され得
る $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルから選択され、星印 (*) によって示される炭素に結合す
るメチル基は、(S) 若しくは (R) 鏡像異性体又はこれらの混合物の形態であり得る)
によって表される。

20

【 0 0 6 9 】

一実施形態では、式 (I - 1 a) 、 (I - 2 a) 、 (I - 3 a) 及び (I - 4 a) によ
って表される化合物は、(S) 鏡像異性体である。

【 0 0 7 0 】

本発明に係る実施形態は、以下に記載のとおり提供される。

【 0 0 7 1 】

本発明の各態様の実施形態では、A は、

A . 酸素；又は

B . 硫黄

である。

30

【 0 0 7 2 】

本発明の各態様の実施形態では、

A . X、Y 及び Z の 1 つ又は 2 つは、N であり、且つ残りは、 CR^8 であるか；又は

B . X は、N であり、且つ Z 及び Y は、それぞれ CR^8 であるか；又は

C . X 及び Z は、N であり、且つ Y は、 CR^8 であるか；又は

D . X 及び Y は、N であり、且つ Z は、 CR^8 であるか；又は

E . Y は、N であり、且つ X 及び Z は、それぞれ CR^8 であり；

F . X は、N であり、且つ Z 及び Y は各々 CH であるか；又は

G . X 及び Z は、N であり、且つ Y は、CH であるか；又は

H . X 及び Y は、N であり、且つ Z は、CH であるか；又は

I . Y は、N であり、且つ X 及び Z は、それぞれ CH である。

40

【 0 0 7 3 】

本発明の各態様の実施形態では、 R^1 は、

A . 水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、シアノ- $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ヘテロシクリル若しくは
 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル；又は

B . 水素、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、C

50

3 ~ C₄ - シクロアルキル、シアノ - C₃ ~ C₄ - シクロアルキル、C₃ ~ C₄ - ハロシクロアルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル、4 員若しくは 5 員ヘテロシクリル若しくは C₁ ~ C₃ - アルコキシ - C₃ ~ C₄ - シクロアルキル；又は
C . C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - ハロアルキル、C₂ ~ C₆ - 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 ~ C₆ - アルキル、4 員ヘテロシクリル若しくはシアノ - C₃ ~ C₆ - シクロアルキル；又は

D . C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - ハロアルキル、C₂ ~ C₄ - アルキニル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル、C₃ ~ C₄ - ハロシクロアルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル、SO₂を有する 4 員ヘテロシクリル若しくはシアノ - C₃ ~ C₄ - シクロアルキル；又は

E . エチル、イソプロピル、プロパルギル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、1 - シアノシクロブチル、3, 3 - ジフルオロシクロブチル、1, 1 - ジオキソチエタン - 3 - イル若しくはシクロプロピルメチル

である。

【0074】

本発明の各態様の実施形態では、R²は、

A . 水素、C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - ハロアルキル、C₃ ~ C₆ - シクロアルキル、C₃ ~ C₆ - シクロアルキル - C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - アルコキシ - C₃ ~ C₆ - シクロアルキル、C₁ ~ C₆ - アルコキシ - C₁ ~ C₆ - アルキル若しくは C₁ ~ C₆ - アルキルカルボニル；又は

B . 水素、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - ハロアルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルコキシ - C₃ ~ C₄ - シクロアルキル、C₁ ~ C₃ - アルコキシ - C₁ ~ C₃ - アルキル若しくは C₁ ~ C₃ - アルキルカルボニル；又は

C . 水素、C₁ ~ C₆ - アルキル、C₁ ~ C₆ - アルキルカルボニル若しくは C₁ ~ C₆ - アルコキシカルボニル；又は

D . 水素、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルキルカルボニル若しくは C₁ ~ C₃ - アルコキシカルボニル；又は

E . 水素、メチル、アセチル若しくは 2 - メチルプロパノイル

である。

【0075】

本発明の各態様の実施形態では、R³は、

A . ハロゲン、C₁ ~ C₆ - アルキル若しくはシアノ；又は

B . ハロゲン、C₁ ~ C₃ - アルキル若しくはシアノ；又は

C . 塩素、メチル若しくはシアノ；又は

D . 塩素若しくは臭素；又は

E . 塩素

である。

【0076】

本発明の各態様の実施形態では、R⁴は、

10

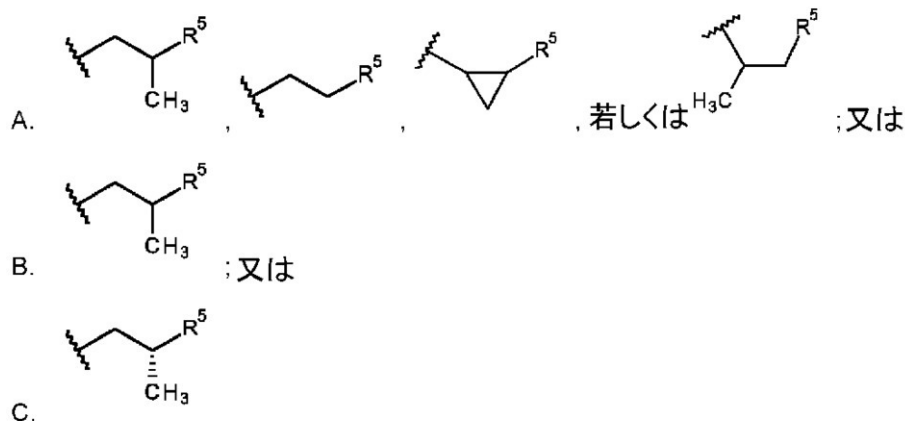
20

30

40

50

【化 6】



10

である。

【0077】

本発明の各態様の実施形態では、 R^5 は、

A. $C_1 \sim C_6$ -アルキルスルホニルアミノ(アミノ基は、 R^6 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルスルホニルアミノ(アミノ基は、 R^6 によって置換され得る)及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルスルホニルアミノ(アミノ基は、 R^6 によって置換され得る);又は

20

B. $C_1 \sim C_3$ -アルキルスルホニルアミノ(アミノ基は、 R^6 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルスルホニルアミノ(アミノ基は、 R^6 によって置換され得る)又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルスルホニルアミノ(アミノ基は、 R^6 によって置換され得る);又は

C. イソプロピルスルホニルアミノ、ジフルオロメチルスルホニルアミノ、トリフルオロメチルスルホニルアミノ、ジフルオロメチルスルホニルアミノ、ジクロロメチルスルホニルアミノ若しくはシクロプロピルスルホニルアミノ;又は

D. イソプロピルスルホニルアミノ、ジフルオロメチルスルホニルアミノ、トリフルオロメチルスルホニルアミノ、ジフルオロメチルスルホニルアミノ若しくはシクロプロピルスルホニルアミノ;又は

30

E. ジフルオロメチルスルホニルアミノ若しくはトリフルオロメチルスルホニルアミノである。

【0078】

本発明の各態様の実施形態では、 R^6 は、

A. 水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル若しくは $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル;又は

B. 水素、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル若しくは $C_1 \sim C_3$ -アルキルカルボニル;又は

40

C. 水素、メチル、メトキシメチル、シクロプロピルメチル若しくはアセチルである。

【0079】

本発明の各態様の実施形態では、 R^7 は、

A. $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、又は

B. メチル、エチル、イソプロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル若しくはシクロプロピル;又は

C. メチル、エチル、イソプロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロ

50

メチル若しくはシクロプロピル；又は

D．イソプロピル、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル若しくはシクロプロピルである。

【0080】

本発明の各態様の実施形態では、 R^8 は、

A．水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル若しくはシアノ；又は

B．水素、クロロ、ブロモ、フルオロ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル若しくはシアノ；又は

C．水素

である。

【0081】

本発明の各態様の実施形態では、 R^9 は、

A．ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル若しくはシアノ；又は

B．クロロ、ブロモ、フルオロ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル若しくはシアノである。

【0082】

本発明の各態様の実施形態では、 R^{10} は、

A．ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -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、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -アルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_3$ -アルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_3$ -アルキルチオ- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルチオ- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルキルスルホニルオキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキルスルホニルオキシ、フェニル（これは、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルから独立して選択されて単置換又は多置換され得る）、フェニル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、フェニル- $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、シアノ若しくはニトロ；又は

B．クロロ、ブロモ、フルオロ、メチル、エチル、イソプロピル、メトキシ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル若しくはシアノである。

【0083】

本発明は、従って、上記で定義されているA、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 及び R^{10} をあらゆる組み合わせ/各順列で有する式(I)の化合物を提供する。

【0084】

従って、Aが実施形態A（すなわち、Aは、酸素である）であり；X、Y及びZが実施形態A（すなわち、X、Y及びZの1つ又は2つは、Nであり、及び残りは、 CR^8 である）であり； R^1 が実施形態B（すなわち、 R^1 は、水素、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、シアノ- $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、4員若しくは5員ヘテロシクリル又は $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ- $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキルである）であり； R^2 が実施形態C（すなわち、 R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ -アルコシカルボニルである）であり； R^3 が実施形態B（すなわち、 R^3 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル又はシアノである）であり； R^4 が第1の態様（すなわち、 R^4 は、 R^5 で単置換若しく

10

20

30

40

50

は多置換されている $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は R^5 で単置換若しくは多置換されている $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルである) のものであり; R^5 が実施形態 B (すなわち、 R^5 は、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ (アミノ基は、 R^6 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ (アミノ基は、 R^6 によって置換され得る) 及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ (アミノ基は、 R^6 によって置換され得る) である) であり; R^6 が実施形態 B (すなわち、 R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル又は $C_1 \sim C_3$ - アルキルカルボニルである) であり; 及び R^9 が第 1 の態様 (すなわち、 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノである) のものである、式 (I) の化合物が例えば提供される。

10

【0085】

好ましくは、

A が実施形態 A (すなわち、A は、酸素である) であり;

X、Y 及び Z が実施形態 A (すなわち、X、Y 及び Z の 1 つ又は 2 つは、N であり、及び残りは、 CR^8 である) であり;

R^1 が実施形態 B (すなわち、 R^1 は、水素、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル、シアノ - $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ - ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、4 員若しくは 5 員ヘテロシクリル又は $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル) であり;

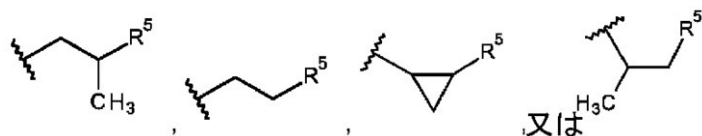
20

R^2 が実施形態 C (すなわち、 R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルである) であり;

R^3 が実施形態 B (すなわち、 R^3 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル又はシアノである) であり;

R^4 が、

【化 7】



30

であり;

R^5 が実施形態 C (すなわち、 R^5 は、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ (アミノ基は、 R^6 によって置換され得る)、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ (アミノ基は、 R^6 によって置換され得る) 及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ (アミノ基は、 R^6 によって置換され得る) である) であり;

R^6 が実施形態 B (すなわち、 R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル又は $C_1 \sim C_3$ - アルキルカルボニルである) であり; 及び

40

R^9 が第 1 の態様 (すなわち、 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノである) のものである、式 (I) の化合物である。

【0086】

本発明の各態様の実施形態では、

R^1 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、シアノ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、ヘテロシクリル又は $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルであり;

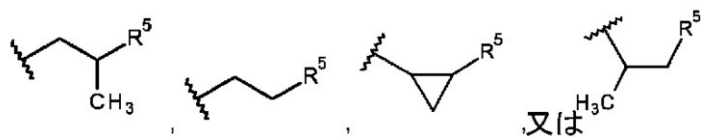
50

R^2 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_6$ - アルキル又は $C_1 \sim C_6$ - アルキルカーボンであり；

R^3 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル又はシアノであり；

R^4 が、

【化 8】



10

であり；

R^5 が、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）であり；

R^6 が、水素、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_3$ - アルキル又は $C_1 \sim C_3$ - アルキルカルボニルであり；及び

20

R^9 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノである、式（I - 1）、（I - 2）、（I - 3）又は（I - 4）の化合物である。

【0087】

本発明の各態様の実施形態では、

R^1 が、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ - アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_6$ - アルキル、4員ヘテロシクリル又はシアノ - $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルであり；

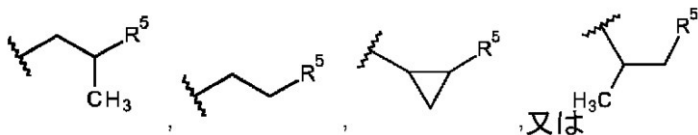
R^2 が、水素、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルキルカルボニル又は $C_1 \sim C_6$ - アルコキシカルボニルであり；

30

R^3 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル又はシアノであり；

R^4 が、

【化 9】



であり；

R^5 が、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）であり；

40

R^6 が、水素、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ - $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_3 \sim C_4$ - シクロアルキル - $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_3$ - アルキルカルボニルであり；及び

R^9 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノである、式（I - 1）、（I - 2）、（I - 3）又は（I - 4）の化合物である。

50

【 0 0 8 8 】

本発明の各態様の実施形態では、

R^1 が、エチル、イソプロピル、プロパルギル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、1 - シアノシクロブチル、3, 3 - ジフルオロシクロブチル、1, 1 - ジオキソチエタン - 3 - イル又はシクロプロピルメチルであり；

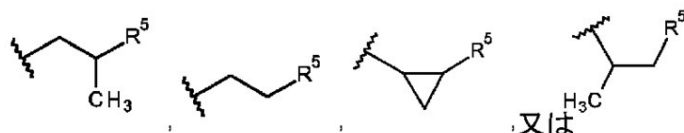
R^2 が、水素、メチル、アセチル又は2 - メチルプロパノイルであり；

R^3 が、塩素、メチル又はシアノであり；

R^4 が、

【 化 1 0 】

10



であり；

R^5 が、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）であり；

20

R^6 が、水素、メチル、メトキシメチル、シクロプロピルメチル又はアセチルであり；及び

R^9 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノである、式（I - 1）、（I - 2）、（I - 3）又は（I - 4）の化合物である。

【 0 0 8 9 】

本発明の各態様の実施形態では、

R^1 が、エチル、イソプロピル、プロパルギル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、シクロプロピル、1 - シアノシクロプロピル、1 - シアノシクロブチル、3, 3 - ジフルオロシクロブチル、1, 1 - ジオキソチエタン - 3 - イル又はシクロプロピルメチルであり；

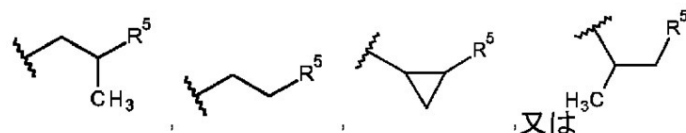
30

R^2 が、水素、メチル、アセチル又は2 - メチルプロパノイルであり；

R^3 が、塩素、臭素又はメチルであり；

R^4 が、

【 化 1 1 】



40

であり；

R^5 が、 $C_1 \sim C_3$ - アルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）及び R^9 によって単置換又は多置換され得る $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキルスルホニルアミノ（アミノ基は、 R^6 によって置換され得る）であり；

R^6 が、水素、メチル、メトキシメチル、シクロプロピルメチル又はアセチルであり；及び

R^9 が、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ - アルキル、 $C_1 \sim C_3$ - アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ - ハロアルキル又はシアノである、式（I - 1）、（I - 2）、（I - 3）又は（I - 4）の化合物である。

50

【 0 0 9 0 】

本発明の各態様の実施形態では、式 (I - 1 a)、(I - 2 a)、(I - 3 a)又は (I - 4 a)の化合物は、 R^1 として、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、シアノ- $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、ヘテロシクリル又は $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル； R^2 として、水素、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_6$ -アルキル又は $C_1 \sim C_6$ -アルキルカーボン； R^3 として、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル又はシアノ； R^6 として、水素、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル又は $C_1 \sim C_3$ -アルキルカルボニル；及び R^7 として、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル（ここで、 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又はシアノである）を有する。

10

【 0 0 9 1 】

本発明の各態様の実施形態では、式 (I - 1 a)、(I - 2 a)、(I - 3 a)又は (I - 4 a)の化合物は、 R^1 として、エチル、イソプロピル、プロパルギル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノシクロブチル、3, 3-ジフルオロシクロブチル、1, 1-ジオキソチエタン-3-イル又はシクロプロピルメチル； R^2 として、水素、メチル、アセチル又は2-メチルプロパノイル； R^3 として、塩素、臭素又はメチル； R^6 として、水素、メチル、メトキシメチル、シクロプロピルメチル又はアセチル；及び R^7 として、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル（ここで、 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又はシアノである）を有する。

20

【 0 0 9 2 】

本発明の各態様の実施形態では、式 (I - 1 a)、(I - 2 a)、(I - 3 a)又は (I - 4 a)の化合物は、 R^1 として、エチル、イソプロピル、プロパルギル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2-ジフルオロエチル、シクロプロピル、1-シアノシクロプロピル、1-シアノシクロブチル、3, 3-ジフルオロシクロブチル、1, 1-ジオキソチエタン-3-イル又はシクロプロピルメチル； R^2 として、水素、メチル、アセチル又は2-メチルプロパノイル； R^3 として、塩素、臭素又はメチル； R^6 として、水素、メチル、メトキシメチル、シクロプロピルメチル又はアセチル；及び R^7 として、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル（ここで、 R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又はシアノである）を有する。

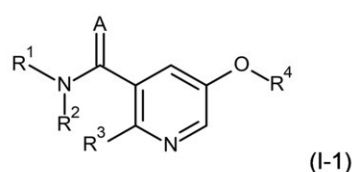
30

【 0 0 9 3 】

本発明のさらなる実施形態では、式 (I)の化合物は、式 (I - 1)

40

【 化 1 2 】



(式中、

A は、O であり；

R^1 は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim$

50

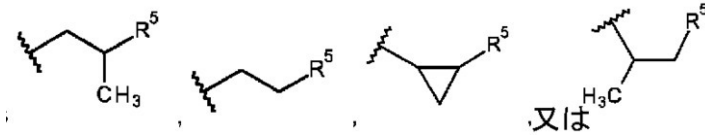
C₄ - シクロアルキル、C₃ ~ C₄ - ハロシクロアルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル、4 員ヘテロシクリル又はシアノ - C₃ ~ C₄ - シクロアルキルであり；

R²は、水素、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルキルカルボニル又はC₁ ~ C₃ - アルコキシカルボニルであり；

R³は、ハロゲンであり；

R⁴は、

【化 1 3】



10

であり；

R⁵は、C₁ ~ C₃ - アルキルスルホニルアミノ、C₁ ~ C₃ - ハロアルキルスルホニルアミノ又はC₃ ~ C₆ - シクロアルキルスルホニルアミノであり、前記アミノ基のいずれかは、無置換であるか又はR⁶によって置換されており；前記シクロアルキル基のいずれかは、R⁹によって単置換又は多置換され得；

R⁶は、水素、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルコキシ - C₁ ~ C₃ - アルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル又はC₁ ~ C₃ - アルキルカルボニルであり；及び

20

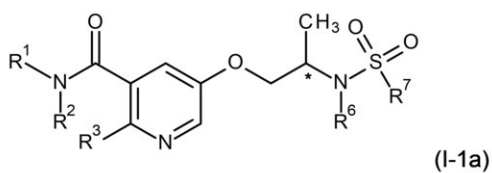
R⁹は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルコキシ、C₁ ~ C₃ - ハロアルキル又はシアノである）

の化合物である。

【0094】

本発明のさらなる実施形態では、式 (I) の化合物は、式 (I - 1 a)

【化 1 4】



30

(式中、

R¹は、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - ハロアルキル、C₂ ~ C₄ - アルキニル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル、C₃ ~ C₄ - ハロシクロアルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル、4 員ヘテロシクリル又はシアノ - C₃ ~ C₄ - シクロアルキルであり；

R²は、水素、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルキルカルボニル又はC₁ ~ C₃ - アルコキシカルボニルであり；

40

R³は、ハロゲンであり；

R⁶は、水素、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルコキシ - C₁ ~ C₃ - アルキル、C₃ ~ C₄ - シクロアルキル - C₁ ~ C₃ - アルキル又はC₁ ~ C₃ - アルキルカルボニルであり；

R⁷は、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - ハロアルキル又はR⁹によって単置換若しくは多置換され得るC₃ ~ C₄ - シクロアルキルであり；及び

R⁹は、ハロゲン、C₁ ~ C₃ - アルキル、C₁ ~ C₃ - アルコキシ、C₁ ~ C₃ - ハロアルキル又はシアノである）

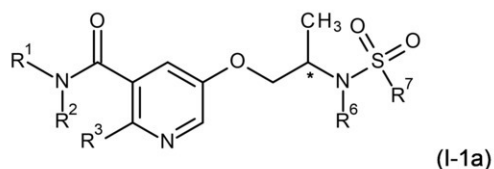
の化合物である。

【0095】

50

本発明のさらなる実施形態では、式 (I) の化合物は、式 (I - 1 a)

【化 1 5】



(式中、

R¹は、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-ハロアルキル、C₂～C₄-アルキニル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₃-アルキル、4員ヘテロシクリル又はシアノ-C₃～C₄-シクロアルキルであり；

R²は、水素、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルキルカルボニル又はC₁～C₃-アルコキシカルボニルであり；

R³は、ハロゲンであり；

R⁶は、水素、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルコキシ-C₁～C₃-アルキル、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₃-アルキル又はC₁～C₃-アルキルカルボニルであり；R⁷は、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-ハロアルキル又はR⁹によって単置換若しくは多置換され得るC₃～C₄-シクロアルキルであり；及び

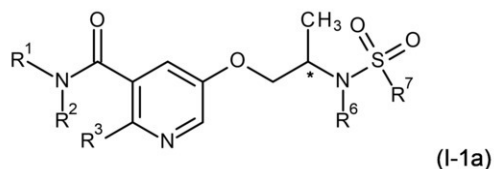
R⁹は、ハロゲン、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルコキシ、C₁～C₃-ハロアルキル又はシアノである)

の化合物であり、及び前記化合物は、(S) 鏡像異性体である。

【 0 0 9 6】

本発明のさらなる実施形態では、式 (I) の化合物は、式 (I - 1 a)

【化 1 6】



(式中、

R¹は、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-ハロアルキル、C₂～C₄-アルキニル、C₃～C₄-シクロアルキル、C₃～C₄-ハロシクロアルキル、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₃-アルキル、4員ヘテロシクリル又はシアノ-C₃～C₄-シクロアルキルであり；

R²は、水素、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルキルカルボニル又はC₁～C₃-アルコキシカルボニルであり；

R³は、塩素又は臭素であり；

R⁶は、水素、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルコキシ-C₁～C₃-アルキル、C₃～C₄-シクロアルキル-C₁～C₃-アルキル又はC₁～C₃-アルキルカルボニルであり；R⁷は、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-ハロアルキル又はR⁹によって単置換若しくは多置換され得るC₃～C₄-シクロアルキルであり；及び

R⁹は、ハロゲン、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-アルコキシ、C₁～C₃-ハロアルキル又はシアノである)

の化合物であり、及び前記化合物は、(S) 鏡像異性体である。

【 0 0 9 7】

一実施形態では、式 (I) の化合物は、式 (I - 5 a)

10

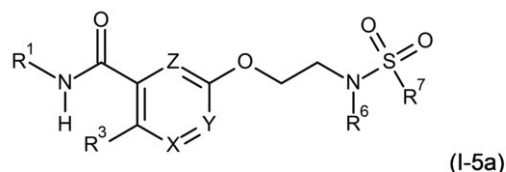
20

30

40

50

【化 17】



(式中、X、Y、Z、 R^1 、 R^2 、 R^3 及び R^6 は、式(I)の化合物について定義されているとおりであり；及び R^7 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキルから選択される) 10

【0098】

好ましくは、式(I-5a)の化合物において、

Xは、Nであり；

Y、Zは、CHであり；

R^1 は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、4員ヘテロシクリル又はシアノ- $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキルであり；

R^3 は、ハロゲンであり；

R^6 は、水素、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル又は $C_1 \sim C_3$ -アルキルカルボニルであり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキルであり；及び

R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又はシアノである。

【0099】

好ましくは、式(I-5a)の化合物において、

Xは、Nであり；

Y、Zは、CHであり；

R^1 は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、4員ヘテロシクリル又はシアノ- $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキルであり；

R^3 は、塩素、臭素又はメチルであり；

R^6 は、水素であり；

R^7 は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又は R^9 によって単置換若しくは多置換され得る $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキルであり；及び

R^9 は、ハロゲン、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル又はシアノである。

【0100】

好ましくは、式(I-5a)の化合物において、

Xは、Nであり；

Y、Zは、CHであり；

R^1 は、 $C_1 \sim C_3$ -アルキル、 $C_1 \sim C_3$ -ハロアルキル、 $C_2 \sim C_4$ -アルキニル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキル- $C_1 \sim C_3$ -アルキル、4員ヘテロシクリル又はシアノ- $C_3 \sim C_4$ -シクロアルキルであり；

R^3 は、塩素、臭素又はメチルであり；

R⁶は、水素であり；

R⁷は、C₁～C₃-アルキル、C₁～C₃-ハロアルキル又はC₃～C₄-シクロアルキルである。

【0101】

本発明の一実施形態では、本発明に係る式(I)の化合物は、表1～5のいずれか1つに列挙される化合物から選択される。

【0102】

本発明の他の実施形態では、本発明に係る式(I)の化合物は、表P(以下)に列挙される化合物から選択される。

【0103】

好ましくは、本発明に係る式(I)の化合物は、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(ジクロロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、N-(1-ピシクロ[1.1.1]ペンタニル)-2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、tert-ブチルN-[(1S)-2-[[6-クロロ-5-[(1-シアノシクロプロピル)カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-N-(トリフルオロメチルスルホニル)カルバメート、2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[(2S)-2-[メチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[(2S)-2-[シアノメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、[[(1S)-2-[[6-クロロ-5-[(1-シアノシクロプロピル)カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]- (トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]メチル2-メチルプロパノエート、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(ジフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、N-tert-ブチル-2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、N-アセチル-2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、[[(1S)-2-[[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]- (トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]メチル2-メチルプロパノエート、メチルN-[(1S)-2-[[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-N-(トリフルオロメチルスルホニル)カルバメート、2-クロロ-5-[(2S)-2-[シアノメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]-N-シクロプロピル-ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-[メチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)エトキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-(5-シアノ-3-フルオロ-2-ピリジル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-(5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-N-(5-クロロ-3-メチル-2-ピリジル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド、2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフ

10

20

30

40

50

ルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ] - N - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニ
 ル)ピリジン - 3 - カルボキサミド、 2 - クロロ - N - (4 - シアノ - 2 - フルオロ - フ
 エニル) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]
 ピリジン - 3 - カルボキサミド、 2 - クロロ - N - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 5
 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3
 - カルボキサミド、 2 - クロロ - N - (2 - フルオロ - 4 - メチルスルホニル - フェニル
) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジ
 ン - 3 - カルボキサミド、 2 - クロロ - N - (4 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル) -
 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン -
 3 - カルボキサミド、 N - (1 - ビシクロ [1 . 1 . 1] ペンタニル) - 2 - メチル - 5
 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3
 - カルボキサミド、 N - [1 - [2 - (5 - シアノ - 2 - ピリジル) - 1 , 2 , 4 - トリ
 アゾール - 3 - イル]エチル] - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチ
 ルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - [(5 - クロロ
 - 2 - ピリジル)メチル] - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルス
 ルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - [(2 E) - 2 - メ
 トキシイミノ - 1 , 1 - ジメチル - エチル] - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリ
 フルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 2 - メ
 チル - N - [3 - オキソ - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル)イソキサゾリジン -
 4 - イル] - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ
]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - (1 - シクロプロピルエチル) - 2 - メチル - 5
 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3
 - カルボキサミド、 N - [(3 - クロロ - 2 - ピリジル)メチル] - 2 - メチル - 5 - [(2
 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カ
 ルボキサミド、 N - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2
 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミ
 ド、 N - イソプロピル - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホ
 ニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - [1 - (4 - フルオロフェ
 ニル) - 2 - オキソ - ピロリジン - 3 - イル] - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (ト
 リフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N -
 エチル - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プ
 ロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - (3 , 3 - ジフルオロシクロブチル) -
 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ
]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 2 - メチル - N - [1 - (5 - メチル - 1 , 2 , 4 -
 オキサジアゾール - 3 - イル)エチル] - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルス
 ルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - (2 , 2 - ジフル
 オロエチル) - 2 - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミ
 ノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 N - シクロプロピル - N , 2 - ジメチル
 - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン
 - 3 - カルボキサミド、 N - (シクロプロピルメトキシ) - 2 - メチル - 5 - [(2 S)
 - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサ
 ミド、 t e r t - ブチル N - [(1 S) - 2 - [[6 - クロロ - 5 - (シクロプロピルカ
 ルバモイル) - 3 - ピリジル]オキシ] - 1 - メチル - エチル] - N - (トリフルオロメ
 チルスルホニル)カルバメート、 5 - [(2 S) - 2 - [アセチル(トリフルオロメチル
 スルホニル)アミノ]プロポキシ] - 2 - クロロ - N - シクロプロピル - ピリジン - 3 -
 カルボキサミド、 N - ベンジル - 2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチ
 ルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 2 - クロロ - N - (1
 - シクロプロピルエチル) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルア
 ミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、 2 - クロロ - N - [(1 - シアノシ
 クロプロピル)メチル] - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ

10

20

30

40

50

) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - (1 - シアノシクロブ
 ロピル) - N - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)
 プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - (1 - シアノシクロブチ
 ル) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリ
 ジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - [(4 S) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イ
 ソキサゾリジン - 4 - イル] - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルア
 ミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - エチル - 5 - [(2
 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カル
 ボキサミド、2 - クロロ - N - (3 - メチルテトラヒドロフラン - 3 - イル) - 5 - [(2
 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カル
 ボキサミド、2 - クロロ - N - プロブ - 2 - イニル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオ
 ロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ -
 N - [2 - (シクロプロピルメチルアミノ) - 2 - オキソ - エチル] - 5 - [(2 S) - 2 -
 (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミ
 ド、2 - クロロ - N - [3 - オキソ - 2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) イソキサ
 ザリジン - 4 - イル] - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)
 プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - (2 , 2 - ジフルオロエ
 チル) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピ
 リジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - フェニル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリ
 フルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - ク
 ロロ - N - (1 - シアノ - 1 - メチル - エチル) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロ
 メチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N
 - シクロプロピル - N - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニル
 アミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - (2 , 2 - ジフ
 ルオロエチル) - N - メチル - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルア
 ミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - (4 - フルオロ -
 2 - メチル - フェニル) - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)
) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド、N - シクロプロピル - 5 - [(2 S) - 2 -
 [メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ] プロボキシ] - 2 - メ
 チル - ピリジン - 3 - カルボキサミド、N - シクロプロピル - 2 - メチル - 5 - [(2 S)
) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキ
 サミド、2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - [メトキシメチル(トリフルオロメチルスル
 ホニル)アミノ] プロボキシ] - N - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) ピリジン - 3
 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - シクロプロピル - 5 - [(2 S) - 2 - [メトキシ
 メチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ] プロボキシ] ピリジン - 3 - カルボキ
 サミド、2 - クロロ - N - [(4 R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4
 - イル] - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピ
 リジン - 3 - カルボキサミド、N - (1 - ピシクロ[1 . 1 . 1] ペンタニル) - 5 -
 メチル - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピ
 リジン - 4 - カルボキサミド、N - (1 - シアノシクロプロピル) - N , 5 - ジメチル -
 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン -
 4 - カルボキサミド、N - (4 - エチルチアゾール - 5 - イル) - 5 - メチル - 2 - [(2
 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 4 - カル
 ボキサミド、N - (1 , 3 - ジヒドロイソベンゾフラン - 5 - イルメチル) - 5 - メチル
 - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロボキシ] ピリジン
 - 4 - カルボキサミド、5 - メチル - N - [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] - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホ
 ニルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - [2 - (2 - フルオロフ
 ェノキシ) エチル] - 5 - メチル - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニ
 ルアミノ) プロボキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - (5 - メトキシ - 1 , 1 -

10

20

30

40

50

ジメチル - ペンタ - 2 - イニル) - 5 - メチル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - (1 - シクロプロピルエチル) - 5 - メチル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - [1 - (2 - エチルチアゾール - 4 - イル)エチル] - 5 - メチル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - (3 - シアノ - 2 - フルオロ - フェニル) - 5 - メチル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - メチル - N - [1 - (3 - ピリジル)エチル] - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - ベンジル - 5 - メチル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - [(4R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4 - イル] - 2 - [(2S) - 2 - [メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ] - 5 - メチル - ピリジン - 4 - カルボキサミド、N - (1 - シアノシクロプロピル) - 2 - [(2S) - 2 - [メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ] - 5 - メチル - ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - メチル - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2S) - 2 - [メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - ブロモ - N - (1 - シアノシクロプロピル) - 2 - [(2S) - 2 - [メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - ブロモ - N - [(4R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4 - イル] - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - ブロモ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - ブロモ - N - (1 - シアノシクロプロピル) - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、5 - クロロ - N - シクロプロピル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド、3 - クロロ - N - シクロプロピル - 6 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリダジン - 4 - カルボキサミド、3 - クロロ - N - (1 - シアノシクロプロピル) - 6 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリダジン - 4 - カルボキサミド又はN - (1 - ビシクロ[1.1.1]ペンタニル) - 3 - クロロ - 6 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリダジン - 4 - カルボキサミドから選択される。

【0104】

より好ましくは、本発明に係る式(I)の化合物は、2 - クロロ - N - シクロプロピル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド、2 - クロロ - N - (1 - シアノシクロプロピル) - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド又は2 - クロロ - N - (2, 2, 2 - トリフルオロエチル) - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミドから選択される。

【0105】

第2の態様では、本発明は、第1の態様で定義されている式(I)の化合物、1種以上の助剤及び希釈剤並びに任意に1種以上の他の有効成分を含む組成物を提供する。

【0106】

第3の態様では、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物を駆除及び防除する方法

を提供し、これは、有害生物、有害生物の生息地又は有害生物による攻撃を受けやすい植物に、殺虫的、殺ダニ的、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、第 1 の態様で定義されている化合物又は第 2 の態様で定義されている組成物を適用することを含む。

【 0 1 0 7 】

第 4 の態様では、本発明は、昆虫、ダニ類、線虫又は軟体動物による攻撃からの植物繁殖材料の保護の方法を提供し、これは、繁殖材料又は繁殖材料が植えられている場所を、有効量の、第 1 の態様で定義されている式 (I) の化合物又は第 2 の態様で定義されている組成物で処理することを含む。

【 0 1 0 8 】

第 5 の態様では、本発明は、第 1 の態様で定義されている式 (I) の化合物又は第 2 の態様で定義されている組成物を含むか、又はそれで処理されているか若しくはそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料を提供する。

10

【 0 1 0 9 】

さらなる態様では、本発明は、寄生生物の防除を、それを必要としている動物内又は上で行う方法であって、有効量の、第 1 の態様で定義されている式 (I) の化合物を投与することを含む方法を提供する。本発明は、外寄生生物の防除を、それを必要としている動物上で行う方法であって、有効量の、第 1 の態様で定義されている式 I の化合物を投与することを含む方法をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害を予防及び / 又は処置する方法であって、それを必要としている動物に、有効量の、第 1 の態様で定義されている式 (I) の化合物を投与することを含む方法をさらに提供する。

20

【 0 1 1 0 】

式 (I) の化合物は、公知の方法に従うことにより、当業者によって調製可能である。より具体的には、式 I の化合物及び中間体は、従って、スキーム及び実施例で以下に記載のとおり調製可能である。特定のステレオジェン中心は、簡潔さのために不特定のままとされており、決してスキームによる教示を限定することを意図されない。

【 0 1 1 1 】

本発明に係る式 (I) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び A は、酸素である) は、以下に記載のとおり、中間体酸塩化物又は活性化アシル化剤を介して、式 (I I I) の化合物 (式中、 R^1 及び R^2 は、式 (I) について定義されているとおりである) を用いて式 (I I) の化合物 (式中、 R^3 、 R^4 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりである) を変換することによって得ることができる。これは、以下のスキーム 1 に示されている。

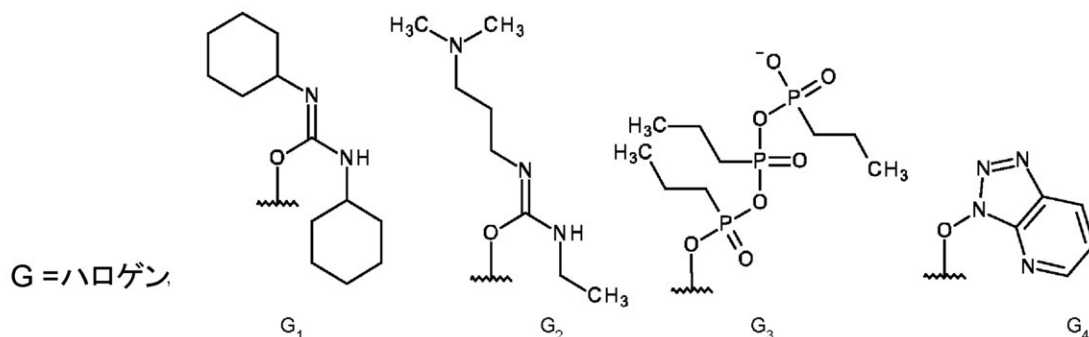
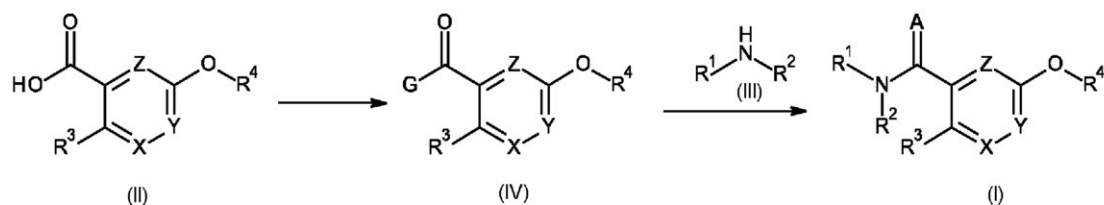
30

スキーム 1

40

50

【化 1 8】



10

【0 1 1 2】

スキーム 1 に示すとおり、化合物 I I は、当業者に公知の方法及び例えば *Tetrahedron* 2005, 61 (46), 10827-10852 に記載の方法によって式 I V の化合物に活性化される。例えば、G がハロゲンである式 I V の化合物は、ジクロロメタン又は T H F などの不活性溶剤中の触媒量の D M F の存在下、25 ~ 170、好ましくは 25 ~ 80 の温度における例えば塩化オキサリル又は塩化チオニルによる式 I I の化合物の処理により形成される。任意に、例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下における式 I I I の化合物（式中、R¹及び R²は、式 I で定義されているとおりである）による I V の処理は、式 I の化合物をもたらす。代わりに、式 I の化合物は、例えばピリジン又は T H F といった不活性溶剤中、任意に例えばトリエチルアミンといった塩基の存在下、rt ~ 180 の温度における活性種 I V（式中、G は G₁又は G₂である）をもたらすジシクロヘキシルカルボジイミド（D C C）又は 1 - エチル - 3 - (3 - ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド（E D C）による式 I I の化合物の処理により調製可能である。加えて、例えば *Synthesis* 2013, 45, 1569 及び *J. Prakt. Chemie* 1998, 340, 581 に記載されているとおり、式 I I の酸をプロパンホスホン酸無水物（T3P（登録商標））又は O - (7 - アザ - 1 - ベンゾトリアゾリル) - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート（H A T U）などのカップリング試薬による反応によって活性化して、式 I V の化合物（式中、G は G₃及び G₄である）をもたらすことが可能である。式 I I I のアミンとのその後の反応により、式 I の化合物が得られる。

20

30

【0 1 1 3】

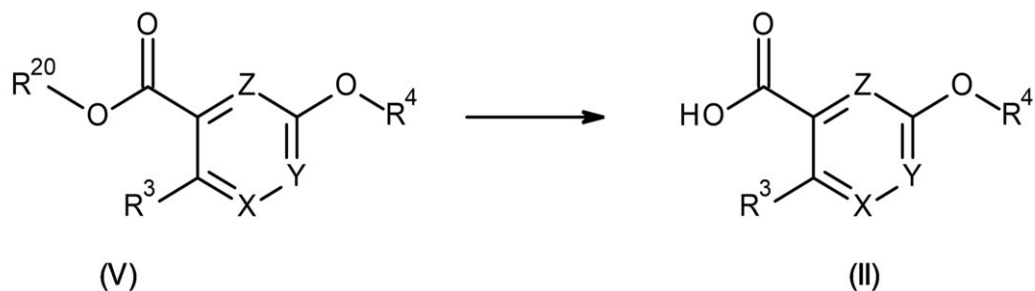
式 (I I) の化合物（式中、R³、R⁴、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりである）は、塩基又は酸の存在下における、式 (V) の化合物（式中、R³、R⁴、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R²⁰は、C₁ ~ C₆アルキルである）の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 2 に示されている。

40

スキーム 2

50

【化 19】



10

【0114】

スキーム 2 に示すとおり、化合物 (V) は、塩基性条件下における加水分解反応を経て、当業者に公知の方法、例えば ACS Chemical Neuroscience 2017, 2374 に記載の方法により、化合物 (II) に変換可能である。例えば、この反応は、水中、又はメタノール、THF 若しくはジクロロメタンなどの有機溶剤中、又は混合物中において水酸化リチウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (V) の化合物 (II) への転換は、当業者に公知の方法、例えば J. Med. Chem. 1986, 2363 に記載の方法により、酸性条件で行うことが可能である。例えば、この反応は、水中又は水とメタノール、THF 若しくはジオキサンなどの有機溶剤との混合物中においてトリフルオロ酢酸、塩酸又は硫酸などの酸の存在下で行うことが可能である。

20

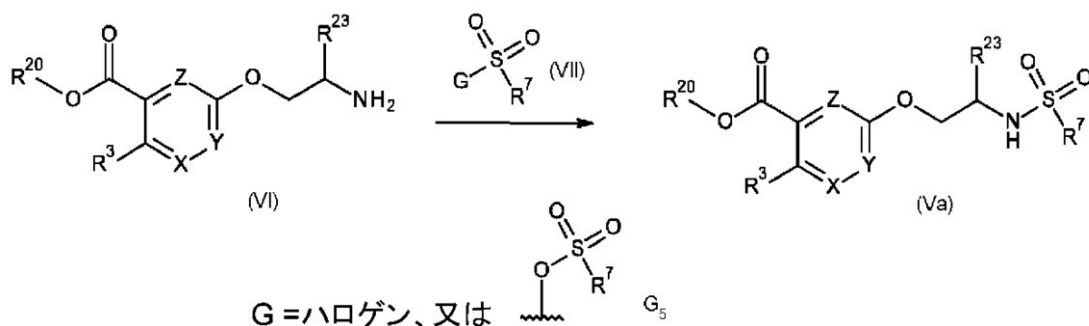
【0115】

式 (Va) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとありであり、及び R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (VII) のスルホニル化剤 (式中、 R^7 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロシクロアルキルであり、及び G は、ハロゲン又は式 G5 の活性化基である) の存在下における、式 (VI) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとありであり、及び R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 3 に示されている。

30

スキーム 3

【化 20】



40

【0116】

スキーム 3 に示すとおり、化合物 (VI) は、当業者に公知の方法、例えば Angew. Chem. Int. Ed. 2016, 5299; J. Am. Chem. Soc. 2018, 5322; 国際公開第 2021153720 号、国際公開第 2010150192 号に記載の方法により、化合物 (Va) に転換され得る。例えば、この反応は、ジクロロメタン、ジオキサン又は THF などの不活性有機溶剤中においてトリエチルアミン、ピリジン又は 1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エンなどの塩基の存在下で

50

行うことが可能である。代わりに、当業者に公知のとおり、塩形態（例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩、パラトルエンスルホン酸塩）の化合物（V I）は、同様に化合物（V a）への転換で使用可能である。

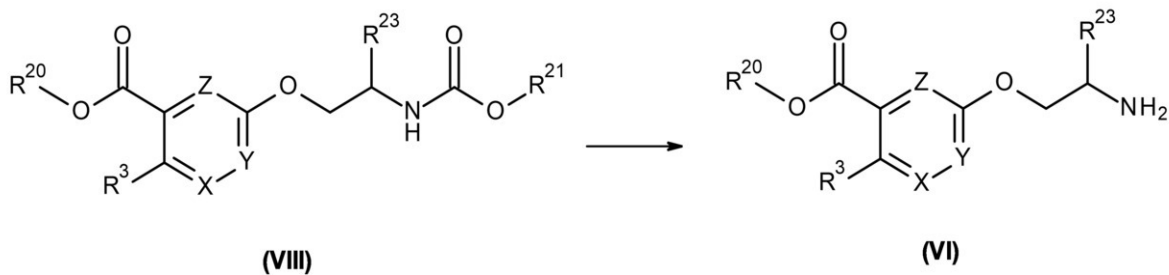
【0117】

式（V I）の化合物（式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式（I）について定義されておりであり、及び R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである）は、式（V I I I）の化合物（式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式（I）について定義されておりであり、 R^{20} 及び R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである）の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム4に示されている。

10

スキーム4

【化21】



20

【0118】

スキーム4に示すとおり、化合物（V I I I）は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第2002059117号、J. Med. Chem. 2003, 5238、Org. Lett. 2022, 2064に記載の方法により、化合物（V I）に転換され得る。例えば、この反応は、ジクロロメタン、ジオキサン又はTHFなどの有機溶剤中において塩酸、トリフルオロ酢酸又はパラトルエンスルホン酸などの有機又は無機酸の存在下で行うことが可能である。化合物（V I）は、その塩形態（例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩、パラトルエンスルホン酸塩）における以下の変換で得て使用することもできる。

【0119】

30

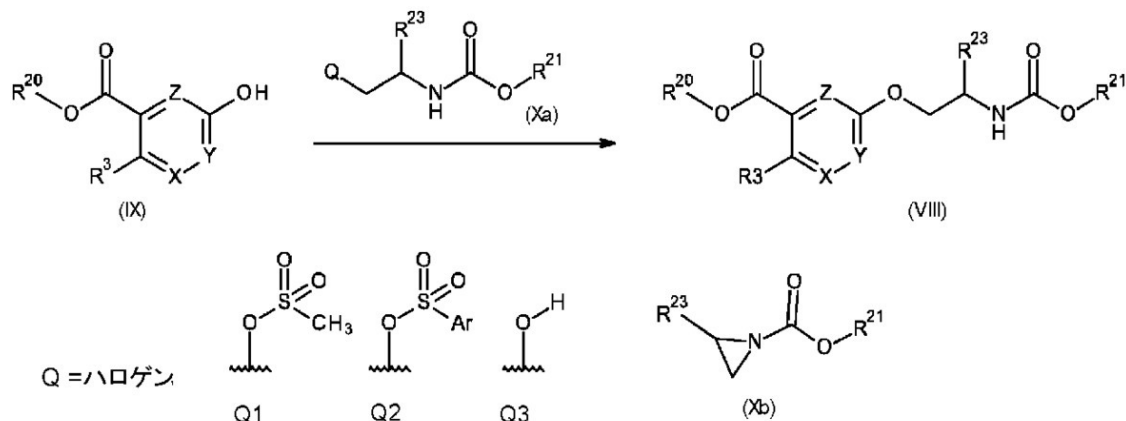
式（V I I I）の化合物（式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式（I）について定義されておりであり、 R^{20} 及び R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである）は、式（X a）のアルキル化剤（式中、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び Q は、ハロゲン、スルホネート基のヒドロキシルである）による、式（I X）の化合物（式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式（I）について定義されておりであり、及び R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである）の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム5に示されている。

スキーム5

40

50

【化 2 2】



10

【0120】

スキーム 5 に示すとおり、化合物 (IX) は、当業者に公知の方法、例えば *Angew. Chem. Int. Ed.* 2017, 12518; 国際公開第 2012101244 号、国際公開第 2004050619 号、国際公開第 2007072041 号に記載の方法により、Xa (Q がすなわちハロゲン又はスルホネート Q1 又は Q2 である場合) によるアルカリ化反応によって化合物 (VIII) に転換され得る。例えば、この反応は、ジメチルホルムアミド、アセトン又はアセトニトリルなどの有機溶剤中において炭酸セシウム、水素化ナトリウム又は炭酸ナトリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (IX) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2012074126 号; *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 1992, 481、*Beilstein J. Org. Chem.* 2006, 2, 21 に記載の方法により、Xa (Q が OH に等しい場合) による光延反応によって転換され得る。例えば、この反応は、トルエン又は THF などの有機溶剤中においてアザジカルボン酸ジエチル又はアザジカルボン酸ジイソプロピルなどのアザジカルボン酸試薬及びトリフェニルホスフィンなどのホスフィン試薬の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (IX) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2007070201 号に記載の方法により、アジリジン Xb とのアルキル化反応によって化合物 (VIII) に転換され得る。例えば、この反応は、アセトニトリルなどの有機溶剤中において炭酸カリウム、水素化ナトリウム又は炭酸ナトリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。

20

30

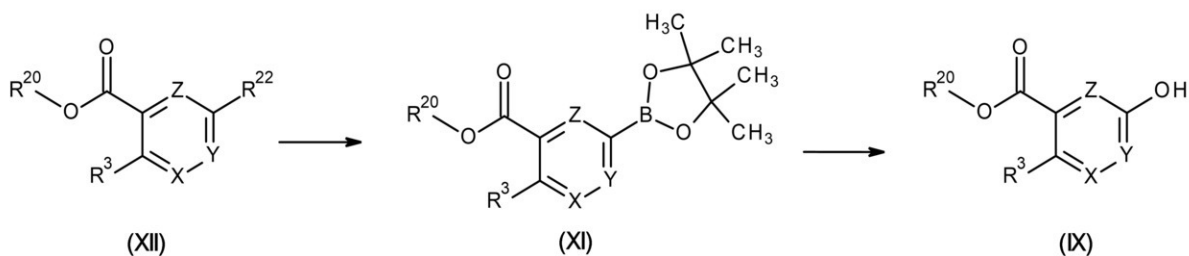
【0121】

式 (IX) の化合物 (式中、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとありであり、及び R^{20} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである) は、式 (XI) の中間体化合物 (式中、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとありであり、及び R^{20} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルである) を介した、式 (XII) の化合物 (式中、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとありであり、及び R^{20} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) の変換により 2 ステップで得ることができる。これは、以下のスキーム 6 に示されている。

40

スキーム 6

【化 2 3】



50

【 0 1 2 2 】

スキーム 6 に示すとおり、化合物 (XII) は、宮浦ホウ素化反応の名称を有する当業者に公知の方法及び例えば J. Org. Chem., 1995, 7508; J. Org. Chem., 2021, 103 に記載の方法により、化合物 (XII) に転換され得る。例えば、この反応は、THF 又はジオキサンなどの有機溶剤中、炭酸カリウム又は酢酸カリウムなどの塩基の存在下及び 1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンジクロロパラジウムなどの適当なリガンドとの組み合わせたパラジウム触媒の存在下で行うことが可能である。中間体 (XI) は、当業者に公知の方法、例えば Tetrahedron Letters 2014, 2082; Tetrahedron Lett. 2017, 3323; Tetrahedron 2005, 1417 に記載の方法により、式 (IX) の化合物に転換され得る。例えば、この反応は、水とエタノール、アセトニトリル又はジクロロメタンなどの有機溶剤との混合物中において過酸化水素の存在下で行うことが可能である。

10

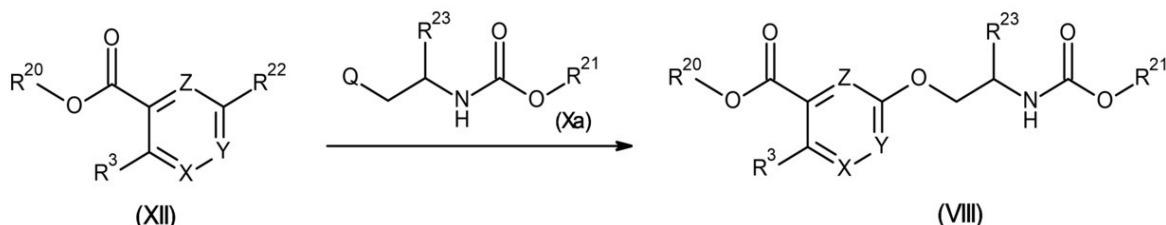
【 0 1 2 3 】

代わりに、式 (VIII) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{20} 及び R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (Xa) の化合物 (式中、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び Q は、ヒドロキシである) による式 (XII) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^{22} は、ハロゲンであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 7 に示されている。

20

スキーム 7

【 化 2 4 】



30

【 0 1 2 4 】

スキーム 7 に示すとおり、化合物 (XII) は、当業者に公知の方法、例えば Tetrahedron 1988, 91; J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592、国際公開第 2020211836 号に記載の方法により、化合物 (VIII) に転換され得る。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適当なリガンドは、国際公開第 2017147700 号及び J. Med. Chem. 2021, 11570 に示されているとおり、反応を促進するために使用可能である。

【 0 1 2 5 】

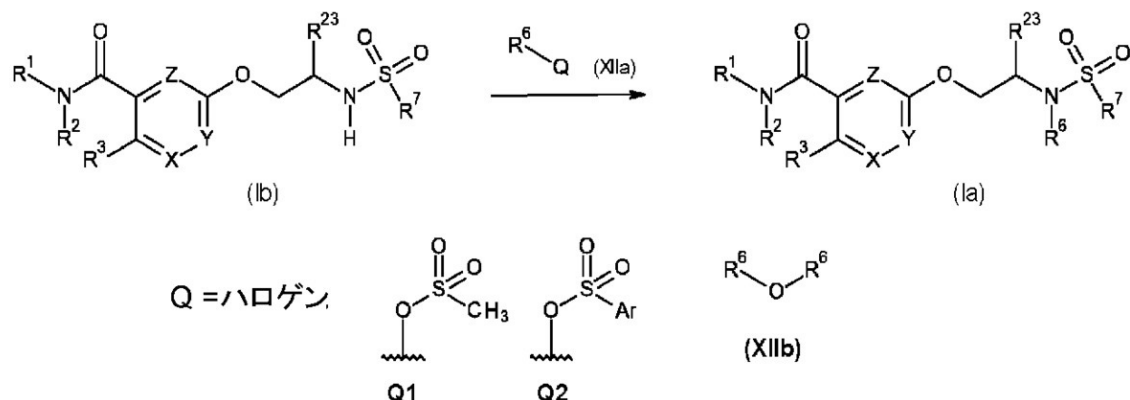
式 (Ia) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^6 、 R^7 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (XIIa) の化合物 (式中、 R^6 は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び Q は、ハロゲン又はスルホネートである) による式 (Ib) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 8 に示されている。

40

スキーム 8

50

【化 2 5】



10

【0126】

スキーム 8 に示すとおり、化合物 (Ib) は、当業者に公知の方法、例えば ACS Combinatorial Science 2016, 569; 国際公開第 202115372 号に記載の方法により、化合物 (Ia) に転換され得る。例えば、この反応は、ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド又はアセトニトリルなどの有機溶剤中において炭酸カリウム又はトリエチルアミンなどの塩基の存在下で行うことが可能である。

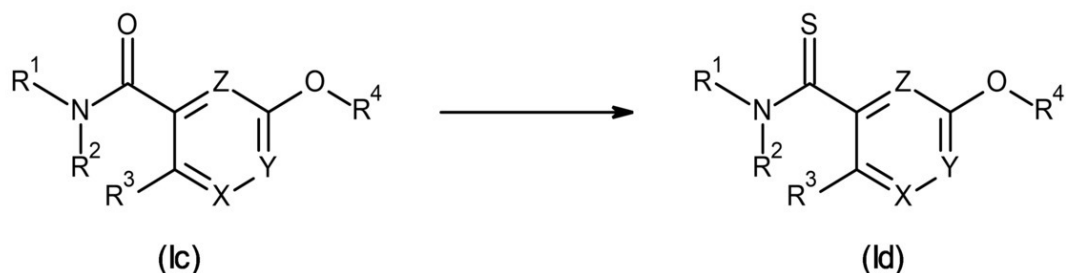
20

【0127】

式 (Id) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりである) は、式 (Ic) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 9 に示されている。

スキーム 9

【化 2 6】



30

【0128】

スキーム 9 に示すとおり、化合物 (Ic) は、当業者に公知の方法、例えば Org. Lett. 2019, 5848; Tetrahedron Lett. 2008, 4579; 国際公開第 2021153720 号に記載の方法により、化合物 (Id) に転換され得る。例えば、この反応は、トルエン又はクロロベンゼンなどの有機溶剤中において 2, 4 - ビス (4 - メトキシフェニル) - 1, 3, 2, 4 - ジチアジホスフェタン - 2, 4 - ジチオン (ローソン試薬) などのチオ化試薬の存在下で行うことが可能である。

40

【0129】

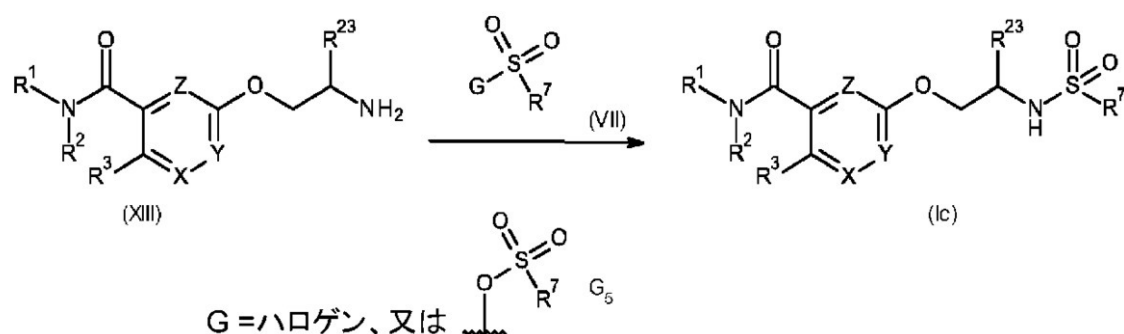
代わりに、本発明に係る式 (Ic) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^7 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (VII) のスルホニル化剤 (式中、 R^7 は、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ シクロアルキル又は $C_1 \sim C_6$ ハロシクロアルキルであり、及び G は、ハロゲン又は式 G5 の活性化基である) の存在下における、式 (XIII) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) の変換によって得ることができる。これは

50

、以下のスキーム 9 に示されている。これは、以下のスキーム 10 に示されている。

スキーム 10

【化 27】



10

【0130】

スキーム 10 に示すとおり、化合物 (XIII) は、当業者に公知の方法、例えば Angew. Chem. Int. Ed. 2016, 5299; J. Am. Chem. Soc. 2018, 5322; 国際公開第 2021153720 号、国際公開第 2010150192 号に記載の方法により、化合物 (Ic) に転換され得る。例えば、この反応は、ジクロロメタン、ジオキサン又は THF などの不活性有機溶剤中においてトリエチルアミン、

20

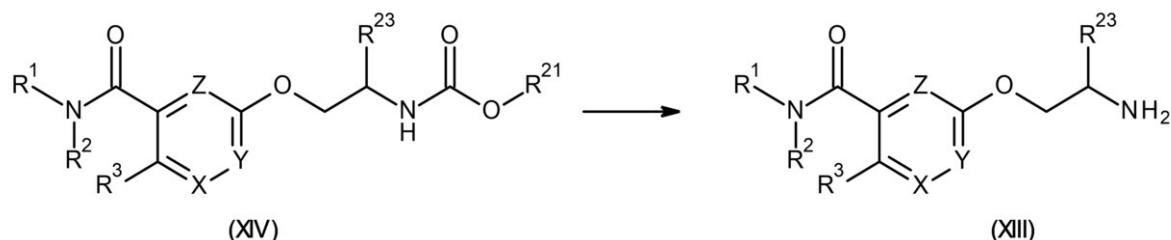
【0131】

式 (XIII) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (XIV) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 11 に示されている。

30

スキーム 11

【化 28】



40

【0132】

スキーム 11 に示すとおり、化合物 (XIV) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2002059117 号、J. Med. Chem. 2003, 5238、Org. Lett. 2022, 2064 に記載の方法により、化合物 (XIII) に転換され得る。例えば、この反応は、ジクロロメタン、ジオキサン又は THF などの有機溶剤中において塩酸、トリフルオロ酢酸又はパラトルエンスルホン酸などの有機又は無機酸の存在下で行うことが可能である。化合物 (XIII) は、その塩形態 (例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、トリフルオロ酢酸塩、パラトルエンスルホン酸塩) における以下の変換で得て使用することもできる。

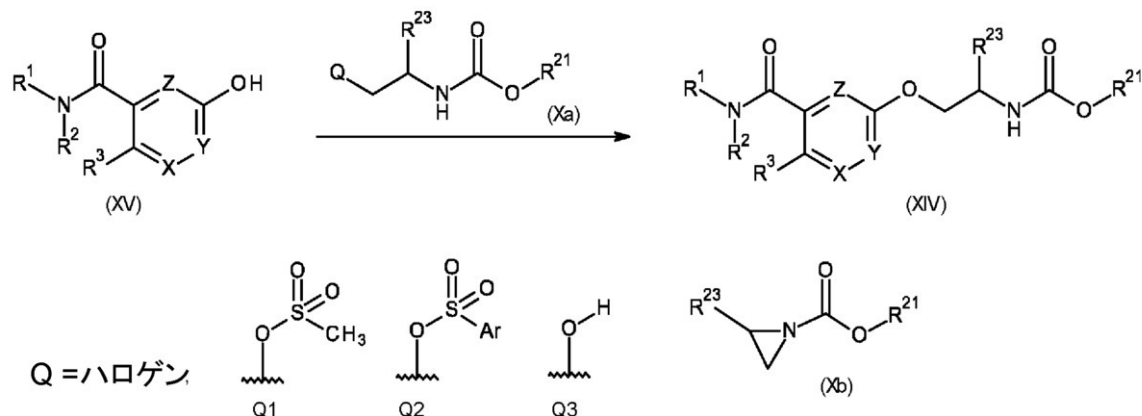
【0133】

50

式 (XIV) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{23} は、水素又はメチルであり、及び R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである) は、式 (Xa) のアルキル化剤 (式中、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^{23} は、水素又はメチルであり、及び Q は、ハロゲン、スルホネート基のヒドロキシルである) による式 (XV) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 12 に示されている。

スキーム 12

【化 29】



10

20

【0134】

スキーム 12 に示すとおり、化合物 (XV) は、当業者に公知の方法、例えば *Angew. Chem. Int. Ed.* 2017, 12518; 国際公開第 2012101244 号、国際公開第 2004050619 号、国際公開第 2007072041 号に記載の方法により、Xa (Q がすなわちハロゲン又はスルホネート $Q1$ 又は $Q2$ である場合) によるアルカリ化反応によって化合物 (XIV) に転換され得る。例えば、この反応は、ジメチルホルムアミド、アセトン又はアセトニトリルなどの有機溶剤中において炭酸セシウム、水素化ナトリウム又は炭酸ナトリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (XV) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2012074126 号; *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 1992, 481、*Beilstein J. Org. Chem.* 2006, 2, 21 に記載の方法により、Xa (Q が OH に等しい場合) による光延反応によって転換され得る。例えば、この反応は、トルエン又は THF などの有機溶剤中においてアザジカルボン酸ジエチル又はアザジカルボン酸ジイソプロピルなどのアザジカルボン酸試薬及びトリフェニルホスフィンなどのホスフィン試薬の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (XV) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2007070201 号に記載の方法により、アジリジン Xb とのアルキル化反応によって化合物 (XIV) に転換され得る。例えば、この反応は、アセトニトリルなどの有機溶剤中において炭酸カリウム、水素化ナトリウム又は炭酸ナトリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。

30

40

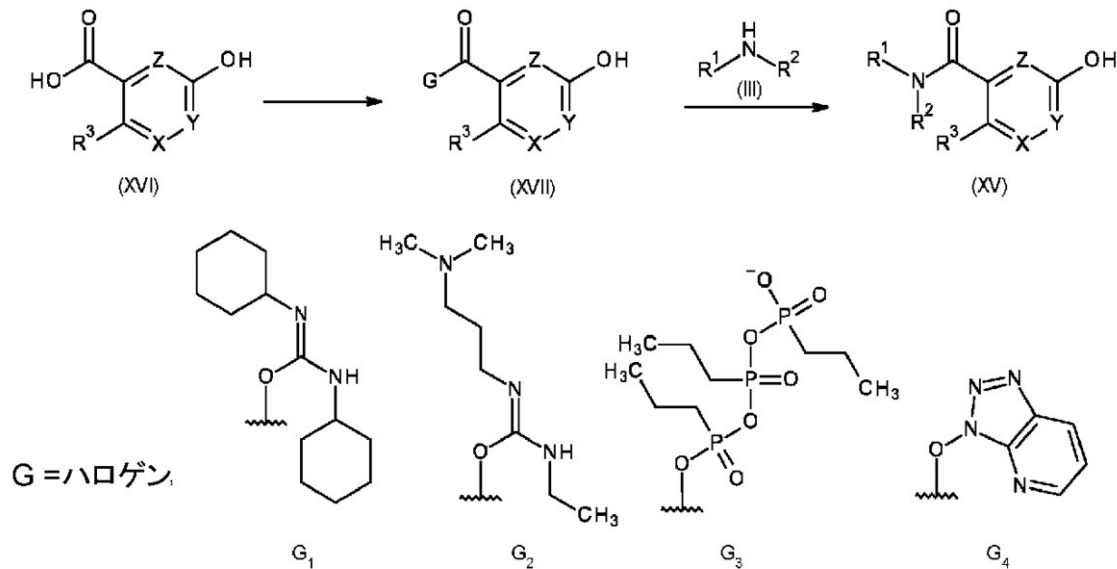
【0135】

本発明に係る式 (XV) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりである) は、以下に記載のとおり、中間体酸塩化物又は活性化アシル化剤を介した式 (III) の化合物 (式中、 R^1 及び R^2 は、式 (I) について定義されているとおりである) による、式 (XVI) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 13 に示されている。

スキーム 13

50

【化 3 0】



10

【 0 1 3 6】

スキーム 13 に示すとおり、化合物 X V I は、当業者に公知の方法、例えば Tetrahedron 2005, 61 (46), 10827-10852 に記載の方法により、式 X V I I の化合物に活性化される。例えば、式 X V I I の化合物（式中、G は、ハロゲンである）は、ジクロロメタン又は T H F などの不活性溶剤中の触媒量の D M F の存在下、25 ~ 170、好ましくは 25 ~ 80 の温度における、例えば塩化オキサリル又は塩化チオニルによる式 X V I の化合物の処理により形成される。任意に、例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下における式 I I I の化合物（式中、R¹及び R²は、式 I で定義されているとおりである）による X V I I の処理は、式 I の化合物をもたらす。代わりに、式 X V の化合物は、例えばピリジン又は T H F といった不活性溶剤中、任意に例えばトリエチルアミンといった塩基の存在下、rt ~ 180 の温度における、活性種 X V I I（式中、G は G₁又は G₂である）をもたらすジシクロヘキシルカルボジイミド（D C C）又は 1 - エチル - 3 - （3 - ジメチルアミノプロピル）カルボジイミド（E D C）による式 X V I I の化合物の処理によって調製可能である。加えて、例えば Synthesis 2013, 45, 1569 及び J. Prakt. Chemie 1998, 340, 581 に記載されているとおり、式 X V I の酸をプロパンホスホン酸無水物（T 3 P（登録商標））又は O - （7 - アザ - 1 - ベンゾトリアゾリル） - N, N, N', N' - テトラメチルウロニウム - ヘキサフルオロホスフェート（H A T U）などのカップリング試薬による反応によって活性化して、式 X V I I の化合物（式中、G は G₃及び G₄である）をもたらすことが可能である。式 I I I のアミンとのその後の反応により、式 X V の化合物が得られる。

20

30

【 0 1 3 7】

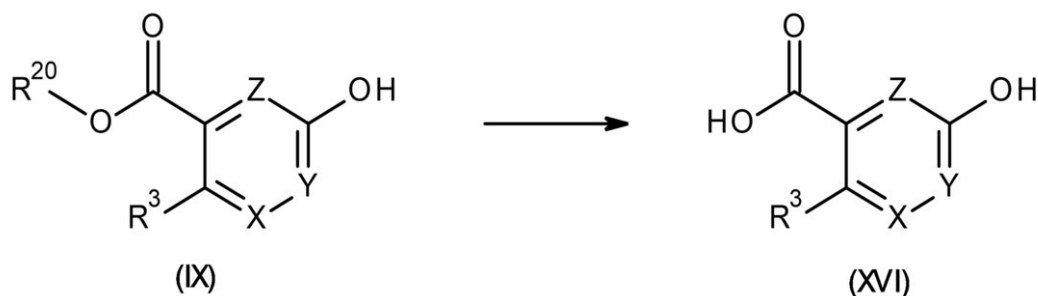
式（X V I）の化合物（式中、R³、X、Y 及び Z は、式（I）について定義されているとおりである）は、塩基又は酸の存在下における、式（I X）の化合物（式中、R³、X、Y、Z は、式（I）について定義されているとおりであり、及び R²⁰は、C₁ ~ C₆ アルキルである）の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 14 に示されている。

40

スキーム 14

50

【化 3 1】



10

【0138】

スキーム 14 に示すとおり、化合物 (IX) は、塩基性条件下における加水分解反応を経て、当業者に公知の方法、例えば ACS Chemical Neuroscience 2017, 2374 に記載の方法により、化合物 (XVI) に変換可能である。例えば、この反応は、水中、又はメタノール、THF 若しくはジクロロメタンなどの有機溶剤中、又は混合物中において水酸化リチウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (IX) の化合物 (XVI) への転換は、当業者に公知の方法、例えば J. Med. Chem. 1986, 2363 に記載の方法により、酸性条件で行うことが可能である。例えば、この反応は、水中又は水とメタノール、THF 若しくはジオキサンなどの有機溶剤との混合物中においてトリフルオロ酢酸、塩酸又は硫酸などの酸の存在下で行うことが可能である。

20

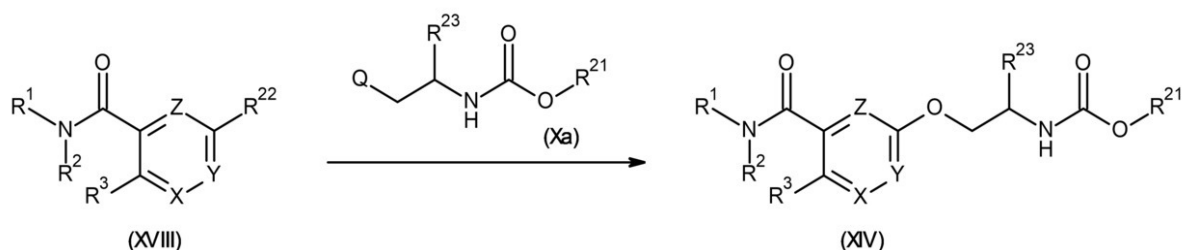
【0139】

代わりに、式 (XIV) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (Xa) の化合物 (式中、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^{23} は、水素又はメチルであり、及び Q は、ヒドロキシである) による、式 (XVII) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 15 に示されている。

スキーム 15

30

【化 3 2】



【0140】

40

スキーム 15 に示すとおり、化合物 (XVII) は、当業者に公知の方法、例えば Tetrahedron 1988, 91; J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592、国際公開第 2020211836 号に記載の方法により、化合物 (XIV) に転換され得る。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において水酸化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適切なりガンドは、国際公開第 2017147700 号及び J. Med. Chem. 2021, 11570 に示されているとおり、反応を促進するために使用可能である。

【0141】

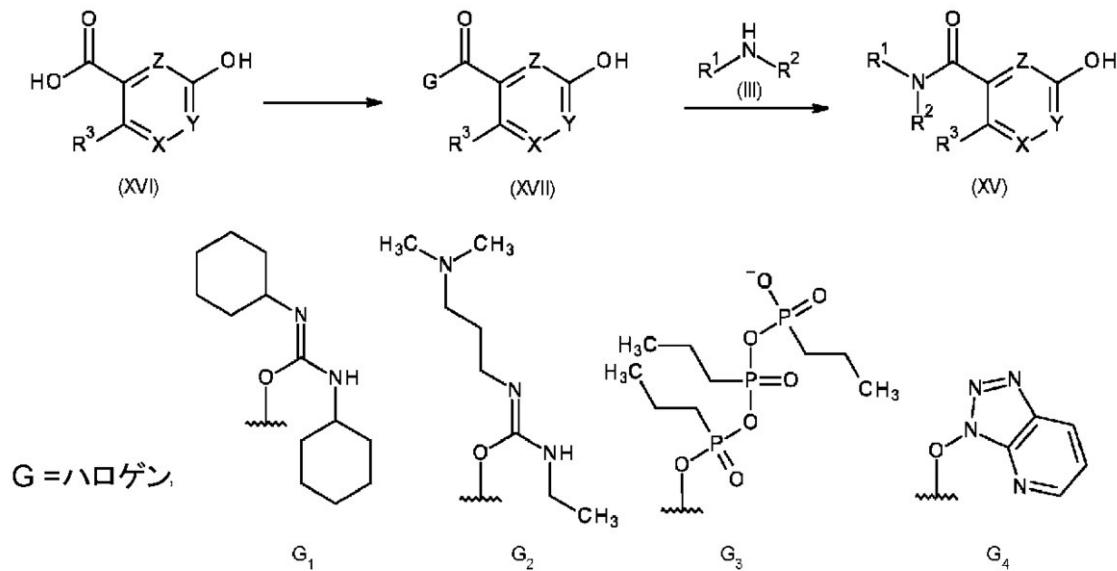
本発明に係る式 (XVII) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (

50

I) について定義されているとおりであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) は、以下に記載のとおり、中間体酸塩化物又は活性化アシル化剤を介した式 (III) の化合物 (式中、 R^1 及び R^2 は、式 (I) について定義されているとおりである) による式 (XIX) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 16 に示されている。

スキーム 16

【化 33】



10

20

【0142】

スキーム 16 に示すとおり、化合物 XIX は、当業者に公知の方法、例えば Tetrahedron 2005, 61 (46), 10827-10852 に記載の方法により、式 XX の化合物に活性化される。例えば、式 XX の化合物 (式中、 G は、ハロゲンである) は、ジクロロメタン又は THF などの不活性溶剤中の触媒量の DMF の存在下、25 ~ 170、好ましくは 25 ~ 80 の温度における、例えば塩化オキサリル又は塩化チオニルによる式 II の化合物処理により形成される。任意に、例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下における式 III の化合物 (式中、 R^1 及び R^2 は、式 I で定義されているとおりである) による XX の処理は、式 I の化合物をもたらす。代わりに、式 XVII の化合物は、例えばピリジン又は THF といった不活性溶剤中、任意に例えばトリエチルアミンといった塩基の存在下、rt ~ 180 の温度における、活性種 IV (式中、 G は、 G_1 又は G_2 である) をもたらすジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC) 又は 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド (EDC) による式 XIX の化合物の処理により調製可能である。加えて、例えば Synthesis 2013, 45, 1569 及び J. Prakt. Chemie 1998, 340, 581 に記載されているとおり、式 XIX の酸をプロパンホスホン酸無水物 (T3P (登録商標)) 又は O-(7-アザ-1-ベンゾトリアゾリル)-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 (HATU) などのカップリング試薬による反応によって活性化して、式 XX の化合物 (式中、 G は G_3 及び G_4 である) をもたらすことが可能である。式 III のアミンとのその後の反応により、式 XVII の化合物が得られる。

30

40

【0143】

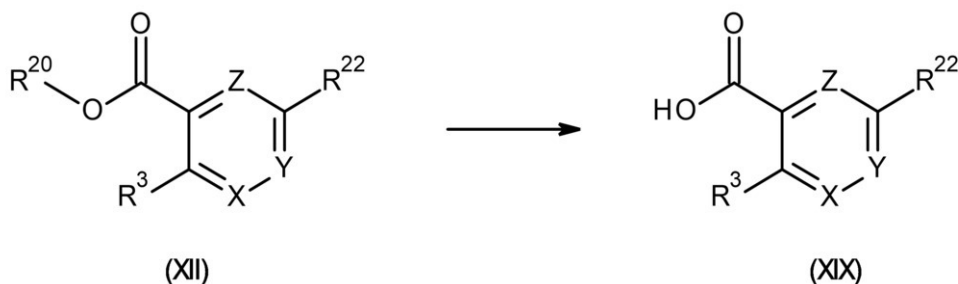
式 (XIX) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 及び Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) は、塩基又は酸の存在下における、式 (III) の化合物 (式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式 (I) について定義されていると

50

りであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 17 に示されている。

スキーム 17

【化 3 4】



10

【0144】

スキーム 17 に示すとおり、化合物 (XII) は、塩基性条件下における加水分解反応を経て、当業者に公知の方法、例えば ACS Chem. Neurosci. 2017, 2374 に記載の方法により、化合物 (XIX) に変換可能である。例えば、この反応は、水中、又はメタノール、THF 若しくはジクロロメタンなどの有機溶剤中、又は混合物中において水酸化リチウム、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (XII) の化合物 (XIX) への転換は、当業者に公知の方法、例えば J. Med. Chem. 1986, 2363 に記載の方法により、酸性条件で行うことが可能である。例えば、この反応は、水中又は水とメタノール、THF 若しくはジオキサンなどの有機溶剤との混合物中においてトリフルオロ酢酸、塩酸又は硫酸などの酸の存在下で行うことが可能である。

20

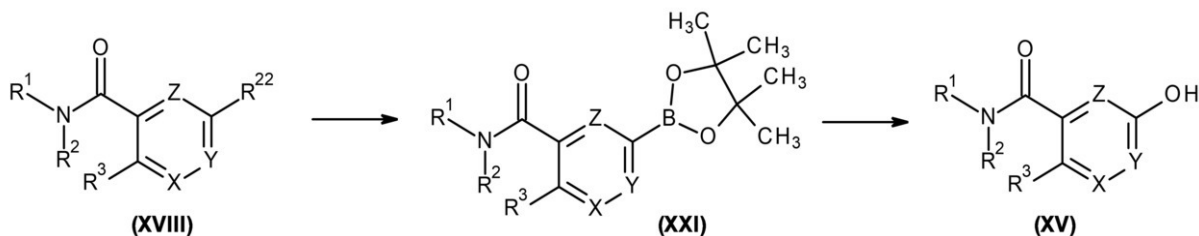
【0145】

式 (XV) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりである) は、式 (XXI) の中間体化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルである) を介した、式 (XVIII) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) の変換により 2 ステップで得ることができる。これは、以下のスキーム 18 に示されている。

30

スキーム 18

【化 3 5】



40

【0146】

スキーム 18 に示すとおり、化合物 (XVIII) は、宮浦ホウ素化反応の名称を有する当業者に公知の方法及び例えば国際公開第 2021076728 号; J. Med. Chem. 2022, 65, 15433 に記載の方法により、化合物 (XXI) に転換され得る。例えば、この反応は、THF 又はジオキサンなどの有機溶剤中、炭酸カリウム又は酢酸カリウムなどの塩基の存在下及び 1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセンジクロロパラジウムなどの適当なリガンドとの組み合わせたパラジウム触媒の存在下で行うことが可能である。中間体 (XXI) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2021127071 号、Tetrahedron Lett. 2014, 2082; Tet

50

rahedron Lett. 2017, 3323; Tetrahedron 2005, 1417に記載の方法により、式(XV)の化合物に転換され得る。例えば、この反応は、水とエタノール、アセトニトリル又はジクロロメタンなどの有機溶剤との混合物中において過酸化水素の存在下で行うことが可能である。

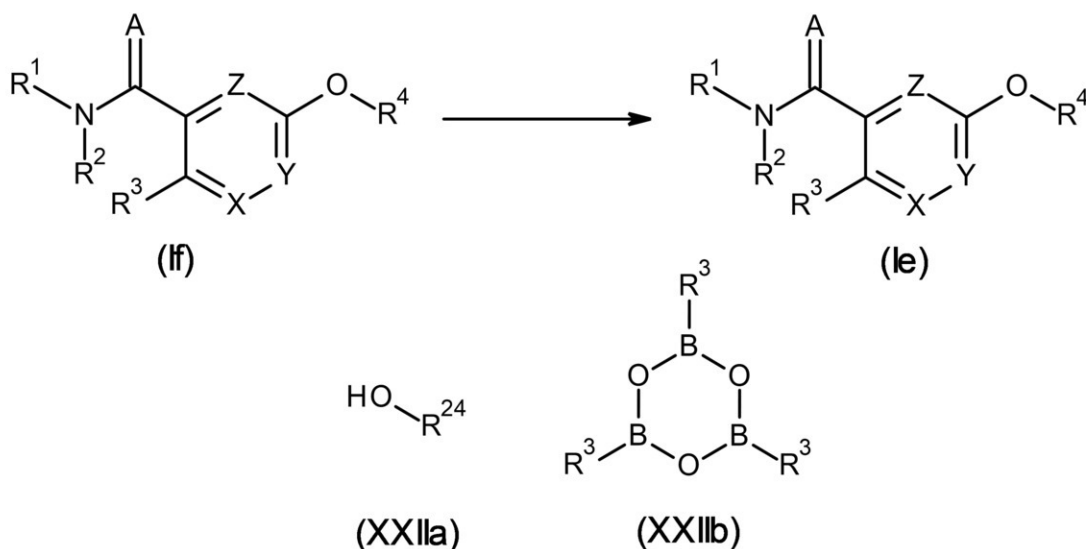
【0147】

式(Ie)の化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 、X、Y、Zは、式(I)について定義されているとおりであり、Aは、酸素であり、及び R^3 は、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシである)は、式(I f)の化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^4 、X、Y、Zは、式(I)について定義されているとおりであり、Aは、酸素であり、及び R^3 は、ハロゲンである)の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム19に示されている。

10

スキーム19

【化36】



20

【0148】

スキーム19に示すとおり、化合物(I f)は、当業者に公知の方法、例えばJ. Med. Chem. 2021、J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592に記載の方法により、式(XXIIa)の化合物(式中、 R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルである)と反応させて化合物(I e)(式中、 R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシである)を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適切なりガンドを用いて反応を促進させることが可能である。代わりに、化合物(I f)は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第2021156787号、国際公開第2020210828号、Tetrahedron Lett. 2000, 41, 6237に記載の方法により、式(XXIIb)の化合物(式中、 R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルである)と反応させて化合物(I e)を得ることができる。例えば、この反応は、当業者に公知の方法、例えばAdv. Synth. Cat. 2017, 359, 2345、米国特許第20090062541号明細書、Synthesis 2008, 20, 3351に記載の方法により、ジオキサン、THF、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下及び[1,1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウムなどの適切なりガンドを伴うパラジウム触媒の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物(I f)は、フェリシアン化カリウム、シアン化ナトリウム、シアン化カリウム又はシア

30

40

50

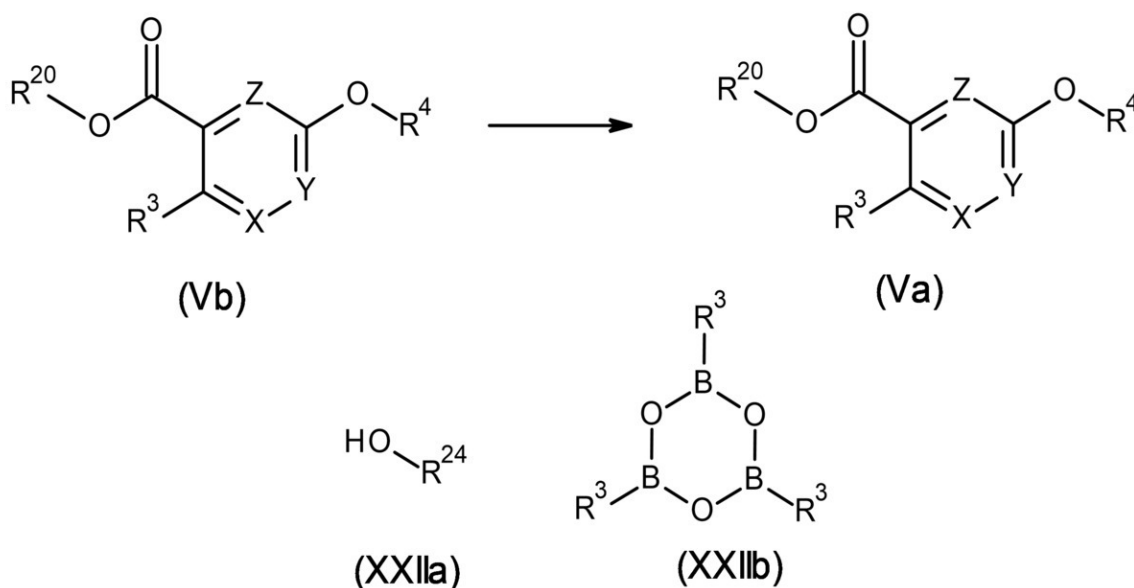
ン化亜鉛などのシアン化物塩と反応させて、化合物 (I e) (式中、 R^3 はシアノである) と反応させることが可能である。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、メチル-THF、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド又はトルエンなどの有機溶剤中においてヨウ化銅、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム、酢酸第二銅、キサントホス Pd G 3 などの有機金属触媒の存在下、任意にブチルイミダゾール、N, N'-ジメチルエチレンジアミン、1-メチルイミダゾール、1, 10-フェナントロリンなどのリガンドの存在下；任意に炭酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意にポリエチレングリコールドデシルエーテル及びポリメチルヒドロシロキサンなどの添加剤の存在下で行うことが可能である。

【0149】

式 (Va) の化合物 (式中、 R^4 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^3 は、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシである) は、式 (Vb) の化合物 (式中、 R^4 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{20} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^3 は、ハロゲンである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 20 に示されている。

スキーム 20

【化 37】



【0150】

スキーム 20 に示すとおり、化合物 (Vb) は、当業者に公知の方法、例えば J. Med. Chem. 2021、J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592 に記載の方法により、式 (XXIIa) の化合物 (式中、 R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルである) と反応させて化合物 (Va) (式中、 R^3 は $C_1 \sim C_6$ -アルコキシ及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルコキシである) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適当なリガンドを用いて反応を促進させることが可能である。代わりに、化合物 (Vb) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2021156787 号、国際公開第 2020210828 号、Tetrahedron Letters 2000, 41, 6237 に記載の方法により、式 (XXIIb) の化合物 (式中、 R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルである) と反応させて化合物 (Va) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中

において炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下及び[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウムなどの適切なリガンドを伴うパラジウム触媒の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物(Vb)は、当業者に公知の方法、例えばAdv. Synth. Cat. 2017, 359, 2345、米国特許第20090062541号明細書、Synthesis (2008), (20), 3351に記載の方法により、フェリシアン化カリウム、シアン化ナトリウム、シアン化カリウム又はシアン化亜鉛などのシアン化物塩と反応させて、化合物(Va)(式中、R³はシアノである)を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、メチル-THF、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド又はトルエンなどの有機溶剤中においてヨウ化銅、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム、酢酸第二銅、キサントホスPd G3などの有機金属触媒の存在下、任意にブチルイミダゾール、N, N'-ジメチルエチレンジアミン、1-メチルイミダゾール、1, 10-フェナントリンなどのリガンドの存在下、任意に炭酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意にポリエチレングリコールドデシルエーテル及びポリメチルヒドロシロキサンなどの添加剤の存在下で行うことが可能である。

10

20

30

40

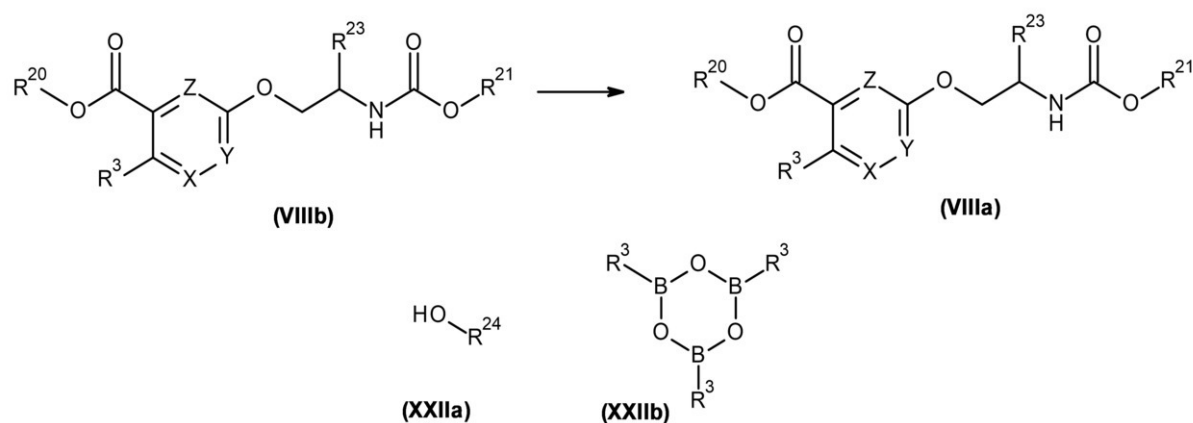
50

【0151】

式(VIIa)の化合物(式中、X、Y、Zは、式(I)について定義されており、R²⁰は、C₁~C₆アルキルであり、R²¹は、C₁~C₆アルキルであり、R²³は、水素又はメチルであり、及びR³は、シアノ、C₁~C₆-アルキル、C₁~C₆-アルコキシ、C₃~C₆-シクロアルキル、C₁~C₆-ハロアルコキシである)は、式(VIIb)の化合物(式中、X、Y、Zは、式(I)について定義されており、R²⁰は、C₁~C₆アルキルであり、R²¹は、C₁~C₆アルキルであり、R²³は、水素又はメチルであり、及びR³は、ハロゲンである)の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム21に示されている。

スキーム21

【化38】



【0152】

スキーム21に示すとおり、化合物(VIIb)は、当業者に公知の方法、例えばJ. Med. Chem. 2021, J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592に記載の方法により、式(XXIIa)の化合物(式中、R²⁴は、C₁~C₆-アルキル、C₃~C₆-シクロアルキル及びC₁~C₆-ハロアルキルである)と反応させて化合物(VIIa)(式中、R³はC₁~C₆-アルコキシ及びC₁~C₆-ハロアルコキシである)を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適切なリガンドを用いて反応を促進させることが可能である。代わりに、化合物(VIIb)は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第2021156787号、国際公開第2020210828号、Tetrahedron Lett. 2000, 41, 6237に記載の方法により、

式 (X X I I b) の化合物 (式中、 R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルである) と反応させて化合物 (V I I I a) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下及び [1, 1' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウムなどの適切なリガンドを伴うパラジウム触媒の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (V I I I b) は、当業者に公知の方法、例えば Adv. Synth. Cat. 2017, 359, 2345、米国特許第 20090062541 号明細書、Synthesis 2008, (20), 3351 に記載の方法により、フェリシアン化カリウム、シアン化ナトリウム、シアン化カリウム又はシアン化亜鉛などのシアン化物塩と反応させて、化合物 (V I I I a) (式中、 R^3 はシアノである) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、メチル - THF、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド又はトルエンなどの有機溶剤中においてヨウ化銅、[1, 1' - ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセン] ジクロロパラジウム、酢酸第二銅、キサントホス Pd G3 などの有機金属触媒の存在下、任意にブチルイミダゾール、N, N' - ジメチルエチレンジアミン、1 - メチルイミダゾール、1, 10 - フェナントリンなどのリガンドの存在下、任意に炭酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意にポリエチレングリコールドデシルエーテル及びポリメチルヒドロシロキサンなどの添加剤の存在下で行うことが可能である。

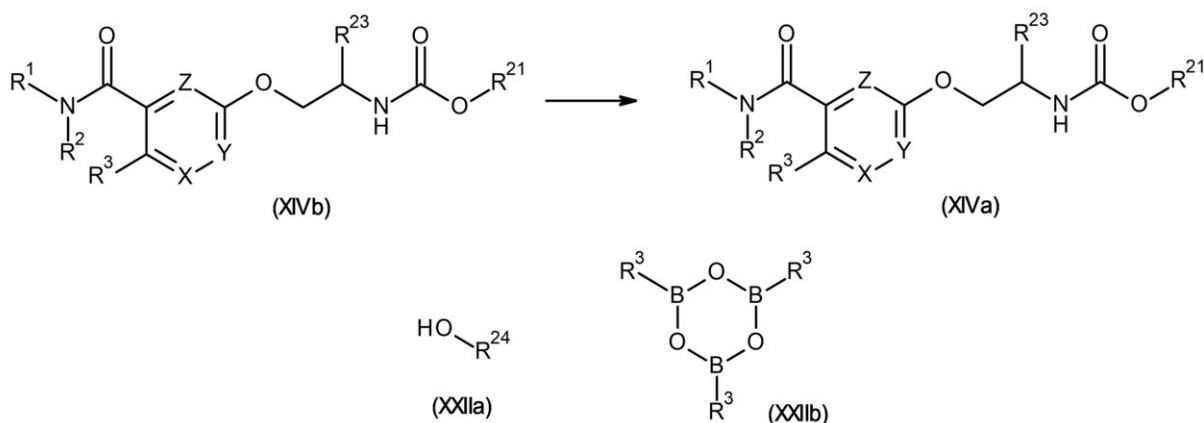
10

20

【0153】

式 (X I V a) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^{23} は、水素又はメチルであり、及び R^3 は、シアノ、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル、 $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシである) は、式 (X I V b) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^{23} は、水素又はメチルであり、及び R^3 は、ハロゲンである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 22 に示されている。

30



40

【0154】

スキーム 21 に示すとおり、化合物 (X I V b) は、当業者に公知の方法、例えば J. Med. Chem. 2021, J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592 に記載の方法により、式 (X X I I a) の化合物 (式中、 R^{24} は、 $C_1 \sim C_6$ - アルキル、 $C_3 \sim C_6$ - シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ - ハロアルキルである) と反応させて化合物 (X I V a) (式中、 R^3 は $C_1 \sim C_6$ - アルコキシ及び $C_1 \sim C_6$ - ハロアルコキシである) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適切なリガンドを用いて反応を

50

促進させることが可能である。代わりに、化合物 (XIVb) は、当業者に公知の方法、例えば国際公開第 2021156787 号、国際公開第 2020210828 号、Tetrahedron Lett. 2000, 41, 6237 に記載の方法により、式 (XXIb) の化合物 (式中、 R^3 は、 $C_1 \sim C_6$ -アルキル、 $C_3 \sim C_6$ -シクロアルキル及び $C_1 \sim C_6$ -ハロアルキルである) と反応させて、化合物 (XIVa) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、ジメチルホルムアミド又はトルエンなどの有機溶剤中において炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下及び [1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウムなどの適切なりガンドを伴うパラジウム触媒の存在下で行うことが可能である。代わりに、化合物 (XIVb) は、当業者に公知の方法、例えば Adv. Synth. Cat. 2017, 359, 2345、米国特許第 20090062541 号明細書、Synthesis 2008, (20), 3351 に記載の方法により、フェリシアン化カリウム、シアン化ナトリウム、シアン化カリウム又はシアン化亜鉛などのシアン化物塩と反応させて、化合物 (XIVa) (式中、 R^3 はシアノである) を得ることができる。例えば、この反応は、ジオキサン、THF、メチル-THF、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド又はトルエンなどの有機溶剤中においてヨウ化銅、[1, 1'-ビス(ジフェニルホスフィノ)フェロセン]ジクロロパラジウム、酢酸第二銅、キサントホス Pd G3 などの有機金属触媒の存在下、任意にブチルイミダゾール、N, N'-ジメチルエチレンジアミン、1-メチルイミダゾール、1, 10-フェナントリンなどのリガンドの存在下、任意に炭酸カリウム、炭酸ナトリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意にポリエチレングリコールデシルエーテル及びポリメチルヒドロシロキサンなどの添加剤の存在下で行うことが可能である。

10

20

30

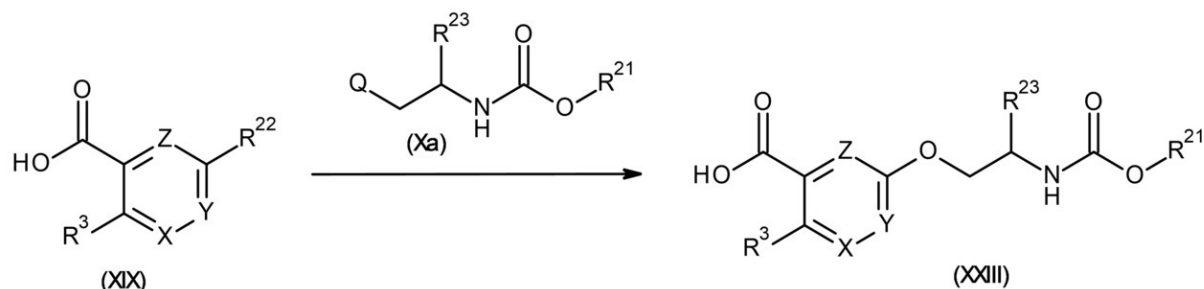
40

【0155】

式 (XXIII) の化合物 (式中、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである) は、式 (Xa) の化合物 (式中、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、 R^{23} は、水素又はメチルであり、及び Q は、ヒドロキシである) による式 (XIX) の化合物 (式中、 R^3 、X、Y、Z は、式 (I) について定義されているとおりであり、及び R^{22} は、ハロゲンである) の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム 23 に示されている。

スキーム 23

【化 40】



【0156】

スキーム 23 に示すとおり、化合物 (XIX) は、当業者に公知の方法、例えば Tetrahedron 1988, 91; J. Am. Chem. Soc. 2010, 11592、国際公開第 2020211836 号に記載の方法により、化合物 (XXIII) に転換され得る。例えば、この反応は、ジオキサン、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド又はトルエンなどの有機溶剤中において水素化ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、カリウム tert-ブトキシド、水酸化ナトリウム、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウムなどの塩基の存在下で行うことが可能である。パラジウム触媒及び適切なりガンドは、国際公開第 2017147700 号及び J. Med. Chem. 2021, 1

50

1570に示されているとおり、反応を促進するために使用可能である。

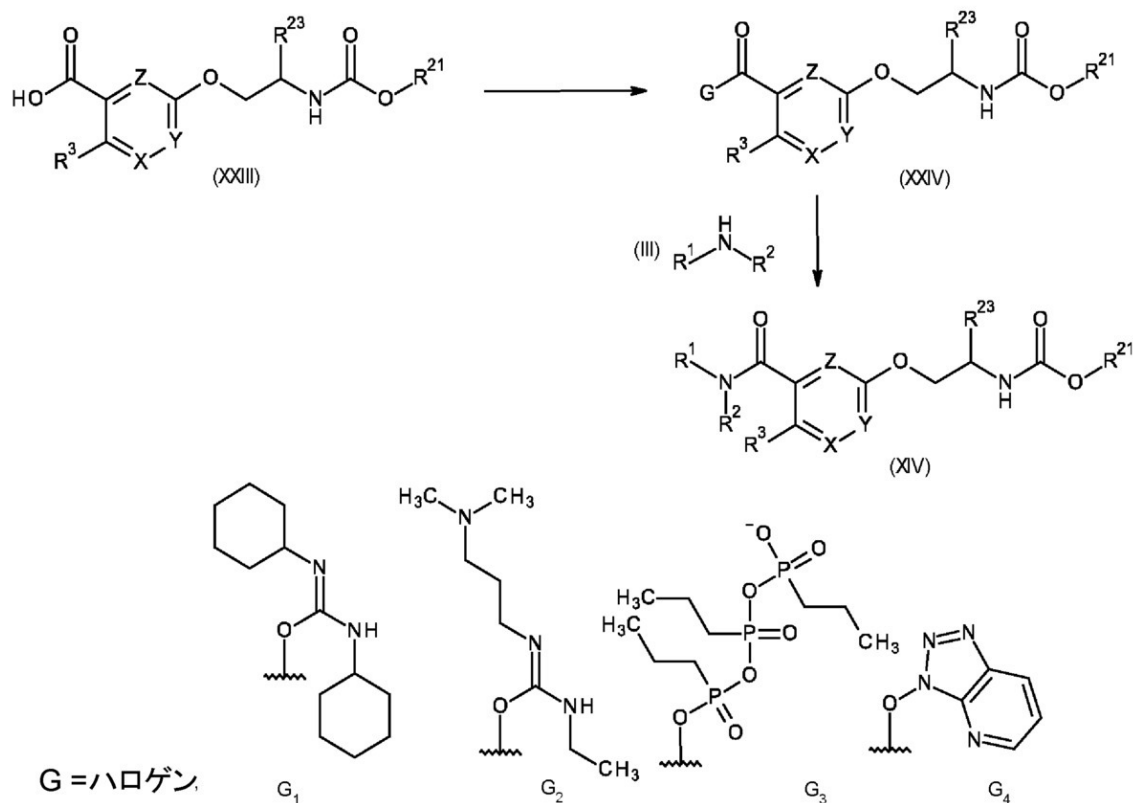
【0157】

代わりに、式(XIV)の化合物(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式(I)について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである)は、以下に記載のとおり、中間体酸塩化物又は活性化アシル化剤を介した、式(III)の化合物(式中、 R^1 及び R^2 は、式(I)について定義されているとおりである)による式(XXIII)の化合物(式中、 R^3 、 X 、 Y 、 Z は、式(I)について定義されているとおりであり、 R^{21} は、 $C_1 \sim C_6$ アルキルであり、及び R^{23} は、水素又はメチルである)の変換によって得ることができる。これは、以下のスキーム24に示されている。

10

スキーム24

【化41】



20

30

【0158】

スキーム24に示すとおり、化合物(XXIII)は、当業者に公知の方法、例えばTetrahedron 2005, 61(46), 10827-10852に記載の方法により、式(XXIV)の化合物に活性化される。例えば、式(XXIV)の化合物(式中、 G は、ハロゲンである)は、ジクロロメタン又はTHFなどの不活性溶剤中の触媒量のDMFの存在下、25~170、好ましくは25~80の温度における、例えば塩化オキサリル又は塩化チオニルによる式(XXIII)の化合物の処理により形成される。任意に、例えばトリエチルアミン又はピリジンといった塩基の存在下における式(XXIII)の化合物(式中、 R^1 及び R^2 は、式Iで定義されているとおりである)による(XXIV)の処理は、式(XXIV)の化合物をもたらす。代わりに、式(XXIV)の化合物は、例えばピリジン又はTHFといった不活性溶剤中、任意に例えばトリエチルアミンといった塩基の存在下、rt~180の温度における、活性種XXIV(式中、 G は G_1 又は G_2 である)をもたらすジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)又は1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド(EDC)による式(XXIII)の化合物の処理により調製可能である。加えて、例えばSynthesis 2013, 45, 15

40

50

69及びJ. Prakt. Chem. 1998, 340, 581に記載されているとおり、式X X I I Iの酸をプロパンホスホン酸無水物(T3P(登録商標))又はO-(7-アザ-1-ベンゾトリアゾリル)-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(HATU)などのカップリング試薬による反応によって活性化して、式X X I Vの化合物(式中、GはG₃及びG₄である)をもたらすことが可能である。式I I Iのアミンとのその後の反応により、式X I Vの化合物が得られる。

【0159】

手法又は反応条件に応じて、反応体を塩基の存在下で反応させることが可能である。好適な塩基の例は、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属又はアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属又はアルカリ土類金属ジアルキルアミド又はアルカリ金属又はアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離又はN-アルキル化飽和又は不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウム及び炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシルアミン、N-シクロヘキシル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム及び1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

【0160】

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

【0161】

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

【0162】

各事例で好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応ステップにおいて、1つの置換基を本発明に係る他の置換基で単に置換することが可能であるか、又は同じ反応ステップにおいて、複数の置換基を本発明に係る他の置換基で置換することが可能である。

【0163】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製可能である。従って、例えば、式Iの化合物の酸付加塩は、好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、及び塩基による塩は、好適な塩基又は好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。

【0164】

式Iの化合物の塩は、慣例的な方法において、例えば好適な塩基性化合物又は好適なイオン交換試薬による処理によって遊離化合物Iの酸付加塩に、且つ例えば好適な酸又は好適なイオン交換試薬による処理によって塩基による塩に転換され得る。

【0165】

式Iの化合物の塩は、形成される例えば塩化銀といった無機塩が不溶性であり、従って、反応混合物から沈殿する好適な溶剤中における、例えば酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀による塩酸塩などの無機酸の塩の処理により、式Iの化合物の他の塩、酸付加塩、例えば他の酸付加塩にそれ自体公知の方法で転換さ

れ得る。

【0166】

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

【0167】

式 I の化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態若しくは塩形態では、分子中に現れる不斉炭素原子の数、絶対及び相対配置に応じて、且つ / 又は分子中に現れる非芳香族二重結合の配置に応じて、例えば対掌体及び / 若しくはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態において又は鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物若しくはラセミ体混合物などの異性体混合物として、可能な異性体の 1 つの形態において又はこれらの混合物として存在し得、本発明は、純粋な異性体に関し、可能なすべての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記及び下記においてこの意味でそれぞれ理解されるべきである。

10

【0168】

式 I の化合物のジアステレオマー混合物又はラセミ混合物は、いずれの出発材料及び手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態又は塩形態では、例えば分別結晶化、蒸留及び / 又はクロマトグラフィーにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

【0169】

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

20

【0170】

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

30

【0171】

N - オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で式 I の化合物を好適な酸化剤、例えば H_2O_2 / 尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem., 32 (12), 2561 - 73, 1989 又は国際公開第 2000 / 15615 号といった文献から公知である。

【0172】

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

40

【0173】

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

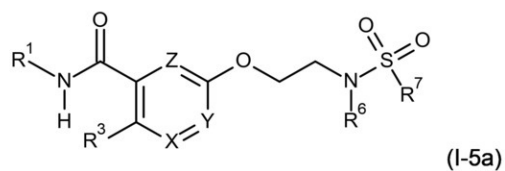
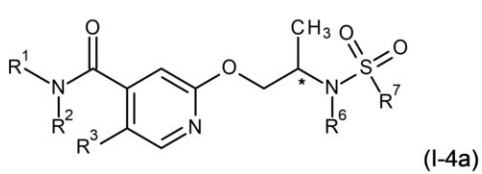
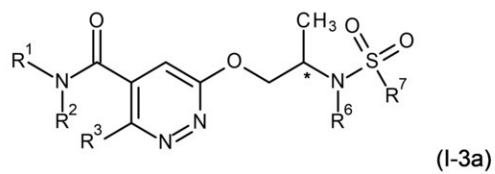
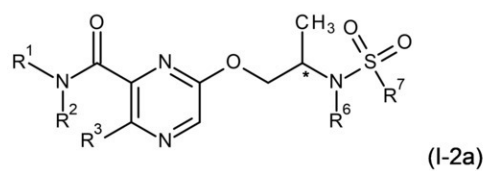
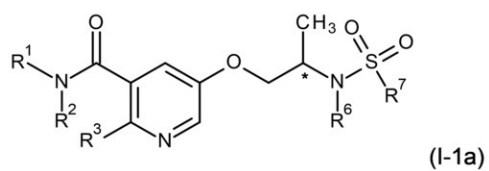
【0174】

以下の表 A 1 ~ 5 に係る式 (I) の化合物は、上記の方法に従って調製可能である。以下の例は、本発明の例示を意図し、式 (I - 1a)、(I - 2a)、(I - 3a)、(I

50

- 4 a) 及び (I - 5 a) の化合物の形態で好ましい式 (I) の化合物を示す。

【化 4 2】



10

【 0 1 7 5 】

20

30

40

50

【表 1 - 1】

表 1: 1447 種の式(I-1a)の化合物が提供されており、ここで、置換基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^6 及び R^7 は以下の各行に示されている:

指数	R^2	R^3	R^6	R^7	R^1
1	H	Cl	H	CF ₃	エチル
2	H	Cl	H	CHF ₂	エチル
3	H	Cl	H	iPr	エチル
4	H	Cl	H	シクロプロピル	エチル
5	H	Cl	メチル	CF ₃	エチル
6	H	Cl	メチル	CHF ₂	エチル
7	H	Cl	メチル	iPr	エチル
8	H	Cl	メチル	シクロプロピル	エチル
9	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	エチル
10	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	エチル
11	H	Cl	メキシメチル	iPr	エチル
12	H	Cl	メキシメチル	シクロプロピル	エチル
13	H	Cl	アセチル	CF ₃	エチル
14	H	Cl	アセチル	CHF ₂	エチル
15	H	Cl	アセチル	iPr	エチル
16	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	エチル
17	H	Me	H	CF ₃	エチル
18	H	Me	H	CHF ₂	エチル
19	H	Me	H	iPr	エチル
20	H	Me	H	シクロプロピル	エチル
21	H	Me	メチル	CF ₃	エチル
22	H	Me	メチル	CHF ₂	エチル
23	H	Me	メチル	iPr	エチル
24	H	Me	メチル	シクロプロピル	エチル
25	H	Me	メキシメチル	CF ₃	エチル
26	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	エチル
27	H	Me	メキシメチル	iPr	エチル
28	H	Me	メキシメチル	シクロプロピル	エチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
				ロピル	
29	H	Me	アセチル	CF ₃	エチル
30	H	Me	アセチル	CHF ₂	エチル
31	H	Me	アセチル	iPr	エチル
32	H	Me	アセチル	シクロプロピル	エチル
33	メチル	Cl	H	CF ₃	エチル
34	メチル	Cl	H	CHF ₂	エチル
35	メチル	Cl	H	iPr	エチル
36	メチル	Cl	H	シクロプロピル	エチル
37	メチル	Cl	メチル	CF ₃	エチル
38	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	エチル
39	メチル	Cl	メチル	iPr	エチル
40	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	エチル
41	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	エチル
42	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
43	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	エチル
44	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	エチル
45	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	エチル
46	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	エチル
47	メチル	Cl	アセチル	iPr	エチル
48	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	エチル
49	メチル	Me	H	CF ₃	エチル
50	メチル	Me	H	CHF ₂	エチル
51	メチル	Me	H	iPr	エチル
52	メチル	Me	H	シクロプロピル	エチル
53	メチル	Me	メチル	CF ₃	エチル
54	メチル	Me	メチル	CHF ₂	エチル
55	メチル	Me	メチル	iPr	エチル
56	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	エチル
57	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
58	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
59	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
60	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	エチル
61	メチル	Me	アセチル	CF ₃	エチル
62	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	エチル
63	メチル	Me	アセチル	iPr	エチル
64	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	エチル
65	アセチル	Cl	H	CF ₃	エチル
66	アセチル	Cl	H	CHF ₂	エチル
67	アセチル	Cl	H	iPr	エチル
68	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	エチル
69	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	エチル
70	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	エチル
71	アセチル	Cl	メチル	iPr	エチル
72	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	エチル
73	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	エチル
74	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
75	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	エチル
76	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	エチル
77	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	エチル
78	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	エチル
79	アセチル	Cl	アセチル	iPr	エチル
80	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	エチル
81	アセチル	Me	H	CF ₃	エチル
82	アセチル	Me	H	CHF ₂	エチル
83	アセチル	Me	H	iPr	エチル
84	アセチル	Me	H	シクロプロピル	エチル
85	アセチル	Me	メチル	CF ₃	エチル
86	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	エチル
87	アセチル	Me	メチル	iPr	エチル
88	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	エチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
89	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
90	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
91	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
92	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	エチル
93	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	エチル
94	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	エチル
95	アセチル	Me	アセチル	iPr	エチル
96	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	エチル
97	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	エチル
98	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	エチル
99	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	エチル
100	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	エチル
101	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	エチル
102	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	エチル
103	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	iPr	エチル
104	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	シクロプロピル	エチル
105	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	エチル
106	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
107	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	iPr	エチル
108	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	エチル
109	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	CF ₃	エチル
110	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	CHF ₂	エチル
111	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	iPr	エチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
112	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	エチル
113	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	エチル
114	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	エチル
115	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	エチル
116	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	エチル
117	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	エチル
118	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	エチル
119	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	エチル
120	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	エチル
121	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
122	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
123	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
124	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	エチル
125	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	エチル
126	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	エチル
127	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	エチル
128	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	エチル
129	H	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
130	H	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
131	H	Cl	H	iPr	イソプロピル
132	H	Cl	H	シクロブ ロピル	イソプロピル
133	H	Cl	メチル	CF ₃	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
134	H	Cl	メチル	CHF ₂	イソプロピル
135	H	Cl	メチル	iPr	イソプロピル
136	H	Cl	メチル	シクロプロピル	イソプロピル
137	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	イソプロピル
138	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
139	H	Cl	メキシメチル	iPr	イソプロピル
140	H	Cl	メキシメチル	シクロプロピル	イソプロピル
141	H	Cl	アセチル	CF ₃	イソプロピル
142	H	Cl	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
143	H	Cl	アセチル	iPr	イソプロピル
144	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	イソプロピル
145	H	Me	H	CF ₃	イソプロピル
146	H	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
147	H	Me	H	iPr	イソプロピル
148	H	Me	H	シクロプロピル	イソプロピル
149	H	Me	メチル	CF ₃	イソプロピル
150	H	Me	メチル	CHF ₂	イソプロピル
151	H	Me	メチル	iPr	イソプロピル
152	H	Me	メチル	シクロプロピル	イソプロピル
153	H	Me	メキシメチル	CF ₃	イソプロピル
154	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
155	H	Me	メキシメチル	iPr	イソプロピル
156	H	Me	メキシメチル	シクロプロピル	イソプロピル
157	H	Me	アセチル	CF ₃	イソプロピル
158	H	Me	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
159	H	Me	アセチル	iPr	イソプロピル
160	H	Me	アセチル	シクロプロピル	イソプロピル
161	メチル	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
162	メチル	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
163	メチル	Cl	H	iPr	イソプロピル
164	メチル	Cl	H	シクロプロピル	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 7】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
				ロピル	
165	メチル	Cl	メチル	CF ₃	イソプロピル
166	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	イソプロピル
167	メチル	Cl	メチル	iPr	イソプロピル
168	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	イソプロピル
169	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
170	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
171	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
172	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	イソプロピル
173	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	イソプロピル
174	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
175	メチル	Cl	アセチル	iPr	イソプロピル
176	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	イソプロピル
177	メチル	Me	H	CF ₃	イソプロピル
178	メチル	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
179	メチル	Me	H	iPr	イソプロピル
180	メチル	Me	H	シクロプロピル	イソプロピル
181	メチル	Me	メチル	CF ₃	イソプロピル
182	メチル	Me	メチル	CHF ₂	イソプロピル
183	メチル	Me	メチル	iPr	イソプロピル
184	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	イソプロピル
185	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
186	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
187	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
188	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	イソプロピル
189	メチル	Me	アセチル	CF ₃	イソプロピル
190	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
191	メチル	Me	アセチル	iPr	イソプロピル
192	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	イソプロピル
193	アセチル	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
194	アセチル	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
195	アセチル	Cl	H	iPr	イソプロピル
196	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	イソプロピル
197	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	イソプロピル
198	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	イソプロピル
199	アセチル	Cl	メチル	iPr	イソプロピル
200	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	イソプロピル
201	アセチル	Cl	メキシメチル	CF ₃	イソプロピル
202	アセチル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
203	アセチル	Cl	メキシメチル	iPr	イソプロピル
204	アセチル	Cl	メキシメチル	シクロプロピル	イソプロピル
205	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	イソプロピル
206	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
207	アセチル	Cl	アセチル	iPr	イソプロピル
208	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	イソプロピル
209	アセチル	Me	H	CF ₃	イソプロピル
210	アセチル	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
211	アセチル	Me	H	iPr	イソプロピル
212	アセチル	Me	H	シクロプロピル	イソプロピル
213	アセチル	Me	メチル	CF ₃	イソプロピル
214	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	イソプロピル
215	アセチル	Me	メチル	iPr	イソプロピル
216	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	イソプロピル
217	アセチル	Me	メキシメチル	CF ₃	イソプロピル
218	アセチル	Me	メキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
219	アセチル	Me	メキシメチル	iPr	イソプロピル
220	アセチル	Me	メキシメチル	シクロプロピル	イソプロピル
221	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	イソプロピル
222	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
223	アセチル	Me	アセチル	iPr	イソプロピル
224	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 9】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
225	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
226	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
227	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	iPr	イソプロピル
228	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	シクロブ ロピル	イソプロピル
229	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CF ₃	イソプロピル
230	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CHF ₂	イソプロピル
231	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	iPr	イソプロピル
232	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	イソプロピル
233	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
234	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
235	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
236	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	イソプロピル
237	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	イソプロピル
238	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
239	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	イソプロピル
240	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	イソプロピル
241	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	イソプロピル
242	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
243	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	イソプロピル
244	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	イソプロピル
245	2-メチルプロパノ	Me	メチル	CF ₃	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 10】

指数	R ²	R ³	R ⁵	R ⁷	R ¹
	イル				
246	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	イソプロピル
247	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	イソプロピル
248	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	イソプロピル
249	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
250	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
251	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
252	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	イソプロピル
253	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	イソプロピル
254	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	イソプロピル
255	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	イソプロピル
256	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	イソプロピル
257	H	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
258	H	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
259	H	Cl	H	iPr	プロパルギル
260	H	Cl	H	シクロブ ロピル	プロパルギル
261	H	Cl	メチル	CF ₃	プロパルギル
262	H	Cl	メチル	CHF ₂	プロパルギル
263	H	Cl	メチル	iPr	プロパルギル
264	H	Cl	メチル	シクロブ ロピル	プロパルギル
265	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
266	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
267	H	Cl	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
268	H	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	プロパルギル
269	H	Cl	アセチル	CF ₃	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 1】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
270	H	Cl	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
271	H	Cl	アセチル	iPr	プロパルギル
272	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	プロパルギル
273	H	Me	H	CF ₃	プロパルギル
274	H	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
275	H	Me	H	iPr	プロパルギル
276	H	Me	H	シクロプロピル	プロパルギル
277	H	Me	メチル	CF ₃	プロパルギル
278	H	Me	メチル	CHF ₂	プロパルギル
279	H	Me	メチル	iPr	プロパルギル
280	H	Me	メチル	シクロプロピル	プロパルギル
281	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
282	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
283	H	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
284	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	プロパルギル
285	H	Me	アセチル	CF ₃	プロパルギル
286	H	Me	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
287	H	Me	アセチル	iPr	プロパルギル
288	H	Me	アセチル	シクロプロピル	プロパルギル
289	メチル	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
290	メチル	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
291	メチル	Cl	H	iPr	プロパルギル
292	メチル	Cl	H	シクロプロピル	プロパルギル
293	メチル	Cl	メチル	CF ₃	プロパルギル
294	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	プロパルギル
295	メチル	Cl	メチル	iPr	プロパルギル
296	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	プロパルギル
297	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
298	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
299	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
300	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
				ロピル	
301	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	プロパルギル
302	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
303	メチル	Cl	アセチル	iPr	プロパルギル
304	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	プロパルギル
305	メチル	Me	H	CF ₃	プロパルギル
306	メチル	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
307	メチル	Me	H	iPr	プロパルギル
308	メチル	Me	H	シクロプロピル	プロパルギル
309	メチル	Me	メチル	CF ₃	プロパルギル
310	メチル	Me	メチル	CHF ₂	プロパルギル
311	メチル	Me	メチル	iPr	プロパルギル
312	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	プロパルギル
313	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
314	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
315	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
316	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	プロパルギル
317	メチル	Me	アセチル	CF ₃	プロパルギル
318	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
319	メチル	Me	アセチル	iPr	プロパルギル
320	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	プロパルギル
321	アセチル	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
322	アセチル	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
323	アセチル	Cl	H	iPr	プロパルギル
324	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	プロパルギル
325	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	プロパルギル
326	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	プロパルギル
327	アセチル	Cl	メチル	iPr	プロパルギル
328	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	プロパルギル
329	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
330	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
331	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
332	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	プロパルギル
333	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	プロパルギル
334	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
335	アセチル	Cl	アセチル	iPr	プロパルギル
336	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	プロパルギル
337	アセチル	Me	H	CF ₃	プロパルギル
338	アセチル	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
339	アセチル	Me	H	iPr	プロパルギル
340	アセチル	Me	H	シクロプロピル	プロパルギル
341	アセチル	Me	メチル	CF ₃	プロパルギル
342	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	プロパルギル
343	アセチル	Me	メチル	iPr	プロパルギル
344	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	プロパルギル
345	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
346	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
347	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
348	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	プロパルギル
349	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	プロパルギル
350	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
351	アセチル	Me	アセチル	iPr	プロパルギル
352	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	プロパルギル
353	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
354	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
355	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	プロパルギル
356	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	プロパルギル
357	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
358	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CHF ₂	プロパルギル
359	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	iPr	プロパルギル
360	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	プロパルギル
361	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
362	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
363	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
364	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	プロパルギル
365	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	プロパルギル
366	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
367	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	プロパルギル
368	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	プロパルギル
369	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	プロパルギル
370	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
371	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	プロパルギル
372	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	プロパルギル
373	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	プロパルギル
374	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	プロパルギル
375	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	プロパルギル
376	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	プロパルギル
377	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
378	2-メチルプロパノ	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 1 - 15】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル				
379	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
380	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロプロ ピル	プロパルギル
381	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	プロパルギル
382	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	プロパルギル
383	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	プロパルギル
384	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロプロ ピル	プロパルギル
385	H	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
386	H	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
387	H	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
388	H	Cl	H	シクロプロ ピル	2,2,2-トリフルオロエチル
389	H	Cl	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
390	H	Cl	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
391	H	Cl	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
392	H	Cl	メチル	シクロプロ ピル	2,2,2-トリフルオロエチル
393	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
394	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
395	H	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
396	H	Cl	メトキシメチル	シクロプロ ピル	2,2,2-トリフルオロエチル
397	H	Cl	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
398	H	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
399	H	Cl	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
400	H	Cl	アセチル	シクロプロ ピル	2,2,2-トリフルオロエチル
401	H	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
402	H	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
403	H	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
404	H	Me	H	シクロプロ ピル	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 16】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
405	H	Me	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
406	H	Me	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
407	H	Me	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
408	H	Me	メチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
409	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
410	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
411	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
412	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
413	H	Me	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
414	H	Me	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
415	H	Me	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
416	H	Me	アセチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
417	メチル	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
418	メチル	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
419	メチル	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
420	メチル	Cl	H	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
421	メチル	Cl	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
422	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
423	メチル	Cl	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
424	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
425	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
426	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
427	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
428	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
429	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
430	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
431	メチル	Cl	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
432	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
433	メチル	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
434	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
435	メチル	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 17】

指数	R ²	R ³	R ⁴	R ⁷	R ¹
436	メチル	Me	H	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
437	メチル	Me	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
438	メチル	Me	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
439	メチル	Me	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
440	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
441	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
442	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
443	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
444	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
445	メチル	Me	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
446	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
447	メチル	Me	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
448	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
449	アセチル	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
450	アセチル	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
451	アセチル	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
452	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
453	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
454	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
455	アセチル	Cl	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
456	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
457	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
458	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
459	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
460	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
461	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
462	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
463	アセチル	Cl	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
464	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
465	アセチル	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
466	アセチル	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
467	アセチル	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
468	アセチル	Me	H	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
469	アセチル	Me	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
470	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
471	アセチル	Me	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
472	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
473	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
474	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
475	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
476	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
477	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
478	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
479	アセチル	Me	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
480	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
481	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
482	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
483	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
484	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
485	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
486	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
487	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
488	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	シクロプロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
489	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
490	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 19】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
491	2-メチルプロパノ イル	Cl	メキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
492	2-メチルプロパノ イル	Cl	メキシメチル	シクロブ ロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
493	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
494	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
495	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
496	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
497	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
498	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
499	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
500	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
501	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
502	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
503	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
504	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
505	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
506	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
507	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
508	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	シクロブ ロピル	2,2,2-トリフルオロエチル
509	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
510	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
511	2-メチルプロパノ	Me	アセチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 20】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル				
512	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロプロ ピル	2,2,2-トリフルオロエチル
513	H	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
514	H	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
515	H	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
516	H	Cl	H	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
517	H	Cl	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
518	H	Cl	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
519	H	Cl	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
520	H	Cl	メチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
521	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
522	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
523	H	Cl	メキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
524	H	Cl	メキシメチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
525	H	Cl	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
526	H	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
527	H	Cl	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
528	H	Cl	アセチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
529	H	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
530	H	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
531	H	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
532	H	Me	H	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
533	H	Me	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
534	H	Me	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
535	H	Me	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
536	H	Me	メチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
537	H	Me	メキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
538	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
539	H	Me	メキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
540	H	Me	メキシメチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 1】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
541	H	Me	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
542	H	Me	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
543	H	Me	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
544	H	Me	アセチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
545	メチル	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
546	メチル	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
547	メチル	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
548	メチル	Cl	H	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
549	メチル	Cl	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
550	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
551	メチル	Cl	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
552	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
553	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
554	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
555	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
556	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
557	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
558	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
559	メチル	Cl	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
560	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
561	メチル	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
562	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
563	メチル	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
564	メチル	Me	H	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
565	メチル	Me	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
566	メチル	Me	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
567	メチル	Me	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
568	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
569	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
570	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
571	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
572	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
573	メチル	Me	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
574	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
575	メチル	Me	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
576	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
577	アセチル	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
578	アセチル	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
579	アセチル	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
580	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
581	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
582	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
583	アセチル	Cl	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
584	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
585	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
586	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
587	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
588	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
589	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
590	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
591	アセチル	Cl	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
592	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
593	アセチル	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
594	アセチル	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
595	アセチル	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
596	アセチル	Me	H	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
597	アセチル	Me	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
598	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
599	アセチル	Me	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
600	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
601	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
602	アセチル	Me	メキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
603	アセチル	Me	メキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
604	アセチル	Me	メキシメチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
605	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
606	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
607	アセチル	Me	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
608	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
609	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
610	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
611	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
612	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
613	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
614	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
615	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
616	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
617	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
618	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
619	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
620	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル
621	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
622	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
623	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
624	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	シクロプロピル	2,2-ジフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル			ロピル	
625	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
626	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
627	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
628	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
629	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
630	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
631	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
632	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
633	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
634	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
635	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
636	2-メチルプロパノ イル	Me	メキシメチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
637	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
638	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
639	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
640	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロプロ ピル	2,2-ジフルオロエチル
641	H	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
642	H	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
643	H	Cl	H	iPr	シクロプロピル
644	H	Cl	H	シクロプロ ピル	シクロプロピル
645	H	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピル
646	H	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
647	H	Cl	メチル	iPr	シクロプロピル
648	H	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピル
649	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
650	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
651	H	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
652	H	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピル
653	H	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
654	H	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
655	H	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピル
656	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピル
657	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
658	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
659	H	Me	H	iPr	シクロプロピル
660	H	Me	H	シクロプロピル	シクロプロピル
661	H	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピル
662	H	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
663	H	Me	メチル	iPr	シクロプロピル
664	H	Me	メチル	シクロプロピル	シクロプロピル
665	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
666	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
667	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
668	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピル
669	H	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
670	H	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
671	H	Me	アセチル	iPr	シクロプロピル
672	H	Me	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピル
673	メチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
674	メチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
675	メチル	Cl	H	iPr	シクロプロピル
676	メチル	Cl	H	シクロプロピル	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
677	メチル	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピル
678	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
679	メチル	Cl	メチル	iPr	シクロプロピル
680	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピル
681	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
682	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
683	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
684	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピル
685	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
686	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
687	メチル	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピル
688	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピル
689	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
690	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
691	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピル
692	メチル	Me	H	シクロプロピル	シクロプロピル
693	メチル	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピル
694	メチル	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
695	メチル	Me	メチル	iPr	シクロプロピル
696	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	シクロプロピル
697	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
698	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
699	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
700	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピル
701	メチル	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
702	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
703	メチル	Me	アセチル	iPr	シクロプロピル
704	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピル
705	アセチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
706	アセチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
707	アセチル	Cl	H	iPr	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 7】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
708	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	シクロプロピル
709	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピル
710	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
711	アセチル	Cl	メチル	iPr	シクロプロピル
712	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピル
713	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
714	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
715	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
716	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピル
717	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
718	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
719	アセチル	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピル
720	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピル
721	アセチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
722	アセチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
723	アセチル	Me	H	iPr	シクロプロピル
724	アセチル	Me	H	シクロプロピル	シクロプロピル
725	アセチル	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピル
726	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
727	アセチル	Me	メチル	iPr	シクロプロピル
728	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	シクロプロピル
729	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
730	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
731	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
732	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピル
733	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
734	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
735	アセチル	Me	アセチル	iPr	シクロプロピル
736	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピル
737	2-メチルプロパノ	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル				
738	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
739	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	iPr	シクロプロピル
740	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	シクロプロ ピル	シクロプロピル
741	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピル
742	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
743	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	iPr	シクロプロピル
744	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	シクロプロ ピル	シクロプロピル
745	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
746	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
747	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
748	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	シクロプロ ピル	シクロプロピル
749	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
750	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
751	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピル
752	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロプロ ピル	シクロプロピル
753	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
754	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
755	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	シクロプロピル
756	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロプロ ピル	シクロプロピル
757	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 2 9】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
758	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピル
759	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	シクロプロピル
760	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロ プロ ピル	シクロプロピル
761	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
762	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
763	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
764	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロ プロ ピル	シクロプロピル
765	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピル
766	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピル
767	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	シクロプロピル
768	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロ プロ ピル	シクロプロピル
769	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
770	H	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
771	H	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
772	H	Cl	H	シクロ プロ ピル	1-シアノシクロプロピル
773	H	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
774	H	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
775	H	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
776	H	Cl	メチル	シクロ プロ ピル	1-シアノシクロプロピル
777	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
778	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
779	H	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
780	H	Cl	メトキシメチル	シクロ プロ ピル	1-シアノシクロプロピル
781	H	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
782	H	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 0】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
783	H	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
784	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
785	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
786	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
787	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
788	H	Me	H	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
789	H	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
790	H	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
791	H	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
792	H	Me	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
793	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
794	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
795	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
796	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
797	H	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
798	H	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
799	H	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
800	H	Me	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
801	メチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
802	メチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
803	メチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
804	メチル	Cl	H	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
805	メチル	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
806	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
807	メチル	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
808	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
809	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
810	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
811	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
812	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 1】

指数	R ²	R ³	R ⁵	R ⁷	R ¹
813	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
814	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
815	メチル	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
816	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
817	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
818	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
819	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
820	メチル	Me	H	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
821	メチル	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
822	メチル	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
823	メチル	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
824	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
825	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
826	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
827	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
828	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
829	メチル	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
830	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
831	メチル	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
832	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
833	アセチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
834	アセチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
835	アセチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
836	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
837	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
838	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
839	アセチル	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
840	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
841	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
842	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
843	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
844	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
845	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
846	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
847	アセチル	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
848	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
849	アセチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
850	アセチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
851	アセチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
852	アセチル	Me	H	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
853	アセチル	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
854	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
855	アセチル	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
856	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
857	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
858	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
859	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
860	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
861	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
862	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
863	アセチル	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
864	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
865	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
866	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
867	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
868	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	1-シアノシクロプロピル
869	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
870	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
871	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
872	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
873	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
874	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
875	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
876	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
877	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
878	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
879	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
880	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
881	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
882	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
883	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
884	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
885	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
886	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
887	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
888	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
889	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
890	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
891	2-メチルプロパノ	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル				
892	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
893	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
894	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
895	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
896	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロプロピル
897	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
898	H	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
899	H	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
900	H	Cl	H	シクロプロ ピル	1-シアノシクロブチル
901	H	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
902	H	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
903	H	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
904	H	Cl	メチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロブチル
905	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
906	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
907	H	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
908	H	Cl	メトキシメチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロブチル
909	H	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
910	H	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
911	H	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
912	H	Cl	アセチル	シクロプロ ピル	1-シアノシクロブチル
913	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
914	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
915	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
916	H	Me	H	シクロプロ ピル	1-シアノシクロブチル
917	H	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
918	H	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
919	H	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
920	H	Me	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
921	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
922	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
923	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
924	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
925	H	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
926	H	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
927	H	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
928	H	Me	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
929	メチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
930	メチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
931	メチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
932	メチル	Cl	H	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
933	メチル	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
934	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
935	メチル	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
936	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
937	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
938	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
939	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
940	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
941	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
942	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
943	メチル	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
944	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
945	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
946	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
947	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
948	メチル	Me	H	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
949	メチル	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
950	メチル	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
951	メチル	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
952	メチル	Me	メチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
953	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
954	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
955	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
956	メチル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
957	メチル	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
958	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
959	メチル	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
960	メチル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
961	アセチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
962	アセチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
963	アセチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
964	アセチル	Cl	H	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
965	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
966	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
967	アセチル	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
968	アセチル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
969	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
970	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
971	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
972	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
973	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
974	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
975	アセチル	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
976	アセチル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
977	アセチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
978	アセチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
979	アセチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 7】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
980	アセチル	Me	H	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
981	アセチル	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
982	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
983	アセチル	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
984	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
985	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
986	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
987	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
988	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
989	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
990	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
991	アセチル	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
992	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
993	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
994	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
995	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
996	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
997	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
998	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
999	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
1000	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	シクロプロピル	1-シアノシクロブチル
1001	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
1002	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
1003	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1004	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
1005	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
1006	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
1007	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
1008	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
1009	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
1010	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
1011	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
1012	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
1013	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
1014	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
1015	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	1-シアノシクロブチル
1016	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
1017	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
1018	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
1019	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
1020	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	1-シアノシクロブチル
1021	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
1022	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
1023	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	1-シアノシクロブチル
1024	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロブ	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 3 9】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル			ロピル	
1025	H	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1026	H	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1027	H	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1028	H	Cl	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1029	H	Cl	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1030	H	Cl	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1031	H	Cl	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1032	H	Cl	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1033	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1034	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1035	H	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1036	H	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1037	H	Cl	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1038	H	Cl	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1039	H	Cl	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1040	H	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1041	H	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1042	H	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1043	H	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1044	H	Me	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1045	H	Me	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1046	H	Me	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1047	H	Me	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1048	H	Me	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1049	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1050	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1051	H	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1052	H	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1053	H	Me	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1054	H	Me	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 0】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1055	H	Me	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1056	H	Me	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1057	メチル	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1058	メチル	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1059	メチル	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1060	メチル	Cl	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1061	メチル	Cl	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1062	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1063	メチル	Cl	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1064	メチル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1065	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1066	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1067	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1068	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1069	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1070	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1071	メチル	Cl	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1072	メチル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1073	メチル	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1074	メチル	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1075	メチル	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1076	メチル	Me	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1077	メチル	Me	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1078	メチル	Me	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1079	メチル	Me	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1080	メチル	Me	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1081	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1082	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1083	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1084	メチル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 1】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1085	メチル	Me	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1086	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1087	メチル	Me	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1088	メチル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1089	アセチル	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1090	アセチル	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1091	アセチル	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1092	アセチル	Cl	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1093	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1094	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1095	アセチル	Cl	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1096	アセチル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1097	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1098	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1099	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1100	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1101	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1102	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1103	アセチル	Cl	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1104	アセチル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1105	アセチル	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1106	アセチル	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1107	アセチル	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1108	アセチル	Me	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1109	アセチル	Me	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1110	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1111	アセチル	Me	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1112	アセチル	Me	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1113	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1114	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1115	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1116	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1117	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1118	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1119	アセチル	Me	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1120	アセチル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1121	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1122	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1123	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1124	2-メチルプロパノ イル	Cl	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1125	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1126	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1127	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1128	2-メチルプロパノ イル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1129	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1130	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1131	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1132	2-メチルプロパノ イル	Cl	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1133	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1134	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1135	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1136	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1137	2-メチルプロパノ	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル				
1138	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1139	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1140	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1141	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1142	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1143	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1144	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1145	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1146	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1147	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1148	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1149	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
1150	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
1151	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
1152	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	3,3-ジフルオロシクロブチル
1153	H	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1154	H	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1155	H	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1156	H	Cl	H	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1157	H	Cl	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1158	H	Cl	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1159	H	Cl	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1160	H	Cl	メチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1161	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1162	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1163	H	Cl	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1164	H	Cl	メキシメチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1165	H	Cl	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1166	H	Cl	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1167	H	Cl	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1168	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1169	H	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1170	H	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1171	H	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1172	H	Me	H	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1173	H	Me	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1174	H	Me	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1175	H	Me	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1176	H	Me	メチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1177	H	Me	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1178	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
					ル
1179	H	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1180	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1181	H	Me	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1182	H	Me	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1183	H	Me	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1184	H	Me	アセチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1185	メチル	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1186	メチル	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1187	メチル	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1188	メチル	Cl	H	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1189	メチル	Cl	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1190	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1191	メチル	Cl	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1192	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1193	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1194	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1195	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1196	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1197	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1198	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1199	メチル	Cl	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1200	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1201	メチル	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1202	メチル	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1203	メチル	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1204	メチル	Me	H	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1205	メチル	Me	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1206	メチル	Me	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1207	メチル	Me	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1208	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1209	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1210	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1211	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1212	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1213	メチル	Me	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1214	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1215	メチル	Me	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1216	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1217	アセチル	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1218	アセチル	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1219	アセチル	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 7】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
					ル
1220	アセチル	Cl	H	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1221	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1222	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1223	アセチル	Cl	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1224	アセチル	Cl	メチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1225	アセチル	Cl	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1226	アセチル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1227	アセチル	Cl	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1228	アセチル	Cl	メキシメチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1229	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1230	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1231	アセチル	Cl	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1232	アセチル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1233	アセチル	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1234	アセチル	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1235	アセチル	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1236	アセチル	Me	H	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1237	アセチル	Me	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1238	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1239	アセチル	Me	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1240	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1241	アセチル	Me	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1242	アセチル	Me	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1243	アセチル	Me	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1244	アセチル	Me	メキシメチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1245	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1246	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1247	アセチル	Me	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1248	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1249	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1250	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1251	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1252	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1253	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1254	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1255	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1256	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1257	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1258	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1259	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
1260	2-メチルプロパノイル	Cl	メキシメチル	シクロプロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イル

10

20

30

40

50

【表 1 - 4 9】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
	イル			ロピル	ル
1261	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1262	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1263	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1264	2-メチルプロパノ イル	Cl	アセチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1265	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1266	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1267	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1268	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1269	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1270	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1271	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1272	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1273	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1274	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1275	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1276	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1277	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1278	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1279	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル
1280	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロブ ロピル	1,1-ジオキソチエタン-3-イ ル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 0】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1281	H	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1282	H	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1283	H	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
1284	H	Cl	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1285	H	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1286	H	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1287	H	Cl	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1288	H	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1289	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1290	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1291	H	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1292	H	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1293	H	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1294	H	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1295	H	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1296	H	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1297	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1298	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1299	H	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
1300	H	Me	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1301	H	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1302	H	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1303	H	Me	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1304	H	Me	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1305	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1306	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1307	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1308	H	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1309	H	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1310	H	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1311	H	Me	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 1】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1312	H	Me	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1313	メチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1314	メチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1315	メチル	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
1316	メチル	Cl	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1317	メチル	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1318	メチル	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1319	メチル	Cl	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1320	メチル	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1321	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1322	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1323	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1324	メチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1325	メチル	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1326	メチル	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1327	メチル	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1328	メチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1329	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1330	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1331	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
1332	メチル	Me	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1333	メチル	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1334	メチル	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1335	メチル	Me	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1336	メチル	Me	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1337	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1338	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1339	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1340	メチル	Me	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1341	メチル	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1342	メチル	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1343	メチル	Me	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1344	メチル	Me	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1345	アセチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1346	アセチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1347	アセチル	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
1348	アセチル	Cl	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1349	アセチル	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1350	アセチル	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1351	アセチル	Cl	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1352	アセチル	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1353	アセチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1354	アセチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1355	アセチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1356	アセチル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1357	アセチル	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1358	アセチル	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1359	アセチル	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1360	アセチル	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1361	アセチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1362	アセチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1363	アセチル	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
1364	アセチル	Me	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1365	アセチル	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1366	アセチル	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1367	アセチル	Me	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1368	アセチル	Me	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1369	アセチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1370	アセチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1371	アセチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1372	アセチル	Me	メトキシメチル	シクロプロ	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
				ロピル	
1373	アセチル	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1374	アセチル	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1375	アセチル	Me	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1376	アセチル	Me	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1377	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
1378	2-メチルプロパノイル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1379	2-メチルプロパノイル	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
1380	2-メチルプロパノイル	Cl	H	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1381	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1382	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1383	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1384	2-メチルプロパノイル	Cl	メチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1385	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1386	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1387	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1388	2-メチルプロパノイル	Cl	メトキシメチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1389	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1390	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1391	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1392	2-メチルプロパノイル	Cl	アセチル	シクロプロピル	シクロプロピルメチル
1393	2-メチルプロパノイル	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1394	2-メチルプロパノ イル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1395	2-メチルプロパノ イル	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
1396	2-メチルプロパノ イル	Me	H	シクロ プロ ピル	シクロプロピルメチル
1397	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1398	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1399	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	iPr	シクロプロピルメチル
1400	2-メチルプロパノ イル	Me	メチル	シクロ プロ ピル	シクロプロピルメチル
1401	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1402	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1403	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
1404	2-メチルプロパノ イル	Me	メトキシメチル	シクロ プロ ピル	シクロプロピルメチル
1405	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
1406	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
1407	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	iPr	シクロプロピルメチル
1408	2-メチルプロパノ イル	Me	アセチル	シクロ プロ ピル	シクロプロピルメチル
1409	H	Cl	H	CHCl ₂	シクロプロピル
1410	H	Cl	H	CF ₃	ビスクロ[1.1.1]ペンタニル
1411	H	Cl	tert-ブトキシカ ルボニル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
1412	H	Cl	シアノメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
1413	H	Cl	2-メチルプロパ ノイルオキシメ チル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
1414	H	Cl	H	CF ₃	tert-ブチル
1415	H	Cl	2-メチルプロパ	CF ₃	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
			ノイルオキシメ チル		
1416	H	Cl	メトキシカルボ ニル	CF ₃	シクロプロピル
1417	H	Cl	シアノメチル	CF ₃	シクロプロピル
1418	H	Cl	H	CF ₃	5-フルオロ 3-シアノピリジン -6-イル
1419	H	Cl	H	CF ₃	5-フルオロ 3-クロロピリジン -6-イル
1420	H	Cl	H	CF ₃	5-メチル 3-クロロピリジン- 6-イル
1421	H	Cl	H	CF ₃	2,4,6-トリフルオロフェニル
1422	H	Cl	H	CF ₃	2,4-ジフルオロフェニル
1423	H	Cl	H	CF ₃	2-フルオロ 4-シアノフェニル
1424	H	Cl	H	CF ₃	2-フルオロ 4-(メチルスルホ ニル)フェニル
1425	H	Cl	H	CF ₃	2-フルオロ 4-クロロフェニ ル
1426	H	Me	H	CF ₃	ビスクロ[1.1.1]ペンタニル
1427	H	Me	H	CF ₃	1-[2-(5-シアノ-2-ピリジ ル)-1,2,4-トリアゾール-3- イル]エチル
1428	H	Me	H	CF ₃	(5-クロロ-2-ピリジル)メチ ル
1429	H	Me	H	CF ₃	(1E)-1-メトキシイミノ-2-メ チル-プロパン-2-イル
1430	H	Me	H	CF ₃	3-オキソ-2-(2,2,2-トリフル オロエチル)イソキサゾリジ ン-4-イル
1431	H	Me	H	CF ₃	1-シクロプロピルエチル
1432	H	Me	H	CF ₃	(3-クロロ-2-ピリジル)メチ ル
1433	H	Me	H	CF ₃	2,4-ジフルオロフェニル
1434	H	Me	H	CF ₃	1-(4-フルオロフェニル)-2- オキソ-ピロリジン-3-イル
1435	H	Me	H	CF ₃	1-(5-メチル-1,2,4-オキサジ アゾール-3-イル)エチル
1436	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメトキシ

10

20

30

40

50

【表 1 - 5 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1437	H	Cl	tert-ブトキシカルボニル	CF ₃	シクロプロピル
1438	H	Cl	H	CF ₃	ベンジル
1439	H	Cl	H	CF ₃	1-シクロプロピルエチル
1440	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピルメチル
1441	H	Cl	H	CF ₃	3-オキソ-2-エチルイソキサゾリジン-4-イル
1442	H	Cl	H	CF ₃	3-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)イソキサゾリジン-4-イル
1443	H	Cl	H	CF ₃	3-メチルテトラヒドロフラン-3-イル
1444	H	Cl	H	CF ₃	2-シクロプロピルメチルアミノ-2-オキソエチル
1445	H	Cl	H	CF ₃	フェニル
1446	H	Cl	H	CF ₃	1-メチル 1-シアノエチル
1447	H	Cl	H	CF ₃	2-メチル 4-フルオロフェニル

10

20

30

40

50

【 0 1 7 6 】

【表 2 - 1】

表 2: 396 種の式(1-2a)の化合物が提供されており、ここで、置換基 R¹、R²、R³、R⁶ 及び R⁷ は以下の各行に示されている:

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1	H	Cl	H	CF ₃	エチル
2	H	Cl	H	CHF ₂	エチル
3	H	Cl	H	iPr	エチル
4	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	エチル
5	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
6	H	Cl	メトキシメチル	iPr	エチル
7	H	Me	H	CF ₃	エチル
8	H	Me	H	CHF ₂	エチル
9	H	Me	H	iPr	エチル
10	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
11	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
12	H	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
13	H	CN	H	CF ₃	エチル
14	H	CN	H	CHF ₂	エチル
15	H	CN	H	iPr	エチル
16	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	エチル
17	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
18	H	CN	メトキシメチル	iPr	エチル
19	メチル	Cl	H	CF ₃	エチル
20	メチル	Cl	H	CHF ₂	エチル
21	メチル	Cl	H	iPr	エチル
22	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	エチル
23	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
24	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	エチル
25	メチル	Me	H	CF ₃	エチル
26	メチル	Me	H	CHF ₂	エチル
27	メチル	Me	H	iPr	エチル
28	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
29	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
30	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
31	メチル	CN	H	CF ₃	エチル
32	メチル	CN	H	CHF ₂	エチル
33	メチル	CN	H	iPr	エチル

10

20

30

40

50

【表 2 - 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
34	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	エチル
35	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
36	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	エチル
37	H	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
38	H	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
39	H	Cl	H	iPr	イソプロピル
40	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
41	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
42	H	Cl	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
43	H	Me	H	CF ₃	イソプロピル
44	H	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
45	H	Me	H	iPr	イソプロピル
46	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
47	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
48	H	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
49	H	CN	H	CF ₃	イソプロピル
50	H	CN	H	CHF ₂	イソプロピル
51	H	CN	H	iPr	イソプロピル
52	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
53	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
54	H	CN	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
55	メチル	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
56	メチル	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
57	メチル	Cl	H	iPr	イソプロピル
58	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
59	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
60	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
61	メチル	Me	H	CF ₃	イソプロピル
62	メチル	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
63	メチル	Me	H	iPr	イソプロピル
64	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
65	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
66	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
67	メチル	CN	H	CF ₃	イソプロピル
68	メチル	CN	H	CHF ₂	イソプロピル
69	メチル	CN	H	iPr	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 2 - 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
70	メチル	CN	メキシメチル	CF ₃	イソプロピル
71	メチル	CN	メキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
72	メチル	CN	メキシメチル	iPr	イソプロピル
73	H	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
74	H	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
75	H	Cl	H	iPr	プロパルギル
76	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	プロパルギル
77	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
78	H	Cl	メキシメチル	iPr	プロパルギル
79	H	Me	H	CF ₃	プロパルギル
80	H	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
81	H	Me	H	iPr	プロパルギル
82	H	Me	メキシメチル	CF ₃	プロパルギル
83	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
84	H	Me	メキシメチル	iPr	プロパルギル
85	H	CN	H	CF ₃	プロパルギル
86	H	CN	H	CHF ₂	プロパルギル
87	H	CN	H	iPr	プロパルギル
88	H	CN	メキシメチル	CF ₃	プロパルギル
89	H	CN	メキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
90	H	CN	メキシメチル	iPr	プロパルギル
91	メチル	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
92	メチル	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
93	メチル	Cl	H	iPr	プロパルギル
94	メチル	Cl	メキシメチル	CF ₃	プロパルギル
95	メチル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
96	メチル	Cl	メキシメチル	iPr	プロパルギル
97	メチル	Me	H	CF ₃	プロパルギル
98	メチル	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
99	メチル	Me	H	iPr	プロパルギル
100	メチル	Me	メキシメチル	CF ₃	プロパルギル
101	メチル	Me	メキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
102	メチル	Me	メキシメチル	iPr	プロパルギル
103	メチル	CN	H	CF ₃	プロパルギル
104	メチル	CN	H	CHF ₂	プロパルギル
105	メチル	CN	H	iPr	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 2 - 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
106	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
107	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
108	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
109	H	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
110	H	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
111	H	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
112	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
113	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
114	H	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
115	H	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
116	H	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
117	H	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
118	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
119	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
120	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
121	H	CN	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
122	H	CN	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
123	H	CN	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
124	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
125	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
126	H	CN	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
127	メチル	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
128	メチル	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
129	メチル	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
130	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
131	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
132	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
133	メチル	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
134	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
135	メチル	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
136	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
137	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
138	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
139	メチル	CN	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
140	メチル	CN	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
141	メチル	CN	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 2 - 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
142	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
143	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
144	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
145	H	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
146	H	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
147	H	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
148	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
149	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
150	H	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
151	H	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
152	H	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
153	H	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
154	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
155	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
156	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
157	H	CN	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
158	H	CN	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
159	H	CN	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
160	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
161	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
162	H	CN	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
163	メチル	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
164	メチル	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
165	メチル	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
166	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
167	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
168	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
169	メチル	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
170	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
171	メチル	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
172	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
173	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
174	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
175	メチル	CN	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
176	メチル	CN	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
177	メチル	CN	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 2 - 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
178	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
179	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
180	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
181	H	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
182	H	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
183	H	Cl	H	iPr	シクロプロピル
184	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
185	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
186	H	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
187	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
188	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
189	H	Me	H	iPr	シクロプロピル
190	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
191	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
192	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
193	H	CN	H	CF ₃	シクロプロピル
194	H	CN	H	CHF ₂	シクロプロピル
195	H	CN	H	iPr	シクロプロピル
196	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
197	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
198	H	CN	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
199	メチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
200	メチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
201	メチル	Cl	H	iPr	シクロプロピル
202	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
203	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
204	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
205	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
206	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
207	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピル
208	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
209	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
210	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
211	メチル	CN	H	CF ₃	シクロプロピル
212	メチル	CN	H	CHF ₂	シクロプロピル
213	メチル	CN	H	iPr	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 2 - 7】

指数	R ²	R ³	R ⁴	R ⁷	R ¹
214	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
215	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
216	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
217	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
218	H	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
219	H	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
220	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
221	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
222	H	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
223	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
224	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
225	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
226	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
227	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
228	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
229	H	CN	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
230	H	CN	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
231	H	CN	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
232	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
233	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
234	H	CN	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
235	メチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
236	メチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
237	メチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
238	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
239	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
240	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
241	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
242	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
243	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
244	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
245	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
246	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
247	メチル	CN	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
248	メチル	CN	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
249	メチル	CN	H	iPr	1-シアノシクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 2 - 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
250	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
251	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
252	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
253	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
254	H	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
255	H	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
256	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
257	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
258	H	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
259	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
260	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
261	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
262	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
263	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
264	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
265	H	CN	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
266	H	CN	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
267	H	CN	H	iPr	1-シアノシクロブチル
268	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
269	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
270	H	CN	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
271	メチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
272	メチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
273	メチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
274	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
275	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
276	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
277	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
278	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
279	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
280	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
281	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
282	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
283	メチル	CN	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
284	メチル	CN	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
285	メチル	CN	H	iPr	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 2 - 9】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
286	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
287	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
288	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
289	H	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
290	H	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
291	H	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
292	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
293	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
294	H	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
295	H	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
296	H	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
297	H	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
298	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
299	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
300	H	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
301	H	CN	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
302	H	CN	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
303	H	CN	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
304	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
305	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
306	H	CN	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
307	メチル	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
308	メチル	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
309	メチル	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
310	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
311	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
312	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
313	メチル	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
314	メチル	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
315	メチル	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
316	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
317	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
318	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
319	メチル	CN	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
320	メチル	CN	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
321	メチル	CN	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 0】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R1
322	メチル	CN	メキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
323	メチル	CN	メキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
324	メチル	CN	メキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
325	H	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
326	H	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
327	H	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
328	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
329	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
330	H	Cl	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
331	H	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
332	H	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
333	H	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
334	H	Me	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
335	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
336	H	Me	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
337	H	CN	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
338	H	CN	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
339	H	CN	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
340	H	CN	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
341	H	CN	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
342	H	CN	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
343	メチル	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 1】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
					ル
344	メチル	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
345	メチル	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
346	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
347	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
348	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
349	メチル	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
350	メチル	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
351	メチル	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
352	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
353	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
354	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
355	メチル	CN	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
356	メチル	CN	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
357	メチル	CN	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
358	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
359	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
360	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
361	H	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
362	H	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
363	H	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
364	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
365	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

50

【表 2 - 1 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
366	H	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
367	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
368	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
369	H	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
370	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
371	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
372	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
373	H	CN	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
374	H	CN	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
375	H	CN	H	iPr	シクロプロピルメチル
376	H	CN	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
377	H	CN	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
378	H	CN	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
379	メチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
380	メチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
381	メチル	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
382	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
383	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
384	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
385	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
386	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
387	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
388	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
389	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
390	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
391	メチル	CN	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
392	メチル	CN	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
393	メチル	CN	H	iPr	シクロプロピルメチル
394	メチル	CN	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
395	メチル	CN	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
396	メチル	CN	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

【 0 1 7 7 】

50

【表 3 - 1】

表 3: 133 種の式(I-3a)の化合物が提供されており、ここで、置換基 R¹、R²、R³、R⁶ 及び R⁷ は以下の各行に示されている:

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
1	H	Me	H	CF ₃	エチル
2	H	Me	H	CHF ₂	エチル
3	H	Me	H	iPr	エチル
4	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
5	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
6	H	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
7	メチル	Me	H	CF ₃	エチル
8	メチル	Me	H	CHF ₂	エチル
9	メチル	Me	H	iPr	エチル
10	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	エチル
11	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	エチル
12	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	エチル
13	H	Me	H	CF ₃	イソプロピル
14	H	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
15	H	Me	H	iPr	イソプロピル
16	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
17	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
18	H	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
19	メチル	Me	H	CF ₃	イソプロピル
20	メチル	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
21	メチル	Me	H	iPr	イソプロピル
22	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
23	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
24	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
25	H	Me	H	CF ₃	プロパルギル
26	H	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
27	H	Me	H	iPr	プロパルギル
28	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
29	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
30	H	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
31	メチル	Me	H	CF ₃	プロパルギル
32	メチル	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
33	メチル	Me	H	iPr	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 3 - 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
34	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
35	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
36	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
37	H	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
38	H	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
39	H	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
40	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
41	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
42	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
43	メチル	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
44	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
45	メチル	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
46	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
47	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
48	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
49	H	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
50	H	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
51	H	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
52	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
53	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
54	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
55	メチル	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
56	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
57	メチル	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
58	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
59	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
60	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
61	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
62	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
63	H	Me	H	iPr	シクロプロピル
64	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
65	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
66	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
67	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
68	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
69	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 3 - 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
70	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
71	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
72	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
73	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
74	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
75	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
76	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
77	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
78	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
79	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
80	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
81	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
82	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
83	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
84	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
85	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
86	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
87	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
88	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
89	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
90	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
91	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
92	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
93	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
94	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
95	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
96	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
97	H	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
98	H	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
99	H	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
100	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
101	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
102	H	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
103	メチル	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
104	メチル	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
105	メチル	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 3 - 4】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
106	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
107	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
108	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
109	H	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
110	H	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
111	H	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
112	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
113	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
114	H	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
115	メチル	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
116	メチル	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
117	メチル	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
118	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
119	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
120	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
121	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
122	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
123	H	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
124	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
125	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
126	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
127	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
128	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
129	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
130	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
131	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
132	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

【表 3 - 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
133	H	Cl	H	CF ₃	2-ビスクロ[1.1.1]ペンタニル

【 0 1 7 8 】

50

【表 4 - 1】

表 4: 282 種の式(I-4a)の化合物が提供されており、ここで、置換基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^6 及び R^7 は以下の各行に示されている:

指数	R^2	R^3	R^6	R^7	R^1
1	H	Cl	H	CF ₃	エチル
2	H	Cl	H	CHF ₂	エチル
3	H	Cl	H	iPr	エチル
4	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	エチル
5	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	エチル
6	H	Cl	メキシメチル	iPr	エチル
7	H	Me	H	CF ₃	エチル
8	H	Me	H	CHF ₂	エチル
9	H	Me	H	iPr	エチル
10	H	Me	メキシメチル	CF ₃	エチル
11	H	Me	メキシメチル	CHF ₂	エチル
12	H	Me	メキシメチル	iPr	エチル
13	メチル	Cl	H	CF ₃	エチル
14	メチル	Cl	H	CHF ₂	エチル
15	メチル	Cl	H	iPr	エチル
16	メチル	Cl	メキシメチル	CF ₃	エチル
17	メチル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	エチル
18	メチル	Cl	メキシメチル	iPr	エチル
19	メチル	Me	H	CF ₃	エチル
20	メチル	Me	H	CHF ₂	エチル
21	メチル	Me	H	iPr	エチル
22	メチル	Me	メキシメチル	CF ₃	エチル
23	メチル	Me	メキシメチル	CHF ₂	エチル
24	メチル	Me	メキシメチル	iPr	エチル
25	H	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
26	H	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
27	H	Cl	H	iPr	イソプロピル
28	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	イソプロピル
29	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
30	H	Cl	メキシメチル	iPr	イソプロピル
31	H	Me	H	CF ₃	イソプロピル
32	H	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
33	H	Me	H	iPr	イソプロピル

10

20

30

40

50

【表 4 - 2】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
34	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
35	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
36	H	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
37	メチル	Cl	H	CF ₃	イソプロピル
38	メチル	Cl	H	CHF ₂	イソプロピル
39	メチル	Cl	H	iPr	イソプロピル
40	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
41	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
42	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
43	メチル	Me	H	CF ₃	イソプロピル
44	メチル	Me	H	CHF ₂	イソプロピル
45	メチル	Me	H	iPr	イソプロピル
46	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	イソプロピル
47	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	イソプロピル
48	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	イソプロピル
49	H	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
50	H	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
51	H	Cl	H	iPr	プロパルギル
52	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
53	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
54	H	Cl	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
55	H	Me	H	CF ₃	プロパルギル
56	H	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
57	H	Me	H	iPr	プロパルギル
58	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
59	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
60	H	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
61	メチル	Cl	H	CF ₃	プロパルギル
62	メチル	Cl	H	CHF ₂	プロパルギル
63	メチル	Cl	H	iPr	プロパルギル
64	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
65	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
66	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
67	メチル	Me	H	CF ₃	プロパルギル
68	メチル	Me	H	CHF ₂	プロパルギル
69	メチル	Me	H	iPr	プロパルギル

10

20

30

40

50

【表 4 - 3】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
70	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	プロパルギル
71	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	プロパルギル
72	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	プロパルギル
73	H	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
74	H	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
75	H	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
76	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
77	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
78	H	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
79	H	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
80	H	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
81	H	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
82	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
83	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
84	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
85	メチル	Cl	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
86	メチル	Cl	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
87	メチル	Cl	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
88	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
89	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
90	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
91	メチル	Me	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
92	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
93	メチル	Me	H	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
94	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル
95	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2,2-トリフルオロエチル
96	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2,2-トリフルオロエチル
97	H	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
98	H	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
99	H	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
100	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
101	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
102	H	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
103	H	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
104	H	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
105	H	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル

10

20

30

40

50

【表 4 - 4】

指数	R ²	R ³	R ⁴	R ⁷	R ¹
106	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
107	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
108	H	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
109	メチル	Cl	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
110	メチル	Cl	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
111	メチル	Cl	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
112	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
113	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
114	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
115	メチル	Me	H	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
116	メチル	Me	H	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
117	メチル	Me	H	iPr	2,2-ジフルオロエチル
118	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	2,2-ジフルオロエチル
119	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	2,2-ジフルオロエチル
120	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	2,2-ジフルオロエチル
121	H	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
122	H	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
123	H	Cl	H	iPr	シクロプロピル
124	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
125	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
126	H	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
127	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
128	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
129	H	Me	H	iPr	シクロプロピル
130	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
131	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
132	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
133	メチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピル
134	メチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピル
135	メチル	Cl	H	iPr	シクロプロピル
136	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
137	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
138	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
139	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピル
140	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピル
141	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピル

10

20

30

40

50

【表 4 - 5】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
142	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
143	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピル
144	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピル
145	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
146	H	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
147	H	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
148	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
149	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
150	H	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
151	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
152	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
153	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
154	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
155	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
156	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
157	メチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
158	メチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
159	メチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
160	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
161	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
162	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
163	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
164	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
165	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロプロピル
166	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
167	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロプロピル
168	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロプロピル
169	H	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
170	H	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
171	H	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
172	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
173	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
174	H	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
175	H	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
176	H	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
177	H	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 4 - 6】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
178	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
179	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
180	H	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
181	メチル	Cl	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
182	メチル	Cl	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
183	メチル	Cl	H	iPr	1-シアノシクロブチル
184	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
185	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
186	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
187	メチル	Me	H	CF ₃	1-シアノシクロブチル
188	メチル	Me	H	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
189	メチル	Me	H	iPr	1-シアノシクロブチル
190	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロブチル
191	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1-シアノシクロブチル
192	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1-シアノシクロブチル
193	H	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
194	H	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
195	H	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
196	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
197	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
198	H	Cl	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
199	H	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
200	H	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
201	H	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
202	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
203	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
204	H	Me	メトキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル

10

20

30

40

50

【表 4 - 7】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
205	メチル	Cl	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
206	メチル	Cl	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
207	メチル	Cl	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
208	メチル	Cl	メキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
209	メチル	Cl	メキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
210	メチル	Cl	メキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
211	メチル	Me	H	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
212	メチル	Me	H	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
213	メチル	Me	H	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
214	メチル	Me	メキシメチル	CF ₃	3,3-ジフルオロシクロブチル
215	メチル	Me	メキシメチル	CHF ₂	3,3-ジフルオロシクロブチル
216	メチル	Me	メキシメチル	iPr	3,3-ジフルオロシクロブチル
217	H	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
218	H	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
219	H	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
220	H	Cl	メキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
221	H	Cl	メキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
222	H	Cl	メキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
223	H	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
224	H	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
225	H	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル

10

20

30

40

50

【表 4 - 8】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
					イル
226	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
227	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
228	H	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
229	メチル	Cl	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
230	メチル	Cl	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
231	メチル	Cl	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
232	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
233	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
234	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
235	メチル	Me	H	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
236	メチル	Me	H	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
237	メチル	Me	H	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
238	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
239	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
240	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	1,1-ジオキソチエタン-3-イル
241	H	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
242	H	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
243	H	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
244	H	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
245	H	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
246	H	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
247	H	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
248	H	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル

10

20

30

40

50

【表 4 - 9】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
249	H	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
250	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
251	H	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
252	H	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
253	メチル	Cl	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
254	メチル	Cl	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
255	メチル	Cl	H	iPr	シクロプロピルメチル
256	メチル	Cl	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
257	メチル	Cl	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
258	メチル	Cl	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
259	メチル	Me	H	CF ₃	シクロプロピルメチル
260	メチル	Me	H	CHF ₂	シクロプロピルメチル
261	メチル	Me	H	iPr	シクロプロピルメチル
262	メチル	Me	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピルメチル
263	メチル	Me	メトキシメチル	CHF ₂	シクロプロピルメチル
264	メチル	Me	メトキシメチル	iPr	シクロプロピルメチル
265	H	Me	H	CF ₃	2-ビスクロ[1.1.1]ペンタニル
266	H	Me	H	CF ₃	4-エチルチアゾール-5-イル
267	H	Me	H	CF ₃	(1,3-ジヒドロイソペンゾフラン-5-イル)メチル
268	H	Me	H	CF ₃	3-オキソ-2-(2,2-トリフルオロエチル)イソキサゾリジン-4-イル
269	H	Me	H	CF ₃	2-(2-フルオロフェノキシ)エチル
270	H	Me	H	CF ₃	6-メトキシ-2-メチル-ヘキサ-3-イン-2-イル
271	H	Me	H	CF ₃	1-シクロプロピルエチル
272	H	Me	H	CF ₃	1-(2-エチルチアゾール-4-イル)エチル
273	H	Me	H	CF ₃	2-フルオロ 3-シアノフェニル
274	H	Me	H	CF ₃	ベンジル
275	H	Me	H	CF ₃	1-(3-ピリジル)エチル
276	H	Me	メトキシメチル	CF ₃	3-オキソ-2-エチルイソキサゾリジン-4-イル

10

20

30

40

50

【表 4 - 1 0】

指数	R ²	R ³	R ⁶	R ⁷	R ¹
277	H	Br	メトキシメチル	CF ₃	シクロプロピル
278	H	Br	メトキシメチル	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
279	H	Br	H	CF ₃	シクロプロピル
280	H	Br	H	CF ₃	1-シアノシクロプロピル
281	H	Br	H	CF ₃	3-オキソ-2-エチルイソキサゾリジン-4-イル
282	H	Br	H	CF ₃	2,2,2-トリフルオロエチル

10

【 0 1 7 9 】

20

30

40

50

【表 5 - 1】

表 5: 54 種の式(I-5a)の化合物が提供されており、ここで、置換基 R¹、R³、X、Y 及び Z は以下の各行に示されている:

指数	Z	X	Y	R ¹	R ³
1	CH	CH	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Cl
2	CH	CH	N	シクロプロピル	Cl
3	CH	CH	N	1-シアノシクロプロピル	Cl
4	CH	N	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Cl
5	CH	N	CH	シクロプロピル	Cl
6	CH	N	CH	1-シアノシクロプロピル	Cl
7	CH	N	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Cl
8	CH	N	N	シクロプロピル	Cl
9	CH	N	N	1-シアノシクロプロピル	Cl
10	N	CH	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Cl
11	N	CH	CH	シクロプロピル	Cl
12	N	CH	CH	1-シアノシクロプロピル	Cl
13	N	CH	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Cl
14	N	CH	N	シクロプロピル	Cl
15	N	CH	N	1-シアノシクロプロピル	Cl
16	N	N	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Cl
17	N	N	CH	シクロプロピル	Cl
18	N	N	CH	1-シアノシクロプロピル	Cl
19	CH	CH	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Br
20	CH	CH	N	シクロプロピル	Br
21	CH	CH	N	1-シアノシクロプロピル	Br
22	CH	N	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Br
23	CH	N	CH	シクロプロピル	Br
24	CH	N	CH	1-シアノシクロプロピル	Br
25	CH	N	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Br
26	CH	N	N	シクロプロピル	Br
27	CH	N	N	1-シアノシクロプロピル	Br
28	N	CH	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Br
29	N	CH	CH	シクロプロピル	Br
30	N	CH	CH	1-シアノシクロプロピル	Br
31	N	CH	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Br
32	N	CH	N	シクロプロピル	Br
33	N	CH	N	1-シアノシクロプロピル	Br

10

20

30

40

50

【表 5 - 2】

指数	Z	X	Y	R ¹	R ³
34	N	N	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Br
35	N	N	CH	シクロプロピル	Br
36	N	N	CH	1-シアノシクロプロピル	Br
37	CH	CH	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Me
38	CH	CH	N	シクロプロピル	Me
39	CH	CH	N	1-シアノシクロプロピル	Me
40	CH	N	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Me
41	CH	N	CH	シクロプロピル	Me
42	CH	N	CH	1-シアノシクロプロピル	Me
43	CH	N	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Me
44	CH	N	N	シクロプロピル	Me
45	CH	N	N	1-シアノシクロプロピル	Me
46	N	CH	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Me
47	N	CH	CH	シクロプロピル	Me
48	N	CH	CH	1-シアノシクロプロピル	Me
49	N	CH	N	2,2,2-トリフルオロエチル	Me
50	N	CH	N	シクロプロピル	Me
51	N	CH	N	1-シアノシクロプロピル	Me
52	N	N	CH	2,2,2-トリフルオロエチル	Me
53	N	N	CH	シクロプロピル	Me
54	N	N	CH	1-シアノシクロプロピル	Me

10

20

30

【0180】

特定の中間体化合物も提供され、そのいくつかは、新規である。

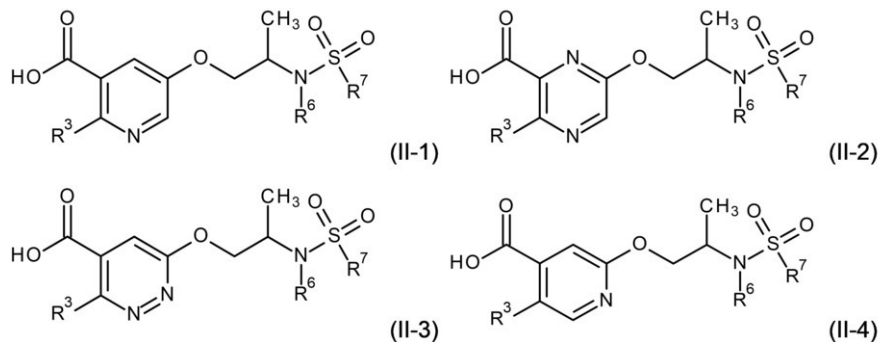
【0181】

従って、本明細書では、以下が提供される：

A．式(II-1)、(II-2)、(II-3)及び(II-4)の化合物(式中、R³、R⁶及びR⁷は、それぞれ表1～5で定義されているとおりである)。

【化43】

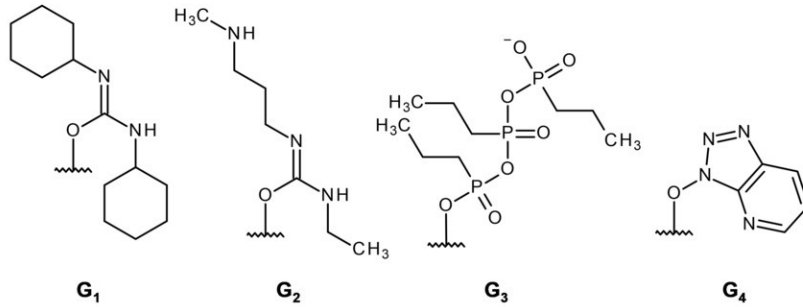
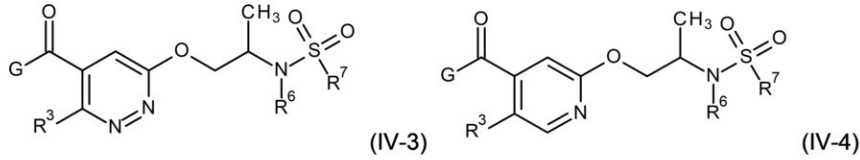
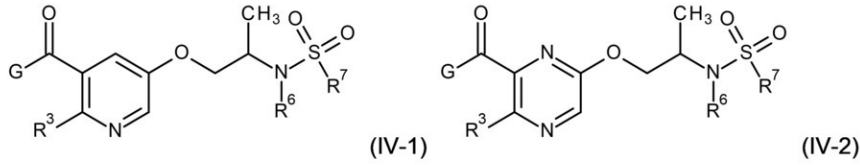
40



50

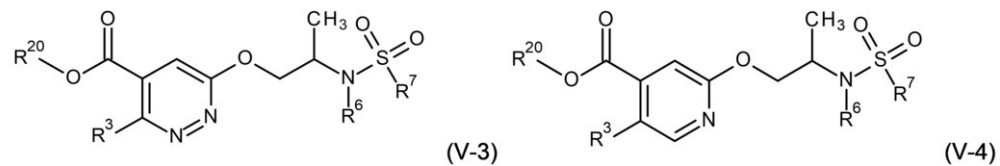
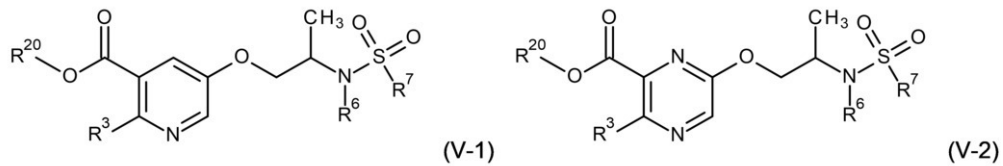
B. 式 (IV-1)、(IV-2)、(IV-3) 及び (IV-4) の化合物 (式中、 R^3 、 R^6 及び R^7 は、それぞれ表 1 ~ 5 で定義されているとおりであり、及び G は、ハロゲン又は $G_1 \sim G_4$ である)。

【化 4 4】



C. 式 (V-1)、(V-2)、(V-3) 及び (V-4) の化合物 (式中、 R^3 、 R^6 及び R^7 は、表 1 ~ 5 で定義されているとおりであり、及び R^{20} は、メチル又はエチルである)。

【化 4 5】



D. 式 (VI-1)、(VI-2)、(VI-3) 及び (VI-4) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 は、それぞれ表 1 ~ 5 で定義されているとおりであり、及び R^{20} は、メチル又はエチルである)。

10

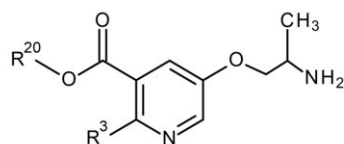
20

30

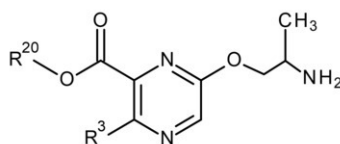
40

50

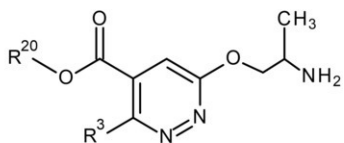
【化 4 6】



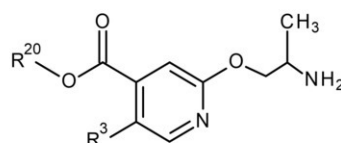
(VI-1)



(VI-2)



(VI-3)

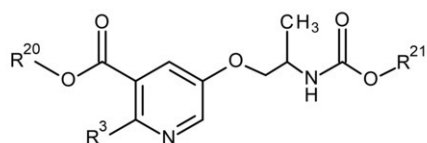


(VI-4)

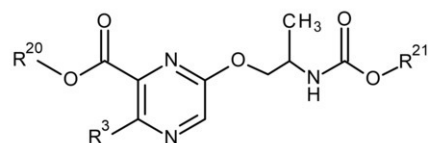
10

E. 式 (VIII-1)、(VIII-2)、(VIII-3) 及び (VIII-4) の化合物 (式中、 R^3 は、それぞれ表 1 ~ 5 で定義されているとおりであり、及び R^{20} は、メチルであると共に、 R^{21} は、メチル又はエチルであるか；又は R^{20} は、エチルであると共に、 R^{21} は、メチル又はエチルである)。

【化 4 7】

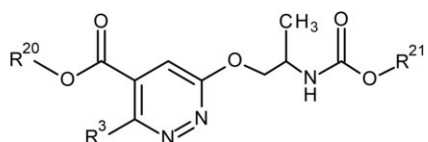


(VIII-1)

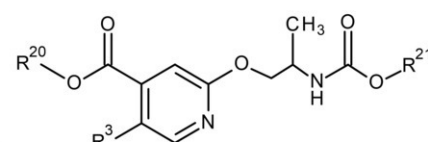


(VIII-2)

20



(VIII-3)

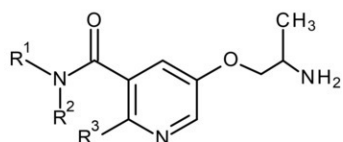


(VIII-4)

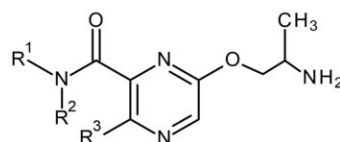
F. 式 (XIII-1)、(XIII-2)、(XIII-3) 及び (XIII-4) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 は、それぞれ表 1 ~ 5 で定義されているとおりである)。

30

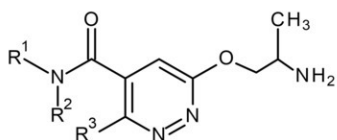
【化 4 8】



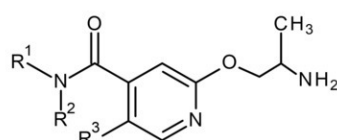
(XIII-1)



(XIII-2)



(XIII-3)



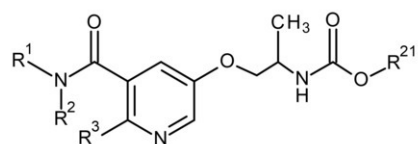
(XIII-4)

40

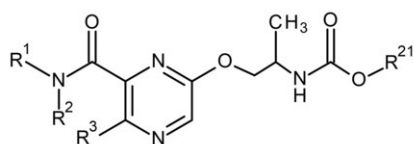
G. 式 (XIV-1)、(XIV-2)、(XIV-3) 及び (XIV-4) の化合物 (式中、 R^1 、 R^2 及び R^3 は、それぞれ表 1 ~ 5 で定義されているとおりであり、及び R^{21} は、メチル又はエチルである)。

50

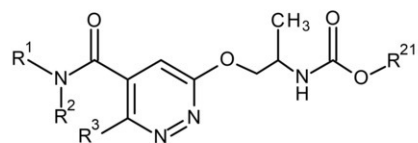
【化 4 9】



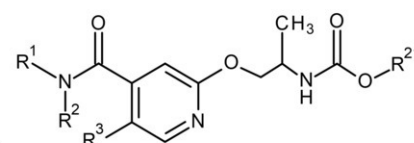
(XIV-1)



(XIV-2)



(XIV-3)

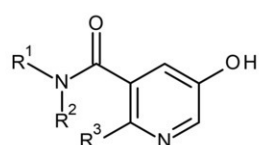


(XIV-4)

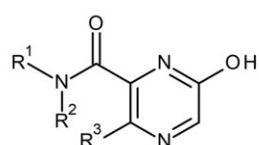
10

H. 式 (XV - 1)、(XV - 2)、(XV - 3) 及び (XV - 4) の化合物 (式中、R¹、R² 及び R³ は、表 1 ~ 5 で定義されているとおりである)。

【化 5 0】

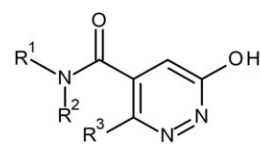


(XV-1)

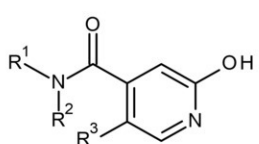


(XV-2)

20



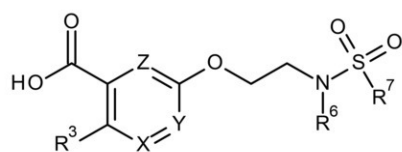
(XV-3)



(XV-4)

I. 式 (II - 5) の化合物 (式中、X、Y、Z、R³、R⁶ 及び R⁷ は、表 5 で定義されているとおりである)。

【化 5 1】



(II-5)

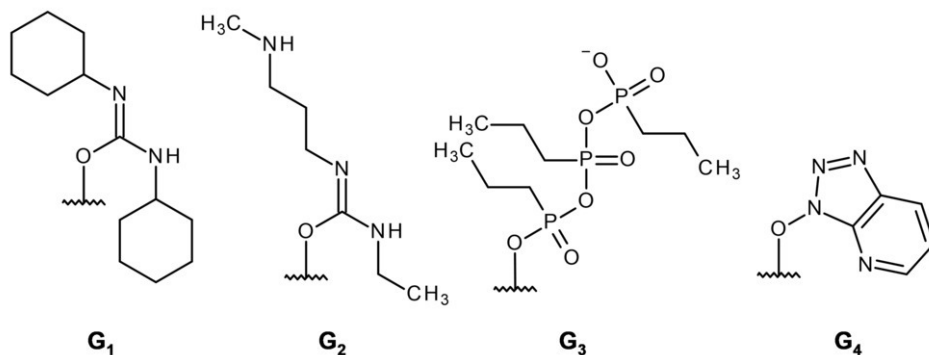
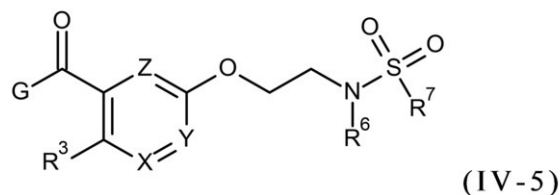
30

J. 式 (IV - 5) の化合物 (式中、X、Y、Z、R³、R⁶ 及び R⁷ は、表 5 で定義されているとおりであり、及び G は、ハロゲン又は G₁ ~ G₄ である)。

40

50

【化 5 2】

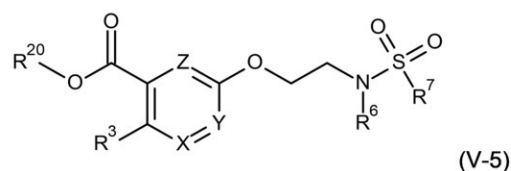


10

K．式（V-5）の化合物（式中、X、Y、Z、R³、R⁶及びR⁷は、表5で定義されているとおりであり、及びR²⁰は、メチル又はエチルである）。

20

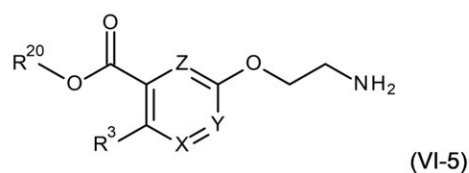
【化 5 3】



L．式（VI-5）の化合物（式中、X、Y、Z及びR³は、表5で定義されているとおりであり、及びR²⁰は、メチル又はエチルである）。

30

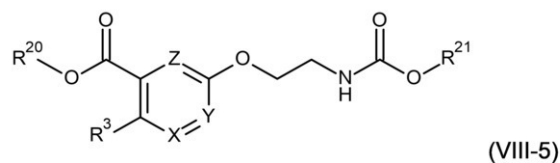
【化 5 4】



M．式（VII-5）の化合物（式中、X、Y、Z及びR³は、表5で定義されているとおりであり、及びR²⁰は、メチルであると共に、R²¹は、メチル又はエチルであるか；又はR²⁰は、エチルであると共に、R²¹は、メチル又はエチルである）。

40

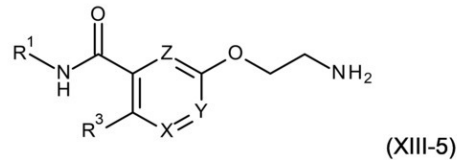
【化 5 5】



N．式（XII-5）の化合物（式中、X、Y、Z、R¹及びR³は、表5で定義されているとおりである）。

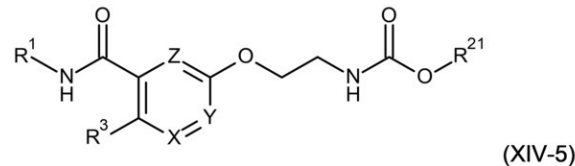
50

【化 5 6】



○式 (XIV-5) の化合物 (式中、X、Y、Z、R¹ 及び R³ は、表 5 で定義されているとおりであり、及び R²¹ は、メチル又はエチルである)。

【化 5 7】



【0182】

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

【0183】

上記の動物有害生物の例は、以下のとおりである：

ダニ目 (Acarina) から、例えば、

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

シラミ目 (Anoplura) から、例えば、
 ブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、リノグナツス属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.)、ペムフィグス属 (Pemphigus spp.) 及びフィロキセラ属 (Phylloxera spp.) ;

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

双翅目 (Diptera) から、例えば、
 ヤブカ属 (Aedes spp.)、ハマダラカ属 (Anopheles spp.)、アンテリゴナ・ソカタ (Antherigona soccata)、オリーブミバエ (Bactrocea oleae)、ビビオ・ホルツラヌス (Bibio hortulanus)、ブラジシア属 (Bradyisia spp.)、クロバエ (Calliphora erythrocephala)、セラチチス属 (Ceratitis spp.)、オビキンバエ属 (Chrysomyia spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、クテレブラ属 (Cuterebra spp.)、ダクス属 (Dacus spp.)、デリア属 (Delia spp.)、キイロショウジョウバエ (Drosophila melanogaster)、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.)、ガストロフィラス属 (Gastrophilus spp.)、ゲオミザ・トリプンクタタ (G 50

eomyza tripunctata)、ツエツエバエ属(*Glossina* spp.)、ヒフバエ属(*Hypoderma* spp.)、ヒッポボスカ属(*Hyppobosca* spp.)、リリオミザ属(*Liriomyza* spp.)、キンバエ属(*Lucilia* spp.)、メラナグロミザ属(*Melanagromyza* spp.)、イエバエ属(*Musca* spp.)、ヒツジバエ属(*Oestrus* spp.)、オルセオリア属(*Orseolia* spp.)、キモグリバエ(*Oscinella frit*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomyia hyoscyami*)、ホルビア属(*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属(*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ(*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属(*Scatella* spp.)、キノコバエ属(*Sciara* spp.)、サシバエ属(*Stomoxys* spp.)、アブ属(*Tabanus* spp.)、タニア属(*Tannia* spp.)及びガガンボ属(*Tipula* spp.);

半翅目(*Hemiptera*)から、例えば、

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

アシルトシウム・ピスム(*Acyrtosium pisum*)、アダルゲス属(*Adalges* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ(*Agalliana ensigera*)、アゴノセナ・タルギオニイ(*Agonosцена targionii*)、アレ
ウロジクス属(*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属(*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス(*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロックスス(*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ(*Aleyrodes brassicae*)、フタテンミドリヨコバイ(*Amarasca biguttula*)、ア
ムリトズス・アトキンソニ(*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ
属(*Aonidiella* spp.)、アリマキ科(*Aphididae*)、ワタアブ
ラムシ属(*Aphis* spp.)、アスピジオツス属(*Aspidiotus* spp)

.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バク
 テリセラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属
 (*Bemisia* spp)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus* spp)
 、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属
 (*Cacopsylla* spp)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella*
aegopodii Scop.)、セロプラスタ属 (*Ceroplaster* spp
 .)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、
 オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyosper*
mi)、シカデラ属 (*Cicadella* spp)、シロオオヨコバイ (*Cofana*
spectra)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus* spp)、シカデュリ 10
 ナ属 (*Cicadulina* spp)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus he*
speridum)、ダルブルスマイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレ
 ウロデス属 (*Dialeurodes* spp)、ミカンキジラミ (*Diaphorin*
a citri)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサ
 フィス属 (*Dysaphis* spp)、エンボアスカ属 (*Empoasca* spp.
 .)、リンゴワタムシ (*Eriosoma larigerum*)、エリスロネウラ属 (*E*
rythroneura spp.)、ガスカルジア属 (*Gascardia* spp.
 .)、グリカスピス・ブリンブレコンベイ (*Glycaspis brimblecomb*
ei)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudobra*
ssicae)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus* spp)、ヒペロミズス 20
 ・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバイ
 (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jacobi*
asca lybica)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax* spp.)、
 ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lep*
idosaphes spp.)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis ery*
simi)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフム
 属 (*Macrosiphum* spp.)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva* sp
 p)、メタカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウスイ
 ロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス
 (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus* spp.)、ネオトキシプテ 30
 ラ属 (*Neotoxoptera* sp)、ツماغロヨコバイ属 (*Nephotetti*
x spp.)、ニラパルバタ属 (*Nilaparvata* spp.)、ナシミドリオ
 オアブラムシ (*Nippolachnus piri* Mats)、オドナスピス・ルタ
 エ (*Odonaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Oregm*
a lanigera Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisi*
a myricae)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrioza cocke*
relli)、バルラトリア属 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属 (*Pemphigus*
spp.)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus mai*
dis)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella* spp)、ホップイボアブラ 40
 ムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera* s
 pp)、プラノコッカス属 (*Planococcus* spp.)、シュードウラカスピ
 ス属 (*Pseudaulacaspis* spp.)、シュードコッカス属 (*Pseud*
ococcus spp.)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis* s
eriatus)、プシラ属 (*Psylla* spp.)、ブルビナリア・エチオピカ (*Pulv*
inaria aethiopica)、クアドラズビジオツス属 (*Quadr*
aspidiotus spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)
 、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rhop*
alosiphum spp.)、サイセチア属 (*Saissetia* spp.)、ス
 カホイデウス属 (*Scaphoideus* spp.)、スチザフィス属 (*Schiza*
phis spp.)、シトビオン属 (*Sitobion* spp.)、セジロウンカ (50

Sogatella furcifera)、スピシスチルス・フェスチヌス (*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ (*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属 (*Toxoptera* spp.)、トリアレウロデス属 (*Trialeurodes* spp.)、トリジスカス・スポロボリ (*Tridiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus* spp.)、ミカントガリキジラミ (*Trioza erytreae*)、ニセヤノネカイガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina flamigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginidia scutellaris*) ;

膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えば、

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

等翅目 (*Isoptera*) から、例えば、

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

鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えば、

アクレリス属 (*Accleris* spp.)、アドキシフィエス属 (*Adoxophyes* spp.)、アエゲリア属 (*Aegeria* spp.)、アグロティス属 (*Agrotis* spp.)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillaceae*)、アミロイス属 (*Amylois* spp.)、アンチカルシア・ゲマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属 (*Archips* spp.)、アルギレスチア属 (*Argyresthia* spp.)、アルギロタエニア属 (*Argyrotaenia* spp.)、アウトグラファ属 (*Autographa* spp.)、ブクラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberielia*)、アフリカズイム (*Busseola fusca*)、スジマラダメイガ (*Cadra cautella*)、モモシンクイガ (*Carposina nipponensis*)、チロ属 (*Chilo* spp.)、コリストネウラ属 (*Choristoneura* spp.)、クリソテウチア・トピアリア (*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ (*Clysia ambiguella*)、クナファロクロシス属 (*Cnaphalocrocis* spp.)、クネファシア属 (*Cnephassia* spp.)、コチリス属 (*Cochylis* spp.)、コレオフォラ属 (*Coleophora* spp.)、コリアス・レスビア (*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ (*Cosmophila flava*)、クラムバス属 (*Crambus* spp.)、ケブカノメイガ (*Crocidolomia binotalis*)、クリプトフレビア・ロイコトレタ (*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ペルスペクトリス (*Cydalima perspectalis*)、シジア属 (*Cydia* spp.)、ジアファニア・ペルスペクトリス (*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属 (*Diatraea* spp.)、ジパロプシス・カスターネア (*Diparopsis castanea*)、エアリア

10

20

30

40

50

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

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

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

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

ノミ目 (Siphonaptera) から、例えば、
ナガノミ属 (Ceratophyllus spp.)、イヌノミ属 (Ctenocephalides spp.) 及びケオプスネズミノミ (Xenopsylla cheopis) ;

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

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

【0184】

さらなる態様では、本発明は、植物寄生性線虫 (内部寄生性 -、半内部寄生性 - 及び外部寄生性線虫)、特に根こぶ線虫、キタネコブセンチュウ (Meloidogyne hapla)、サツマイモネコブセンチュウ (Meloidogyne incognita)、ジャワネコブセンチュウ (Meloidogyne javanica)、アレナリアネコブセンチュウ (Meloidogyne arenaria) 及び他のメロイドギネ属 (Meloidogyne) の種 ; シスト形成線虫、ジャガイモシストセンチュウ (Globodera rostochiensis) 及び他のグロボデラ属の種 (Globodera) 種 ; ムギシストセンチュウ (Heterodera avenae)、ダイズシストセンチュウ (Heterodera glycines)、テンサイシストセンチュウ (Heterodera schachtii)、クローバシストセンチュウ (Heterodera trifolii) 及び他のシストセンチュウ属 (Heterodera) の種 ; シードガル (Seed gall) 線虫、アングイナ属 (Anguina) の種 ; クキセンチュウ及びハガレセンチュウ、アフエレンコイデス属 (Aphelenchoides) の種 ; 刺毛線虫 (Sting nematode)、ベロノライムスロンギカウダツス (Belonolaimus longicaudatus) 及び他のベロノライムス属 (Belonolaimus) の種 ; マツザイ線虫、マツノザイセンチュウ (Bursaphelenchus xylophilus) 及び他のブルサフェレンクス属 (Bursaphelenchus) の種 ; ワセンチュウ、クリコネマ (Criconema) 種、クリコネメラ (Criconemella) 種、クリコネモイデス (Criconemoides) 種、メソクリコネマ (Mesocriconema) 種 ; 茎及び鱗茎線虫、イモグサレセンチュウ (Ditylenchus destructor)、クキセンチュウ (Ditylenchus dipsaci) 及び他のジチレンクス属 (Ditylenchus) の種 ; キリセンチュウ、ドリコドルス (Dolichodorus) 種 ; ラセンセンチュウ、ヘリオコチレンクスムルチシンクツス (Helicotylenchus multicinctus) 及び他のヘリコチレンクス属 (Helicotylenchus) の種 ; サヤセンチュウ及びサヤワセンチュウ (Sheath and sheathoid nematode)、ヘミシクリオホラ属 (Hemicycliophora) 種及びヘミクリコネモイデス属 (Hemicriconemoides) 種 ; ヒルスマンニエラ属 (Hirshmanniella) の種 ; ヤリセンチュウ、ホプロアイムス属 (Hoploaimus) の種 ; ニセネコブセンチュウ、ナコブス属 (Nacobbus) の種 ; ハリセンチュウ、ロンギドルスエロンガツス (Longidorus elongatus) 及び他のロンギドルス属 (Longidorus) の種 ; ピンセンチュウ、ネグサレセンチュウ属 (Pratylenchus) の種 ;

10

20

30

40

50

ネグサレセンチュウ、ムギネグサレセンチュウ (*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)、ブラチレンクスクルビタツス (*Pratylenchus curvitatatus*)、ブラチレンクスグーデイ (*Pratylenchus goodeyi*) 及び他のネグサレセンチュウ属 (*Pratylenchus*) の種；ネモグリセンチュウ、バナナネモグリセンチュウ (*Radopholus similis*) 及び他のネモグリセンチュウ属 (*Radopholus*) の種；ニセフクロセンチュウ、ロチレンクスロブスツス (*Rotylenchus robustus*)、トチレンクスレニホルミス (*Rotylenchus reniformis*) 及び他のロチレンクス (*Rotylenchus*) 種；スクテロネマ属 (*Scutellonema*) の種；ユミハリ線虫、トリコドルスピリミチプス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) の種、パラトリトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) の種；イシュクセンチュウ、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコルヒンクスドゥビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコルヒンクス属 (*Tylenchorhynchus*) の種；ミカンネセンチュウ、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) の種；オオハリセンチュウ、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) の種などの植物寄生性線虫；並びにスバングイナ属の種 (*Subanguina* spp.)、ヒブソペリネ属の種 (*Hypsoperine* spp.)、マクロポストニア属の種 (*Macroposthonia* spp.)、メリニウス属の種 (*Melinius* spp.)、
 プンクトデラ属の種 (*Punctodera* spp.) 及びキニスルシウス属の種 (*Quinisulcius* spp.) などの他の植物寄生性線虫種による植物及びその一部に対する損害を防止する方法にも関し得る。

【0185】

本発明の化合物は、軟体動物に対しても活性を有し得る。その例としては、例えば、スクミリンゴガイ科 (*Ampullariidae*)；アリオン属 (*Arion*) (コウラクロナメクジ (*A. ater*)、*A. circumscriptus*)、*A. hortensis*)、*A. rufus*)；オナジマイマイ科 (*Bradybaenidae*) (ブラジバエナフルチクム (*Bradybaena fruticum*))；オウシュウマイマイ属 (*Cepaea*) (ニワノオウシュウマイマイ (*C. hortensis*)、モリマイマイ (*C. nemoralis*))；オクロジナ (*Ochlodina*)；デロセラス属 (*Deroceas*) (*D. agrestis*)、*D. empiricorum*)、*D. laeve*)、*D. reticulatum*)；ディスクス属 (*Discus*) (*D. rotundatus*)；ユーオムファリア属 (*Euomphalia*)；ガルバ属 (*Galba*) (*G. trunculata*)；ヘリセリア属 (*Helicella*) (*H. italica*)、*H. obvia*)；マイマイ科 (*Helicidae*) (ヘリシゴナルブストルム (*Helicigona arbustorum*))；ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*)；
 ヘリクス属 (*Helix*) (*H. aperta*)；リマックス属 (*Limax*) (*L. cinereoniger*)、*L. flavus*)、*L. marginatus*)、*L. maximus*)、*L. tenellus*)；モノアラガイ属 (*Lymnaea*)；ミラックス属 (*Milax*) (ニワコウラナメクジ (*M. gagates*)、*M. marginatus*)、*M. sowerbyi*)；オペアス属 (*Opeas*)；リンゴガイ属 (*Pomacea*) (スクミリンゴガイ (*P. canaticulata*))；ミジンマイマイ属 (*Valtonia*) 及びザニトイデス属 (*Zanitoidea*) が挙げられる。

【0186】

本発明に係る有効成分は、特に植物、特に有用な植物及び農業、園芸及び森林における観賞植物又はこのような植物の果実、花、葉、茎、塊茎又は根などの器官で発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合により後の時点で形成される植物器官でもこれらの有害生物から保護されたままである。

【0187】

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

10

【0188】

特定の実施形態では、式 (I) の化合物は、野菜（特にトマト及びウリ科植物）、柑橘類、仁果、石果、高木堅果、綿、熱帯作物、アボカド、観賞植物、インゲンマメ、ダイズ、イチゴ及びブドウから選択される作物、樹木及び植物におけるダニ、サビダニ及びハダニを防除可能である。

20

【0189】

本発明の組成物及び／又は方法は、花、灌木、闊葉樹及び常緑樹を含むいずれかの観賞用及び／又は野菜作物でも用いられ得る。

【0190】

例えば、本発明は、以下の観賞用種：アゲラタム属の種 (Ageratum spp.)、アロンソア属の種 (Alonsoa spp.)、アネモネ属の種 (Anemone spp.)、アニソドンテアカプセニシス (Anisodonteacapsenis) 30、アンテミス属の種 (Anthemisspp.)、アンチルリヌム属の種 (Antirrhinum spp.)、アステル属の種 (Aster spp.)、ベゴニア属の種 (Begonia spp.) (例えば、B. エラチオール (B. elatior)、B. セムペルフロレンス (B. semperflorens)、B. チュベレウクス (B. tubereux))、ブーゲンビレア属の種 (Bougainvillea spp.)、ブラキコメ属の種 (Brachycome spp.)、ブラシカ属の種 (Brassica spp.) (観賞用)、カルセオラリア属の種 (Calceolaria spp.)、トウガラシ (Capsicum annuum)、ニチニチソウ (Catharanthus roseus)、カンナ属の種 (Canna spp.)、ヤグルマギク属の種 (Centauarea spp.)、キク属の種 (Chrysanthemum spp.)、シネラリア属の種 (Cineraria spp.) (C. マリチメ (C. maritima))、コレオプシス属の種 (Coreopsis spp.)、クラッスラコッキネア (Crassula coccinea)、タバコソウ (Cuphea ignea)、ダリア属の種 (Dahlia spp.)、デルフィニウム属の種 (Delphinium spp.)、ケマンソウ (Dicentra spectabilis)、ドロテアンツス属の種 (Dorotheantus spp.)、トルコギキョウ (Eustoma grandiflorum)、レンギョウ属の種 (Forsythia spp.)、フクシア属の種 (Fuchsia spp.)、ゼラニウムグナファリウム (Geranium gnaphalium)、ガーベラ属の種 (Gerbera spp.)、センニチコウ (Gomphrena globosa)、ヘリオ 50

30

40

50

トロピウム属の種 (*Heliotropium* spp.)、ヘリアンthus属の種 (*Helianthus* spp.)、ハイビスカス属の種 (*Hibiscus* spp.)、ホルテンシア属の種 (*Hortensia* spp.)、ハイドランジア属の種 (*Hydrangea* spp.)、ヒポエステスフィロスタシア (*Hypoestes phyllostachya*)、インパチエンス属の種 (*Impatiens* spp.) (アフリカハウセンカ (*I. Walleriana*))、イレスネス属の種 (*Iresine* spp.)、カランコエ属の種 (*Kalanchoe* spp.)、ランタナ (*Lantana camara*)、ハナアオイ (*Lavatera trimestris*)、カエンキセワタ (*Leonotis leonurus*)、ユリ属の種 (*Lilium* spp.)、メセンムリアンテマム属の種 (*Mesembryanthemum* spp.)、ミムラス属の種 (*Mimulus* spp.)、ヤグルマハッカ属の種 (*Monarda* spp.)、ネメシア属の種 (*Nemesia* spp.)、タゲテス属の種 (*Tagetes* spp.)、ダイアンサス属の種 (*Dianthus* spp.) (カーネーション)、カンナ属の種 (*Canna* spp.)、オキザリス属の種 (*Oxalis* spp.)、ベリス属の種 (*Bellis* spp.)、ペラルゴニウム属の種 (*Pelargonium* spp.) (アイビーゼラニウム (*P. peltatum*))、モンテンジクアオイ (*P. Zonale*)、スミレ属の種 (*Viola* spp.) (パンジー)、ペチュニア属の種 (*Petunia* spp.)、フロックス属の種 (*Phlox* spp.)、プレクトランツス属の種 (*Plecthranthus* spp.)、ポインセチア属の種 (*Poinsettia* spp.)、バルテノキスス属の種 (*Parthenocissus* spp.) (アメリカツタ (*P. quinquefolia*))、ツタ (*P. tricuspidata*)、プリムラ属の種 (*Primula* spp.)、キンボウゲ属 (*Ranunculus* spp.)、ツツジ属の種 (*Rhododendron* spp.)、バラ属の種 (*Rosa* spp.) (バラ)、ルドベキア属の種 (*Rudbeckia* spp.)、アフリカスミレ属の種 (*Saintpaulia* spp.)、サルビア属の種 (*Salvia* spp.)、スカエボラアエモラ (*Scaevola aemola*)、シザンサスウィセトネンシス (*Schizanthus wisetonensis*)、セダム属の種 (*Sedum* spp.)、ナス属の種 (*Solanum* spp.)、スルフィニア属の種 (*Surfinia* spp.)、タゲテス属の種 (*Tagetes* spp.)、ニコチニア属の種 (*Nicotiana* spp.)、バーベナ属の種 (*Verbena* spp.)、ヒャクニチソウ属の種 (*Zinnia* spp.) 及び他の花壇用植物のいずれかで用いられ得る。

【0191】

例えば、本発明は、以下の野菜種：ネギ属の種 (*Allium* spp.) (ニンニク (*A. sativum*))、タマネギ (*A. cepa*)、エシャロット (*A. oschaninii*)、リーキ (*A. Porrum*)、ワケギ (*A. ascalonicum*)、ネギ (*A. fistulosum*)、チャービル (*Anthriscus cerefolium*)、セロリ (*Apium graveolus*)、アスパラガス (*Asparagus officinalis*)、ビート (*Beta vulgaris*)、ブラシカ属の種 (*Brassica* spp.) (ヤセイカンラン (*B. Oleracea*))、ハクサイ (*B. Pekinensis*)、カブ (*B. rapa*)、トウガラシ (*Capsicum annuum*)、ヒヨコマメ (*Cicer arietinum*)、エンダイブ (*Cichorium endivia*)、チコルム属の種 (*Cichorum* spp.) (チコリー (*C. intybus*))、エンダイブ (*C. endivia*)、スイカ (*Citrillus lanatus*)、ククミス属の種 (*Cucumis* spp.) (サフラン (*C. sativus*))、メロン (*C. melo*)、ククルビタ属の種 (*Cucurbita* spp.) (ペボカボチャ (*C. pepo*))、西洋カボチャ (*C. maxima*)、シアナラ属の種 (*Cyanara* spp.) (アーティチョーク (*C. scolymus*))、カルドン (*C. cardunculus*)、ニンジン (*Daucus carota*)、フェンネル (*Foeniculum vulgare*)、

オトギリソウ属の種 (*Hypericum* spp.)、レタス (*Lactuca sativa*)、トマト属の種 (*Lycopersicon* spp.) (トマト (*L. esculentum*))、トマト (*L. lycopersicum*)、ハッカ属の種 (*Mentha* spp.)、バジル (*Ocimum basilicum*)、パセリ (*Petroselinum crispum*)、インゲンマメ属の種 (*Phaseolus* spp.) (ムシトリスミレ (*P. vulgaris*))、ベニバナインゲン (*P. coccineus*)、エンドウ (*Pisum sativum*)、ダイコン (*Raphanus sativus*)、マルバダイオウ (*Rheum rhaponticum*)、マンネンロウ属の種 (*Rosemarinus* spp.)、サルビア属の種 (*Salvia* spp.)、キバナバラモンジン (*Scorzonera hispanica*)、ナス (*Solanum melongena*)、ホウレンソウ (*Spinacea oleracea*)、バレリアネラ属の種 (*Valerianella* spp.) (ノヂシャ (*V. locusta*))、*V. エリオカルパ* (*V. eriocarpa*) 及びソラマメ (*Vicia faba*) のいずれかで用いられ得る。

【0192】

好ましい観賞用種としては、セントポーリア、ペゴニア、ダリア、ガーベラ、アジサイ、クマツヅラ、バラ属 (*Rosa*)、カランコエ属 (*Kalanchoe*)、ポインセチア、アスター、ヤグルマギク属 (*Centaurea*)、キンケイギク属 (*Coreopsis*)、ヒエンソウ属 (*Delphinium*)、ヤグルマハッカ属 (*Monarda*)、フロックス属 (*Phlox*)、ルドベキア属 (*Rudbeckia*)、セダム属 (*Sedum*)、ペチュニア、ビオラ属 (*Viola*)、ホウセンカ、ゼラニウム、キク属 (*Chrysanthemum*)、キンボウゲ属 (*Ranunculus*)、フクシア、サルビア、セイヨウアジサイ、ローズマリー、セージ、セイヨウオトギリソウ、ミント、シシトウガラシ、トマト及びキュウリが挙げられる。

【0193】

式 (I) の化合物は、ダニ、ハダニ及びサビダニ、例えばアカラピス属の種 (*Acarapis* spp.) ; アカリンダニ (*Acarapis woodi*) ; アシフトコナダニ (*Acarus siro*) ; アカルス属の種 (*Acarus* spp.) ; アケリアシェルドニ (*Aceria sheldoni*) ; ミカンサビダニ (*Aculops pekassii*) ; アクロプス属の種 (*Aculops* spp.) ; リンゴサビダニ (*Aculus schlechtendali*) ; アカルス属の種 (*Aculus* spp.) ; アムブリセイウスファラシス (*Amblyseius fallacis*) ; プレビパルプス属の種 (*Brevipalpus* spp.) ; ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*) ; クローバーハダニ (*Bryobia praetiosa*) ; ニセクローバピラハダニ (*Bryobia rubrioculus*) ; ゴミコナダニ属の種 (*Caloglyphus* spp.) ; ネコツメダニ (*Cheyletiella blakei*) ; ツメダニ属の種 (*Cheyletiella* spp.) ; イヌツメダニ (*Cheyletiella yasguri*) ; ウシシヨクヒヒゼンダニ (*Chorioptes bovis*) ; シヨクヒヒゼンダニ属の種 (*Chorioptes* spp.) ; シトジテス属の種 (*Cytodites* spp.) ; ウシニキビダニ (*Demodex bovis*) ; デモデクスカバリ (*Demodex caballi*) ; イヌニキビダニ (*Demodex canis*) ; ヤギニキビダニ (*Demodex caprae*) ; ウマニキビダニ (*Demodex equi*) ; ヒツジニキビダニ (*Demodex ovis*) ; ニキビダニ属の種 (*Demodex* spp.) ; ブタニキビダニ (*Demodex suis*) ; ワクモ (*Dermanyssus gallinae*) ; デルマニッスス属の種 (*Dermanyssus* spp.) ; エオテトラニカス属の種 (*Eotetranychus* spp.) ; エオテトラニクスウィラメッテイ (*Eotetranychus willamettei*) ; ナシサビダニ (*Epitriemerus pyri*) ; エリオフィエスリビス (*Eriophyes ribis*) ; エリオフィエス属の種 (*Eriophyes* spp.) ; エリオフィエスピチス (*Er*

iophyes vitis) ; エウテトラニクス属の種 (*Eutetranychus* spp.) ; ハロチデウスデストルクトル (*Halotydeus destructor*) ; ヘミタルソネムス属の種 (*Hemitarsonemus* spp.) ; クネミドコブテス属の種 (*Knemidocoptes* spp.) ; ラミノシオブテス属の種 (*Laminosioptes* spp.) ; リストロホルス属の種 (*Listrophorus* spp.) ; ミオビア属の種 (*Myobia* spp.) ; ネオションガスチアキセロテルモビア (*Neoschongastia xerothermobia*) ; ヨーロッパアキダニ (*Neotrombicula autumnalis*) ; ネオトロニビクラデサレリ (*Neotrombicula desaleri*) ; ネコショウヒゼンダニ (*Notoedres cati*) ; ノトエドレス属の種 (*Notoedres* spp.) ; マンゴーハダニ (*Oligonychus coffeae*) ; オリゴニクスイリチス (*Oligonychus ilicis*) ; オリゴニクス属の種 (*Oligonychus* spp.) ; オルニトケイレチア属の種 (*Ornithocheyletia* spp.) ; オルニトニススブルサ (*Ornithonyssus bursa*) ; イエダニ属の種 (*Ornithonyssus* spp.) ; オルニトニススシルビアアルム (*Ornithonyssus sylviarum*) ; イヌミミヒゼンダニ (*Otodectes cynotis*) ; ミミヒゼンダニ属の種 (*Otodectes* spp.) ; ミカンハダニ (*Panonychus citri*) ; パノニクス属の種 (*Panonychus* spp.) ; リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*) ; ミカンサビダニ (*Phyllocopttruta oleivora*) ; フィロコブツルタ属の種 (*Phyllocopttruta* spp.) ; フィトセイウルス属の種 (*Phytoseiulus* spp.) ; イヌハナダニ (*Pneumonyssoides caninum*) ; チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) ; ポリファゴタルソネムス属の種 (*Polyphagotarsonemus* spp.) ; ブソレルガテスオビス (*Psorergates ovis*) ; ヒツジツメダニ属の種 (*Psorergates* spp.) ; ウサギキュウセンヒダニ (*Psoroptes cuniculi*) ; ウマキュウセンヒダニ (*Psoroptes equi*) ; ヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*) ; キュウセンヒゼンダニ属の種 (*Psoroptes* spp.) ; プテロリクス属の種 (*Pterolichus* spp.) ; ライリエチア属の種 (*Raillietia* spp.) ; リゾグリフス属の種 (*Rhizoglyphus* spp.) ; サルコブテスボビス (*Sarcoptes bovis*) ; イヌセンコウヒゼンダニ (*Sarcoptes canis*) ; ヤギヒゼンダニ (*Sarcoptes caprae*) ; サルコブテスエクイ (*Sarcoptes equi*) ; サルコブテスオビス (*Sarcoptes ovis*) ; サルコブテスルピカブラエ (*Sarcoptes rupicaprae*) ; サルコブテス属の種 (*Sarcoptes* spp.) ; サルコブテススイス (*Sarcoptes suis*) ; ステネオタルソネムススピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*) ; ステネオタルソネムス属の種 (*Steneotarsonemus* spp.) ; ステルノストマ属の種 (*Sternostoma* spp.) ; ホコリダニ属の種 (*Tarsonemus* spp.) ; ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*) ; カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*) ; テトラニクス属の種 (*Tetranychus* spp.) ; ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) ; アカツツガムシ (*Trombicula akamushi*) ; ツツガムシ属の種 (*Trombicula* spp.) ; チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) ; ケナガコナダニ属の種 (*Tyrophagus* spp.) ; ミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*) ; バロア属の種 (*Varroa* spp.) ; バサテスリコペルシシ (*Vasates lycopersici*) ; 及びゼッツェリアマリ (*Zetzellia mali*) の防除に特に好適であり得る。

【0194】

一実施形態では、式 (I) の化合物は、以下の 1 種以上を防除し得る：アケリアシェルドニ (*Aceria sheldoni*)；アカルスリコペルシチ (*Aculus lycopersici*)；アクルスペレカッシ (*Aculus pelekassii*)；リングサビダニ (*Aculus schlechtendali*)；ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)；ブレビパルプス属の種 (*Brevipalpus* spp.)；ニセクロバピラハダニ (*Bryobia rubrioculus*)；エオテトラニクスカッピニ (*Eotetranychus carpini*)；エオテトラニクス属の種 (*Eotetranychus* spp.)；ナシサビダニ (*Epitimerus pyri*)；エリオフィエスピリ (*Eriophyes piri*)；エリオフィエス属の種 (*Eriophyes* spp.)；エリオフィエスピチス (*Eriophyes vitis*)；トウヨウハダニ (*Eutetranychus africanus*)；エウテトラニクスオリエンタリス (*Eutetranychus orientalis*)；オリゴニクスプラテンシス (*Oligonychus pratensis*)；ミカンハダニ (*Panonychus citri*)；リングハダニ (*Panonychus ulmi*)；フィロコプテスピチス (*Phyllocoptes vitis*)；ミカンサビダニ (*Phyllocoptetruta oleivora*)；チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)；ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)；カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)；テトラニクス属の種 (*Tetranychus* spp.)；及びナミハダニ (*Tetranychus urticae*)。

【0195】

さらなる実施形態では、式 (I) の化合物は、以下の 1 種以上の防除に特に好適であり得る：アケリアシェルドニ (*Aceria sheldoni*)；アカルススペレカッシ (*Aculus pelekassii*)；ミナミヒメハダニ (*Brevipalpus phoenicis*)；ブレビパルプス属の種 (*Brevipalpus* spp.)；エリオフィエスピリ (*Eriophyes piri*)；エリオフィエスピチス (*Eriophyes vitis*)；トウヨウハダニ (*Eutetranychus africanus*)；エウテトラニクスオリエンタリス (*Eutetranychus orientalis*)；オリゴニクスプラテンシス (*Oligonychus pratensis*)；リングハダニ (*Panonychus ulmi*)；フィロコプテスピチス (*Phyllocoptes vitis*)；ミカンサビダニ (*Phyllocoptetruta oleivora*)；チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)；ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)；カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)；テトラニクス属の種 (*Tetranychus* spp.)；及びナミハダニ (*Tetranychus urticae*)。

【0196】

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

【0197】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌 (*Bacillus cereus*) 又はバチルス・ポピリエ (*Bacillus popilliae*) に由来する殺虫タンパク質；又は δ -エンドトキシン、例えば Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 又は Cry9C など、バチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) に由来する殺虫タンパク質又は植物性殺虫タンパク質 (Vip)、例えば Vip1、Vip2、Vip3 又は Vip3A；又は細菌コロニー形成線虫、例えばフォトラブダス・ルミネセンス (*Photorhabdus luminesc*

ens)、キセノラブダス・ネマトフィルス(Xenorhabdus nematophilus)などのフォトラブダス属(Photorhabdus spp.又はキセノラブダス属(Xenorhabdus spp.))の殺虫タンパク質;サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素及び他の昆虫に特有の神経毒素など、動物によって産生される毒素;ストレプトマイセス属(Streptomyces)毒素など、真菌によって産生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチン又はユキノハナレクチンなどの植物レクチン;凝集素;トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パバイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤;リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サポリン又はプリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質(RIP);3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-UDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG-CoA-レダクターゼなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャンネル又はカルシウムチャンネルの遮断薬などのイオンチャンネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ピベンジルシンターゼ、キチナーゼ及びグルカナーゼが挙げられる。

【0198】

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

【0199】

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

【0200】

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

【0201】

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

【0202】

殺虫剤耐性(insecticidal resistance)をコードし、1つ又は複数の毒素を発現する1つ又は複数の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが市販されている。このような植物の例は、YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を発現するトウモロコシ品種);YieldGard Rootworm(登録商標)(Cry3Bb1毒素を発現するトウモロコシ品種);Yi

e l d G a r d P l u s (登 録 商 標) (C r y 1 A b 及 び C r y 3 B b 1 毒 素 を 発 現 す
 る ト ウ モ ロ コ シ 品 種) ; S t a r l i n k (登 録 商 標) (C r y 9 C 毒 素 を 発 現 す る ト ウ
 モ ロ コ シ 品 種) ; H e r c u l e x I (登 録 商 標) (C r y 1 F a 2 毒 素 及 び 除 草 剤 グ
 ル ホ シ ネ ー ト ア ン モ ニ ウ ム に 対 す る 耐 性 を 得 る た め の 酵 素 ホ ス フ ィ ノ ト リ シ ン N - ア セ チ
 ル ト ラ ン ス フ ェ ー ゼ (P A T) を 発 現 す る ト ウ モ ロ コ シ 品 種) ; N u C O T N 3 3 B
 (登 録 商 標) (C r y 1 A c 毒 素 を 発 現 す る ワ タ 品 種) ; B o l l g a r d I (登 録 商
 標) (C r y 1 A c 毒 素 を 発 現 す る ワ タ 品 種) ; B o l l g a r d I I (登 録 商 標) (C r y 1 A c 及 び C r y 2 A b 毒 素 を 発 現 す る ワ タ 品 種) ; V i p C o t (登 録 商 標) (V i p 3 A 及 び C r y 1 A b 毒 素 を 発 現 す る ワ タ 品 種) ; N e w L e a f (登 録 商 標) (C r y 3 A 毒 素 を 発 現 す る ジャ ガ イ モ 品 種) ; N a t u r e G a r d (登 録 商 標) 、 A g r i s u r e (登 録 商 標) G T A d v a n t a g e (G A 2 1 グ リ ホ サ ー ト 耐 性 形 質) 、 A g r i s u r e (登 録 商 標) C B A d v a n t a g e (B t 1 1 ア ワ ノ メ イ ガ (C B) 形 質) 及 び P r o t e c t a (登 録 商 標) で あ る 。 10

【 0 2 0 3 】

こ の よ う な ト ラ ン ス ジ ェ ニ ッ ク 作 物 の さ ら な る 例 は 、 以 下 の と お り で あ る :

1 . S y n g e n t a S e e d s S A S (C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e) 製 の B t 1 1 ト ウ モ ロ コ シ 、 登 録 番 号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。 切 断 C r y 1 A b 毒 素 の ト ラ ン ス ジ ェ ニ ッ ク 発 現 に よ り 、 ヨ ー ロ ッ パ ア ワ ノ メ イ ガ (ア ワ ノ メ イ ガ (O s t r i n i a n u b i l a l i s) 及 び セ サ ミ ア ・ ノ ナ グ リ オ イ デ ス (S e s a m i a n o n a g r i o i d e s)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。 B t 1 1 ト ウ モ ロ コ シ は 、 除 草 剤 グ ル ホ シ ネ ー ト ア ン モ ニ ウ ム に 対 す る 耐 性 を 得 る た め に 酵 素 P A T も 遺 伝 子 組 み 換 え に よ り 発 現 す る 。 20

【 0 2 0 4 】

2 . S y n g e n t a S e e d s S A S (C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e) 製 の B t 1 7 6 ト ウ モ ロ コ シ 、 登 録 番 号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。 C r y 1 A b 毒 素 の ト ラ ン ス ジ ェ ニ ッ ク 発 現 に よ り 、 ヨ ー ロ ッ パ ア ワ ノ メ イ ガ (ア ワ ノ メ イ ガ (O s t r i n i a n u b i l a l i s) 及 び セ サ ミ ア ・ ノ ナ グ リ オ イ デ ス (S e s a m i a n o n a g r i o i d e s)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。 B t 1 7 6 ト ウ モ ロ コ シ は 、 除 草 剤 グ ル ホ シ ネ ー ト ア ン モ ニ ウ ム に 対 す る 耐 性 を 得 る た め に 酵 素 P A T も 遺 伝 子 組 み 換 え に よ り 発 現 す る 。 30

【 0 2 0 5 】

3 . S y n g e n t a S e e d s S A S (C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e) 製 の M I R 6 0 4 ト ウ モ ロ コ シ 、 登 録 番 号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。 改 変 C r y 3 A 毒 素 の ト ラ ン ス ジ ェ ニ ッ ク 発 現 に よ り 、 耐 虫 性 に さ れ た ト ウ モ ロ コ シ 。 こ の 毒 素 は 、 カ テ プ シ ン - G - プ ロ テ ア ー ゼ 認 識 配 列 の 挿 入 に よ っ て 修 飾 さ れ た C r y 3 A 0 5 5 で あ る 。 こ の よ う な ト ラ ン ス ジ ェ ニ ッ ク ト ウ モ ロ コ シ 植 物 の 調 製 が 、 国 際 公 開 第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号 に 記 載 さ れ て い る 。 40

【 0 2 0 6 】

4 . M o n s a n t o E u r o p e S . A . (2 7 0 - 2 7 2 A v e n u e d e T e r v u r e n , B - 1 1 5 0 B r u s s e l s , B e l g i u m) 製 の M O N 8 6 3 ト ウ モ ロ コ シ 、 登 録 番 号 C / D E / 0 2 / 9 。 M O N 8 6 3 は 、 C r y 3 B b 1 毒 素 を 発 現 し 、 特 定 の 鞘 翅 目 (C o l e o p t e r a) 昆 虫 に 対 す る 耐 性 を 有 す る 。 40

【 0 2 0 7 】

5 . M o n s a n t o E u r o p e S . A . (2 7 0 - 2 7 2 A v e n u e d e T e r v u r e n , B - 1 1 5 0 B r u s s e l s , B e l g i u m) 製 の I P C 5 3 1 ワ タ 、 登 録 番 号 C / E S / 9 6 / 0 2 。

【 0 2 0 8 】

6 . P i o n e e r O v e r s e a s C o r p o r a t i o n (A v e n u e T e 50

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

【0209】

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

10

【0210】

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

20

【0211】

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

30

【0212】

作物は、真菌(例えば、フザリウム属(Fusarium)、炭疽病又はフィトフトラ属(Phytophthora)、細菌(例えば、シュードモナス属(Pseudomonas))又はウイルス(例えば、ジャガイモ葉巻病ウイルス、トマト黄化壊疽ウイルス、キュウリモザイクウイルス)病原体に対する耐性を高めるためにも改良され得る。

【0213】

作物は、ダイズシスト線虫などの線虫に対する高い抵抗性を有するものも含む。

【0214】

非生物的ストレスに耐性である作物は、例えば、NF-YB又は当技術分野で公知の他のタンパク質の発現により、干ばつ、高塩分、高温、低温、霜又は光線に対する高い耐性を有するものを含む。

40

【0215】

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

50

開第 9 5 / 3 3 8 1 8 号を参照されたい)又は植物病原体防御に關与するタンパク質又はポリペプチド因子(国際公開第 0 3 / 0 0 0 9 0 6 号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」)が挙げられる。

【 0 2 1 6 】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、貯蔵品及び貯蔵室の保護及び原料(木材及び織物など)、床仕上材及び建築物の保護及び衛生分野での特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

【 0 2 1 7 】

本発明は、治療で用いられる第 1 の態様の化合物を提供する。本発明は、動物内又は上の寄生生物の防除に用いられる第 1 の態様の化合物を提供する。本発明は、動物上の外寄生生物の防除に用いられる第 1 の態様の化合物をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害の予防及び/又は処置で用いられる第 1 の態様の化合物をさらに提供する。

10

【 0 2 1 8 】

本発明は、動物内又は上における寄生生物を防除するための医薬品を製造するための第 1 の態様の化合物の使用を提供する。本発明は、動物上における外寄生生物を防除するための医薬品を製造するための第 1 の態様の化合物の使用をさらに提供する。本発明は、外寄生生物によって感染する病害を予防及び/又は処置するための医薬品を製造するための第 1 の態様の化合物の使用をさらに提供する。

【 0 2 1 9 】

20

本発明は、動物内又は上における寄生生物の防除における第 1 の態様の化合物の使用を提供する。本発明は、動物上における外寄生生物の防除における第 1 の態様の化合物の使用をさらに提供する。

【 0 2 2 0 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「防除する」という用語は、有害生物若しくは寄生生物の数の低減、有害生物若しくは寄生生物の駆除及び/又はさらなる有害生物若しくは寄生生物侵襲の予防を指す。

【 0 2 2 1 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「処置する」という用語は、既存の症状又は病害の進行又は重症度の抑制、遅延、停止又は退行を指す。

30

【 0 2 2 2 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「予防する」という用語は、動物内で進展する症状又は病害の回避を指す。

【 0 2 2 3 】

動物内又は上における寄生生物に関連して用いられる場合、「動物」という用語は、哺乳類及び鳥又は魚などの非哺乳類を指し得る。哺乳類の場合、これは、ヒト又は非ヒト哺乳類であり得る。非ヒト哺乳類としては、これらに限定されないが、家畜動物及び伴侶動物が挙げられる。家畜動物としては、これらに限定されないが、ウシ、ラクダ科(camelids)、ブタ、ヒツジ、ヤギ及びウマが挙げられる。伴侶動物としては、これらに限定されないが、イヌ、ネコ及びウサギが挙げられる。

40

【 0 2 2 4 】

「寄生生物」は、宿主動物内又は上で生存し、宿主動物を犠牲にしてもたらされる栄養分によって利する有害生物である。「内寄生生物」は、宿主動物の体内に生存している寄生生物である。「外寄生生物」は、宿主動物上に生存している寄生生物である。外寄生生物としては、これらに限定されないが、コナダニ、昆虫及び甲殻類(例えば、フナムシ)が挙げられる。ダニ目(Acarari)(又はダニ目(Acarina))亜綱は、マダニ類及びダニを含む。マダニ類としては、これらに限定されないが、以下の属の構成員:コイタマダニ属(Rhipicephalus)、例えばオウシマダニ(Rhipicephalus(Boophilus)microplus)及びクリイロコイタマダニ(Rhipicephalus sanguineus);キララマダニ属(Amblyom

50

International Journal of Pharmaceutics, 33: 201 - 217 (1986); Bastin, R. J., et al. "Salt Selection and Optimization Procedures for Pharmaceutical New Chemical Entities", Organic Process Research and Development, 4: 427 - 435 (2000); 及び Berge, S. M., et al., "Pharmaceutical Salts", Journal of Pharmaceutical Sciences, 66: 1 - 19, (1977) を参照されたい。本発明の化合物は、当業者に周知である技術及び条件を用いて、塩酸塩などの塩に容易に転換されると共に、このような塩として単離され得ることを合成の当業者は理解するであろう。加えて、合成の当業者は、本発明の化合物が、対応する塩から対応する遊離塩基に容易に転換されると共に、このような塩として単離され得ることを理解するであろう。

10

【0228】

本発明は、有害生物（蚊及び他の病原媒介動物など；http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/ も参照されたい）を防除する方法も提供し得る。一実施形態では、有害生物を防除する方法は、本発明の組成物を標的有害生物、その生息地又は表面若しくは基材にブラシ塗布、ローラ塗布、噴霧、塗布又は浸漬によって施用する工程を含む。例として、壁、天井又は床面などの表面の IRS（屋内残留噴霧）施用が、本発明の方法によって想定されている。別の実施形態では、このような組成物を網、衣類、寝具、カーテン及びテントの形態（又はこれらの製造に使用され得る形態）の不織布又は布帛材料などの基材に施用することが想定されている。

20

【0229】

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

30

【0230】

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

40

【0231】

本発明に係る組成物のさらなる使用分野は、すべての観賞用樹木並びにあらゆる種類の果樹及び堅果の成る木の樹幹注入／幹処理の分野であり得る。

【0232】

樹幹注入／幹処理の分野では、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）及び鞘翅目（Coleoptera）の木材穿孔性（wood-boring）昆虫、特に以下の表 A 及び B に列挙される木材穿孔性昆虫（woodborer）に対して特に好適であり得る。

【0233】

50

【表 6】

表 A. 経済的に重要な外来の木材穿孔性昆虫の例

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

10

20

30

40

50

【表 7 - 1】

表 B. 経済的に重要な在来の木材穿孔性昆虫の例

科	種	寄生される宿主又は作物
タマムシ科 (Buprestidae)	アグリルス・アンキシウス (<i>Agrilus anxius</i>)	カバノキ
	アグリルス・ポリツス (<i>Agrilus politus</i>)	ヤナギ、カエデ
	アグリルス・サイ(<i>Agrilus sayi</i>)	ヤマモモ、ニセヤマモモ
	アグリルス・ビッタチコリス (<i>Agrilus vittaticollis</i>)	リンゴ、セイヨウナシ、クランベリ ー、サーブスベリー、サンザシ
	クリンボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカ エデ、サクラ、クリ、スグリ、ニレ、サ ンザシ、エノキ、ヒッコリー、セイヨウ トチノキ、リンデン、カエデ、ナナカ マド、オーク、ペカン、セイヨウナ シ、モモ、カキ、プラム、ポプラ、マ ルメロ、アメリカハナズオウ、サービ スベリー、スズカケノキ、クルミ、ヤ ナギ
	テキサニア・カンペストリス (<i>Texania campestris</i>)	シナノキ、ブナ、カエデ、オーク、ス ズカケノキ、ヤナギ、ユリノキ
カミキリムシ科 (Cerambycidae)	ゴエス・ブルベルレンツス(<i>Goes pulverulentus</i>)	ブナ、ニレ、ナットール(Nuttall)、ヤ ナギ、クロガシワ、アメリカキレハガ シワ(Cherrybark oak)、ミズナラ、ス ズカケノキ
	ゴエス・チグリヌス(<i>Goes tigrinus</i>)	オーク
	ネオクリツス・アクミナツス (<i>Neoclytus acuminatus</i>)	セイヨウトネリコ、ヒッコリー、オー ク、クルミ、カバノキ、ブナ、カエデ、 イースタンホップホーンビーム (Eastern hophornbeam)、ハナミズ キ、カキ、アメリカハナズオウ、ヒイ ラギ、エノキ、ニセアカシア、アメリ カサイカチ、ユリノキ、クリ、アメリカ ハリグワ、サッサfras、ライラッ ク、マウンテン・マホガニー、セイヨ ウナシ、サクラ、プラム、モモ、リン ゴ、ニレ、シナノキ、モミジバフウ
	ネオプテコデス・トリリネツス (<i>Neoptychodes trilineatus</i>)	イチジク、ハンノキ、クワ、ヤナギ、 ネットリーフハックベリー(Netleaf hackberry)
	オベレア・オセラータ(<i>Oberea ocellata</i>)	ヌルデ、リンゴ、モモ、プラム、セイ ヨウナシ、スグリ、ブラックベリー (Blackberry)
	オベレア・トリプンクタータ(<i>Oberea tripunctata</i>)	ハナミズキ、ガマズミ属 (<i>Viburnum</i>)、ニレ、サワーウッド、ブ ルーベリー、シャクナゲ、ツツジ、月 桂樹、ポプラ、ヤナギ、クワ
	オンシデレス・シングラータ (<i>Oncideres cingulata</i>)	ヒッコリー、ペカン、カキ、ニレ、サワ ーウッド、シナノキ、アメリカサイカ チ、ハナミズキ、ユーカリ属

10

20

30

40

50

【表 7 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
		(Eucalyptus)、オーク、エノキ、カエデ、果樹
	サペルダ・カルカラタ (<i>Saperda calcarata</i>)	ポプラ
	ストロフィオナ・ニテンス (<i>Strophiona nitens</i>)	クリ、オーク、ヒッコリー、クルミ、ブナ、カエデ
キクイムシ科 (Scolytidae)	コルチルス・コロンビアヌス (<i>Corthylus columbianus</i>)	カエデ、オーク、ユリノキ、ブナ、トネリコバノカエデ、スズカケノキ、カバノキ、シナノキ、クリ、ニレ
	デンドロクトヌス・フロンタリス (<i>Dendroctonus frontalis</i>)	マツ
	ドリオコエテス・ベツラエ (<i>Dryocoetes betulae</i>)	カバノキ、モミジバフウ、セイヨウミザクラ、ブナ、セイヨウナシ
	モナルトルム・ファスシアツム (<i>Monarthrum fasciatum</i>)	オーク、カエデ、カバノキ、クリ、モミジバフウ、ヌマミズキ、ポプラ、ヒッコリー、ミモザ、リンゴ、モモ、マツ
	フロエオトリブス・リミナリス (<i>Phloeotribus liminaris</i>)	モモ、サクラ、プラム、アメリカザクラ、ニレ、クワ、ナナカマド
	シュードピチオフトルス・プルイノス (<i>Pseudopityophthorus pruinus</i>)	オーク、アメリカブナ、アメリカザクラ、チッカソープラム(Chickasaw plum)、クリ、カエデ、ヒッコリー、シデ、アサダ
スカシバガ科 (Sesiidae)	パラントレネ・シムランス (<i>Paranthrene simulans</i>)	オーク、アメリカグリ
	サンニナ・ウロセリフォルミス (<i>Sannina uroceriformis</i>)	カキ
	シナンテドン・エキシチオサ (<i>Synanthedon exitiosa</i>)	モモ、プラム、ネクタリン、サクラ、アンズ、アーモンド、アメリカザクラ
	シナンテドン・ピクチペス (<i>Synanthedon pictipes</i>)	モモ、プラム、サクラ、ブナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシア (<i>Synanthedon rubrofascia</i>)	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>)	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、ナナカマド、ガマズミ属(Viburnum)、ヤナギ、リンゴ、ビワ、アメリカテマリシモツケ、ヤマモモ
	ビタセア・ポリステフォルミス (<i>Vitacea polistiformis</i>)	ブドウ

10

20

30

40

【0235】

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

【0236】

特に、本発明は、地虫(コガネカブト属(*Cyclocephala* spp.))(例

50

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

【0237】

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

【0238】

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

【0239】

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

【0240】

衛生分野では、本発明に係る組成物は、カタダニ (*hard tick*)、ヒメダニ (*soft tick*)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエ及び舐性 (*licking*) のハエ)、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミ及びノミなどの外部寄生生物に対して有効であり得る。

【0241】

このような寄生生物の例は、以下のとおりである：

シラミ目 (*Anoplurida*) のうち、ブタジラミ属 (*Haematopinus*)

spp.）、ホソジラミ属 (*Linognathus* spp.）、ペディクルス属 (*Pediculus* spp.) 及びケジラミ属 (*Phthirus* spp.）、ソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.)。

【0242】

ハジラミ目 (*Mallophagida*) のうち、トリメノポン属 (*Trimenopon* spp.)、タンカクハジラミ属 (*Menopon* spp.)、トリノトン属 (*Trinoton* spp.)、ボビコラ属 (*Bovicola* spp.)、ウエルネツキエラ属 (*Werneckiella* spp.)、レビケントロン属 (*Lepikeutron* spp.)、ダマリナ属 (*Damalina* spp.)、トリコデクテス属 (*Trichodectes* spp.) 及びフェリコラ属 (*Felicola* spp.)。 10

【0243】

双翅目 (*Diptera*) 並びにその亜目であるネマトセリナ亜目 (*Nematocerina*) 及び短角亜目 (*Brachycerina*) のうち、例えばヤブカ属 (*Aedes* spp.)、ハマダラカ属 (*Anopheles* spp.)、イエカ属 (*Culex* spp.)、ブヨ属 (*Simulium* spp.)、ツノマユブユ属 (*Eusimulium* spp.)、サシチョウバエ属 (*Phlebotomus* spp.)、ルツオミヤ属 (*Lutzomyia* spp.)、キュリコイデス属 (*Culicoides* spp.)、メクラアブ属 (*Chrysops* spp.)、ヒボミトラ属 (*Hybomitra* spp.)、キイロアブ属 (*Atylotus* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、ゴマフアブ属 (*Haematopota* spp.)、フィリボミア属 (*Philipomyia* spp.)、ブラウラ属 (*Braula* spp.)、イエバエ属 (*Musca* spp.)、トゲアシメマトイ属 (*Hydrotaea* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、ヘマトビア属 (*Haematobia* spp.)、モレリア属 (*Morellia* spp.)、ヒメイエバエ属 (*Fannia* spp.)、ツエツエバエ属 (*Glossina* spp.)、オオクロバエ属 (*Calliphora* spp.)、キンバエ属 (*Lucilia* spp.)、オビキンバエ属 (*Chrysomyia* spp.)、ヴォールファールトニクバエ属 (*Wohlfahrtia* spp.)、ニクバエ属 (*Sarcophaga* spp.)、ヒツジバエ属 (*Oestrus* spp.)、ウシバエ属 (*Hypoderma* spp.)、ウマバエ属 (*Gasterophilus* spp.)、シラミバエ属 (*Hippobosca* spp.)、シカシラミバエ属 (*Lipoptena* spp.) 及びヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。 20 30

【0244】

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

【0245】

異翅目 (*Heteropterida*) のうち、例えばトコジラミ属 (*Cimex* spp.)、サシガメ属 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属 (*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属 (*Panstrongylus* spp.)。 40

【0246】

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

【0247】

ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) 並びにマダニ亜目 (*Metastigmata*) 及び中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えばナガヒメダニ属 (50

Argas spp.）、カズキダニ属（Ornithodorus spp.）、オト
 ビウス属（Otobius spp.）、タネガタマダニ属（Ixodes spp.）
 、キララマダニ属（Amblyomma spp.）、ウシマダニ属（Boophilu
 s spp.）、カクマダニ属（Dermacentor spp.）、チマダニ属（H
 aemophysalis spp.）、イボマダニ属（Hyalomma spp.）
 、コイタマダニ属（Rhipicephalus spp.）、デルマニスス属（Der
 manyssus spp.）、ライリエチア属（Raillietia spp.）、
 ニューモニスス属（Pneumonyssus spp.）、ステルノストマ属（Ste
 rnostoma spp.）及びバロア属（Varroa spp.）。

【0248】

10

ダニ目（Actinedida）（前気門類（Prostigmata））及びカイチ
 ユウ目（Acaridida）（コナダニ亜目（Astigmata））のうち、例えば
 アカラピス属（Acarapis spp.）、ツメダニ属（Cheyletiella
 spp.）、オルニソケイレチア属（Ornithocheyletia spp.）、
 ミオピア属（Myobia spp.）、ヒツジツメダニ属（Psorergates s
 spp.）、ニキビダニ属（Demodex spp.）、ツツガムシ属（Trombic
 ula spp.）、リストロホルス属（Listrophorus spp.）、コナ
 ダニ属（Acarus spp.）、チロファグス属（Tyrophagus spp.
 ）、ゴミコナダニ属（Caloglyphus spp.）、ヒポデクテス属（Hypo
 dectes spp.）、プテロリクス属（Pterolichus spp.）、キ
 ユウセンヒゼンダニ属（Psoroptes spp.）、ショクヒヒゼンダニ属（Ch
 orioptes spp.）、ミミヒゼンダニ属（Otodectes spp.）、
 ヒゼンダニ属（Sarcoptes spp.）、ショウセンコウヒゼンダニ属（Not
 oedres spp.）、クネミドコプテス属（Knemidocoptes spp
 .）、シトジテス属（Cytodites spp.）及びラミノシオプテス属（Lam
 inosioptes spp.）。

20

【0249】

本発明に係る組成物は、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙及び厚紙
 、皮革、床仕上げ材及び建築物などの材料の場合、昆虫の寄生から保護するのにも好適で
 あり得る。

30

【0250】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイ
 エカミキリ（Hylotrupes bajulus）、クロロホルス・ピロシス（Ch
 lorophorus pilosis）、アノビウム・プンクタツム（Anobium
 punctatum）、キセストビウム・ルホビロスム（Xestobium rufo
 villosum）、プチリヌスペクチコルニス（Ptilinuspecticorn
 is）、デンドロビウム・ペルチネクス（Dendrobium pertinex）、
 マツザイシバンムシ（Ernobius mollis）、オオナガシバンムシ（Pri
 obium carpini）、ヒラタキクイムシ（Lyctus brunneus）
 、アフリカヒラタキクイムシ（Lyctus africanus）、アメリカヒラタキ
 クイムシ（Lyctus planicollis）、ナラヒラタキクイムシ（Lyct
 us linearis）、リクツス・プベセンス（Lyctus pubescens
 ）、トロゴキシロン・アエクアレ（Trogoxylon aequale）、ミンテス
 ルギコリス（Minthesrugicollis）、キシルボルス属種（Xylebo
 rus spec.）、トリプトデンドロン属種（Tryptodendron spe
 c.）、アパテ・モナクス（Apate monachus）、ボストリクス・カプシン
 ス（Bostrychus capucins）、ヘテロボストリクス・ブルンネウス（
 Heterobostrychus brunneus）、シノキシロン属種（Sino
 xylon spec.）及びチビタケナガシンクイムシ（Dinoderus min
 utus）などの甲虫並びにさらにコルリキバチ（Sirex juvencus）、モ

40

50

ミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocerus gigas taignus*) 及びウロセルス・アウグル (*Urocerus augur*) などの膜翅類の昆虫 (*hymenopteran*) 並びにカロテルメス・フラヴィコリス (*Kaloterme flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ (*Cryptoterme brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ (*Heteroterme indicola*)、キアシシロアリ (*Reticuliterme flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス (*Reticuliterme santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス (*Reticuliterme lucifugus*)、ムカシシロアリ (*Mastroterme darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ (*Zootermopsis nevadensis*) 及びイエシロアリ (*Coptoterme formosanus*) などのシロアリ並びにセイヨウシミ (*Lepisma saccharina*) などのシミ。

【0251】

式 I、I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 1a、I - 2a、I - 3a 及び I - 4a の化合物又はその塩は、以下の属から選択される 1 種以上の有害生物の防除に特に好適である：スポドプテラ属の種 (*Spodoptera spp*)、ヘリコベルバ属の種 (*Helicoverpa spp*)、ヘリオティス属の種 (*Heliothis spp*)、ルーシノデス属の種 (*Leucinodes spp*)、ツタ属の種 (*Tuta spp*)、ブルテラ属の種 (*Plutella spp*)、シジア属の種 (*Cydia spp*)、ロベシア属の種 (*Lobesia spp*)、トルトリックス属の種 (*Tortrix spp*)、アミエロイス属の種 (*Amyelois spp*)、マルカ属の種 (*Maruca spp*)、クリソデイクス属の種 (*Chrysodeixis spp*)、アグロティス属の種 (*Agrotis spp*)、エラスモバルプス属の種 (*Elasmopalpus spp*)、ダルブルス属の種 (*Dalbulus spp*)、ステルネクス属の種 (*Sternechus spp*)、フィロトレタ属の種 (*Phyllotreta spp*)、ポピリア属の種 (*Popillia spp*)、シルボファガ属の種 (*Scirpophaga spp*)、キロ属の種 (*Chilo spp*)、クナファロクロシス属の種 (*Cnaphalocrosis spp*)、テトラニクス属の種 (*Tetranychus spp*)、パノニクス属の種 (*Panonychus spp*)、ポリファゴタルソネムス属の種 (*Polyphagotarsonemus spp*)、フィロコプツルタ属の種 (*Phyllocoptruta spp*)、アカルス属の種 (*Aculus spp*)、ブレビバルプス属の種 (*Brevipalpus spp*)、オリゴニクス属の種 (*Oligonychus spp*)、アクロプス属の種 (*Aculops spp*)、ニラパルバタ属の種 (*Nilaparvata spp*)、ソガテラ属の種 (*Sogatella spp*)、ラオデルファクス属の種 (*Laodelphax spp*)、ツマグロヨコバイ属の種 (*Nephotettix spp*)、ジアブロチカ属の種 (*Diabrotica spp*)、アグリオテス属の種 (*Agriotes spp*)、ヒブノイドウス属の種 (*Hypnoidus spp*)、リモニウム属の種 (*Limonius spp*)、メラノツス属の種 (*Melanotus spp*)、コノデルス属の種 (*Conoderus spp*)、デリア属の種 (*Delia spp*)、アムフィマロン属の種 (*Amphimallon spp*)、ポピリア属の種 (*Popillia spp*)、ユースキスツス属の種 (*Euschistus spp*)、ピエゾドルス属の種 (*Piezodorus spp*)、ネザラ属の種 (*Nezara spp*)、ジケロプス属の種 (*Dichelops spp*)、メクラカメムシ属の種 (*Lygus spp*)、レプトコリサ属の種 (*Leptocorisa spp*)、エウリガステル属の種 (*Eurygaster spp*)、ハリモルフア属の種 (*Halymorpha spp*)、スリップス属の種 (*Thrips spp*)、スキルトトリプス属の種 (*Scirtothrips spp*)、ハナアザミウマ属の種 (*Frankliniella spp*)、アントノムス属の種 (*Anthonomus spp*)、メリンゲテ

ス属の種 (*Meltingethes* spp)、フィロトレタ属の種 (*Phyllotreta* spp)、レプチノタルサ属の種 (*Leptinotarsa* spp)、ベミシア属の種 (*Bemisia* spp)、トリアロイデス属の種 (*Trialeurodes* spp)、ワタアブラムシ属の種 (*Aphis* spp) 及びミズス属の種 (*Myzus* spp)。

【0252】

各態様の好ましい実施形態では、化合物 TX (ここで、略記「TX」は、「表 1 ~ 5 及び表 P で定義されている化合物から選択される 1 種の化合物」を意味する) は、以下の属から選択される有害生物の 1 種以上を防除する：スポドプテラ属の種 (*Spodoptera* spp)、ヘリコベルパ属の種 (*Helicoverpa* spp)、ヘリオティス属の種 (*Heliothis* spp)、ルーシノデス属の種 (*Leucinodes* spp)、ツタ属の種 (*Tuta* spp)、プルテラ属の種 (*Plutella* spp)、シジア属の種 (*Cydia* spp)、ロベシア属の種 (*Lobesia* spp)、トルトリックス属の種 (*Tortrix* spp)、アミエロイス属の種 (*Amyelois* spp)、マルカ属の種 (*Maruca* spp)、クリソデイクス属の種 (*Chrysodeixis* spp)、アグロティス属の種 (*Agrotis* spp)、エラスモバルプス属の種 (*Elasmopalpus* spp)、ダルブルス属の種 (*Dalbulus* spp)、ステルネクス属の種 (*Sternechus* spp)、フィロトレタ属の種 (*Phyllotreta* spp)、ポピリア属の種 (*Popillia* spp)、シルボファガ属の種 (*Scirpophaga* spp)、キロ属の種 (*Chilo* spp)、クナファロクロシス属の種 (*Cnaphalocrosis* spp)、テトラニクス属の種 (*Tetranychus* spp)、パノニクス属の種 (*Panonychus* spp)、ポリファゴタルソネムス属の種 (*Polyphagotarsonemus* spp)、フィロコプツルタ属の種 (*Phyllocoptuta* spp)、アカルス属の種 (*Aculus* spp)、ブレビバルプス属の種 (*Brevipalpus* spp)、オリゴニクス属の種 (*Oligonychus* spp)、アクロプス属の種 (*Aculops* spp)、ニラバルバタ属の種 (*Nilaparvata* spp)、ソガテラ属の種 (*Sogatella* spp)、ラオデルファクス属の種 (*Laodelphax* spp)、ツماغロヨコバイ属の種 (*Nephotettix* spp)、ジアブロチカ属の種 (*Diabrotica* spp)、アグリオテス属の種 (*Agriotes* spp)、ヒブノイドゥス属の種 (*Hypnoidus* spp)、リモニウム属の種 (*Limonius* spp)、メラノツス属の種 (*Melanotus* spp)、コノデルス属の種 (*Conoderus* spp)、デリア属の種 (*Delia* spp)、アムフィマロン属の種 (*Amphimallon* spp)、ポピリア属の種 (*Popillia* spp)、ユースキスツス属の種 (*Euschistus* spp)、ピエゾドルス属の種 (*Piezodorus* spp)、ネザラ属の種 (*Nezara* spp)、ジケロプス属の種 (*Dichelops* spp)、メクラカメムシ属の種 (*Lygus* spp)、レプトコリサ属の種 (*Leptocorisa* spp)、エウリガステル属の種 (*Eurygaster* spp)、ハリモルフア属の種 (*Halymorpha* spp)、スリップス属の種 (*Thrips* spp)、スキルトトリプス属の種 (*Scirtothrips* spp)、ハナアザミウマ属の種 (*Frankliniella* spp)、アントノムス属の種 (*Anthonomus* spp)、メルングテス属の種 (*Meltingethes* spp)、フィロトレタ属の種 (*Phyllotreta* spp)、レプチノタルサ属の種 (*Leptinotarsa* spp)、ベミシア属の種 (*Bemisia* spp)、トリアロイデス属の種 (*Trialeurodes* spp)、ワタアブラムシ属の種 (*Aphis* spp) 及びミズス属の種 (*Myzus* spp)。

【0253】

式 I、I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 1 a、I - 2 a、I - 3 a 及び I - 4 a の化合物又はその塩は、以下から選択される 1 種以上の有害生物の防除に特に好適である

：スポドプテラ属の種 (*Spodoptera* spp) (例えば、スポドプテラフルギ
 ペルダ (*Spodoptera frugiperda*)、エジプトヨトウ (*Spodo
 ptera littoralis*))、オオタバコガ (*Helicoverpa ar
 miger*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、
 ナスノメイガ (*Leucinodes orbonalis*)、トマトキバガ (*Tuta
 absoluta*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、コドリング
 (*Cydia pomonella*)、ロベシア属の種 (*Lobesia* spp)、ト
 ルトリックス属の種 (*Tortrix* spp)、マメノメイガ (*Maruca vit
 rata*)、クリソデイクスインクルデンス (*Chrysodeixis includ
 ens*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、モロコシマダラメイガ (*E
 lasmopalpus lignosellus*)、ダルブルスマイズ (*Dalbu
 lus maidis*)、フィロトレタ属の種 (*Phyllotreta* spp)、マ
 メコガネ (*Popillia japonica*)、イッテンオオメイガ (*Scirpo
 phaga incertulas*)、ニカメイガ (*Chilo suppressal
 is*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrosis medinalis*)、ナミハ
 ダニ (*Tetranychus urticae*)、リンゴハダニ (*Panonychu
 s ulmi*)、チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus lat
 us*)、ミカンサビダニ (*Phyllocoptruta oleivora*)、ブレビ
 パルプス属の種 (*Brevipalpus* spp)、トマトサビダニ (*Aculops
 lycopersici*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)
 、セジロウンカ (*Sogatella fructifera*)、ヒメトビウンカ (*Lao
 delphax striatellus*)、ツマグロヨコバイ属の種 (*Nephote
 ttix* spp)、ジアブロチカビギフェラ (*Diabrotica vigifer
 a*)、アグリオテス属の種 (*Agriotes* spp)、ヒブノイツスピコロル (*Hy
 pnoidus bicolor*)、リモニウムカヌス (*Limonius canus*)、
 キャベツハナバエ (*Delia radicum*)、マメコガネ (*Popillia
 japonica*)、ユースキスツスヘロス (*Euschistus heros*)、ピ
 エゾドルスリツラツス (*Piezodorus lituratus*)、ミナミアオカメ
 ムシ (*Nezara viridula*)、ジケロプスフルカツス (*Dichelops
 furcatus*)、メクラカメムシ属の一種 (*Lygus* sp.)、ホソクモヘリカ
 メムシ (*Leptocorisa acuta*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha
 halyis*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、チャノキイロア
 ザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella
 occidentalis*)、メキシコワタミゾウムシ (*Anthonomus grandis*)、メリゲテスアエネウス (*Meligethes
 aeneus*)、フィロトレタ属の種 (*Phyllotreta* spp)、コロラ
 ドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、タバココナジラミ
 (*Bemisia tabaci*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes
 vaporariorum*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*) 及びモ
 モアカアブラムシ (*Myzus persicae*)。

【0254】

各態様の好ましい実施形態では、化合物 TX (ここで、略記「TX」は、「表1～5及
 び表Pで定義されている化合物から選択される1種の化合物」を意味する)は、以下の属
 から選択される有害生物の1種以上を防除する：スポドプテラ属の種 (*Spodopte
 ra* spp) (例えば、スポドプテラフルギペルダ (*Spodoptera frug
 iperda*)、エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*))+
 TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)+TX、ニセアメリカ
 タバコガ (*Heliothis virescens*)+TX、ナスノメイガ (*Leu
 cinodes orbonalis*)+TX、トマトキバガ (*Tuta absolu
 ta*)+TX、コナガ (*Plutella xylostella*)+TX、コドリング

(*Cydia pomonella*) + TX、ロベシア属の種(*Lobesia* spp) + TX、トルトリックス属の種(*Tortrix* spp) + TX、マメノメイガ(*Maruca vitrata*) + TX、クリソデイキスインクルデンス(*Chrysodeixis includens*) + TX、タマナヤガ(*Agrotis ipsilon*) + TX、モロコシマダラメイガ(*Elasmopalpus lignosellus*) + TX、ダルブルスマイジス(*Dalbulus maidis*) + TX、フィロトレタ属の種(*Phyllotreta* spp) + TX、マメコガネ(*Popillia japonica*) + TX、イッテンオオメイガ(*Scirpophaga incertulas*) + TX、ニカメイガ(*Chilo suppressalis*) + TX、コブノメイガ(*Cnaphalocrosis medinalis*) + TX、ナミハダニ(*Tetranychus urticae*) + TX、リンゴハダニ(*Panonychus ulmi*) + TX、チャノホコリダニ(*Polyphagotarsonemus latus*) + TX、ミカンサビダニ(*Phyllocoptruta oleivora*) + TX、ブレビパルプス属の種(*Brevipalpus* spp) + TX、トマトサビダニ(*Aculops lycopersici*) + TX、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*) + TX、セジロウンカ(*Sogatella fructifera*) + TX、ヒメトビウンカ(*Laodelphax striatellus*) + TX、ツマグロヨコバイ属の種(*Nephotettix* spp) + TX、ジアブロチカビギフェラ(*Diabrotica vigifera*) + TX、アグリオテス属の種(*Agriotes* spp) + TX、ヒブノイツスピコロール(*Hypnoidus bicolor*) + TX、リモニウムカヌス(*Limonius canus*) + TX、キャベツハナバエ(*Delia radicum*) + TX、マメコガネ(*Popillia japonica*) + TX、ユースキスツスヘロス(*Euschistus heros*) + TX、ピエゾドルスリツラツス(*Piezodorus lituratus*) + TX、ミナミアオカメムシ(*Nezara viridula*) + TX、ジケロブスフルカツス(*Dichelops furcatus*) + TX、メクラカメムシ属の種(*Lygus* spp) + TX、ホソクモヘリカメムシ(*Leptocorisa acuta*) + TX、マダラカメムシ(*Halyomorpha haly*) + TX、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*) + TX、チャノキイロアザミウマ(*Scirtotrips dorsalis*) + TX、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*) + TX、メキシコワタミゾウムシ(*Anthonomus grandis*) + TX、メリゲテスアエネウス(*Meligethes aeneus*) + TX、フィロトレタ属の種(*Phyllotreta* spp) + TX、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*) + TX、タバココナジラミ(*Bemisia tabaci*) + TX、オンシツコナジラミ(*Trialeurodes vaporariorum*) + TX、ワタアブラムシ(*Aphis gossypii*) + TX 及び モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*) + TX。

【0255】

式 I、I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 1 a、I - 2 a、I - 3 a 及び I - 4 a の化合物又はその塩は、以下の表に列挙された作物において、列挙された有害生物の防除に特に好適である。

【0256】

【表 8 - 1】

作物	有害生物
葉野菜	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)
ナス科	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)
ブラシカ属 (<i>brassica</i>)	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)
オクラ	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)
仁果	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種

10

20

30

40

50

【表 8 - 2】

	(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)	
野菜	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、タバココナジラミ(<i>Bemisia tabaci</i>)、オンシツコナジラミ(<i>Trialeurodes vaporariorum</i>)、ワタアブラムシ(<i>Aphis gossypii</i>)、モモアカアブラムシ(<i>Myzus persicae</i>)	10
ブドウ	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、ネギアザミウマ(<i>Thrips tabaci</i>)、チャノキイロアザミウマ(<i>Scirtothrips dorsalis</i>)、ミカンキイロアザミウマ(<i>Frankliniella occidentalis</i>)	20
堅果	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)	
プランテーション	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリリング(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)	30
ナス	スポドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、	40

【表 8 - 3】

	ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、ナスノメイガ(<i>Leucinodes orbonalis</i>)、トマトキバガ(<i>Tuta absoluta</i>)、コナガ(<i>Plutella xylostella</i>)、コドリンガ(<i>Cydia pomonella</i>)、ロベシア属の種(<i>Lobesia</i> spp)、トルトリックス属の種(<i>Tortrix</i> spp)、マメノメイガ(<i>Maruca vitrata</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)	10
コーン	スボドブテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)(例えば、スボドブテラフルギベルダ(<i>Spodoptera frugiperda</i>)、エジプトヨトウ(<i>Spodoptera littoralis</i>))、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、クリソデイクスインクルデンス(<i>Chrysodeixis includens</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、モロコシマダラメイガ(<i>Elasmopalpus lignosellus</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、ダルブルスマイジス(<i>Dalbulus maidis</i>)、フィロトレタ属の一種(<i>Phyllotreta</i> sp.)、マメコガネ(<i>Popillia japonica</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)、ウェスタンコーンルートワーム(<i>Diabrotica virgifera virgifera</i>)、アグリオテス属の種(<i>Agriotes</i> spp)、ヒプノイズスピコロル(<i>Hypnoidus bicolor</i>)、リモニウムカヌス(<i>Limonius canus</i>)、キャベツハナバエ(<i>Delia radicum</i>)、ユースキスツスヘロス(<i>Euschistus heros</i>)、ピエゾドルスリツラツス(<i>Piezodorus lituratus</i>)、ミナミアオカメムシ(<i>Nezara viridula</i>)、ジケロブスフルカツス(<i>Dichelops furcatus</i>)、メクラカメムシ属の種(<i>Lygus</i> spp)、ホソクモヘリカメムシ(<i>Leptocorisa acuta</i>)、クサギカメムシ(<i>Halyomorpha halys</i>)、メキシコワタミゾウムシ(<i>Anthonomus grandis</i>)、メリゲテスアエネウス(<i>Meligethes aeneus</i>)、フィロトレタ属の種(<i>Phyllotreta</i> spp)、コロラドハムシ(<i>Leptinotarsa decemlineata</i>)	20 30
ダイズ	スボドブテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)(例えば、スボドブテラフルギベルダ(<i>Spodoptera frugiperda</i>)、エジプトヨトウ(<i>Spodoptera littoralis</i>))、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、クリソデイクスインクルデンス(<i>Chrysodeixis includens</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、モロコシマダラメイガ(<i>Elasmopalpus lignosellus</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、ダルブルスマイジス(<i>Dalbulus maidis</i>)、フィロトレタ属の一種(<i>Phyllotreta</i> sp.)、マ	40

【表 8 - 4】

	メコガネ(<i>Popillia japonica</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)、ユースキスツスヘロス(<i>Euschistus heros</i>)、ピエゾドルスリツラツス(<i>Piezodorus lituratus</i>)、ミナミアオカメムシ(<i>Nezara viridula</i>)、ジケロプスフルカツス(<i>Dichelops furcatus</i>)、メクラカメムシ属の種(<i>Lygus</i> spp)、ホソクモヘリカメムシ(<i>Leptocorisa acuta</i>)、クサギカメムシ(<i>Halyomorpha halys</i>)、ネギアザミウマ(<i>Thrips tabaci</i>)、チャノキイロアザミウマ(<i>Scirtothrips dorsalis</i>)、ミカンキイロアザミウマ(<i>Frankliniella occidentalis</i>)、メキシコワタミゾウムシ(<i>Anthonomus grandis</i>)、メリゲテスアエネウス(<i>Meligethes aeneus</i>)、フィロトレタ属の種(<i>Phyllotreta</i> spp)、コロラドハムシ(<i>Leptinotarsa decemLineata</i>)	10
綿	スボドプテラ属の種(<i>Spodoptera</i> spp)(例えば、スボドプテラフルギベルダ(<i>Spodoptera frugiperda</i>)、エジプトヨトウ(<i>Spodoptera littoralis</i>))、オオタバコガ(<i>Helicoverpa armigera</i>)、ニセアメリカタバコガ(<i>Heliothis virescens</i>)、クリソデキスイングルデンス(<i>Chrysodeixis includens</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、モロコシマダラメイガ(<i>Elasmopalpus lignosellus</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、ダルブルスマイジス(<i>Dalbulus maidis</i>)、フィロトレタ属の一種(<i>Phyllotreta</i> sp.)、マメコガネ(<i>Popillia japonica</i>)、ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)、ウェスターンコーンルートワーム(<i>Diabrotica virgifera virgifera</i>)、アグリオテス属の種(<i>Agriotes</i> spp)、ヒプノイツスビコロール(<i>Hypnoidus bicolor</i>)、リモニウムカヌス(<i>Limonius canus</i>)、キャベツハナバエ(<i>Delia radicum</i>)、ユースキスツスヘロス(<i>Euschistus heros</i>)、ピエゾドルスリツラツス(<i>Piezodorus lituratus</i>)、ミナミアオカメムシ(<i>Nezara viridula</i>)、ジケロプスフルカツス(<i>Dichelops furcatus</i>)、メクラカメムシ属の種(<i>Lygus</i> spp)、ホソクモヘリカメムシ(<i>Leptocorisa acuta</i>)、クサギカメムシ(<i>Halyomorpha halys</i>)、ネギアザミウマ(<i>Thrips tabaci</i>)、チャノキイロアザミウマ(<i>Scirtothrips dorsalis</i>)、ミカンキイロアザミウマ(<i>Frankliniella occidentalis</i>)、メキシコワタミゾウムシ(<i>Anthonomus grandis</i>)、メリゲテスアエネウス(<i>Meligethes aeneus</i>)、フィロトレタ属の種(<i>Phyllotreta</i> spp)、コロラドハムシ(<i>Leptinotarsa decemLineata</i>)、タバココナジ	20 30 40

【表 8 - 5】

	ラムシ(<i>Bemisia tabaci</i>)、オンシツコナジラミ(<i>Trialeurodes vaporariorum</i>)、ワタアブラムシ(<i>Aphis gossypii</i>)、モモアカアブラムシ(<i>Myzus persicae</i>)	
カノーラ	スポドプテラフルギペルダ(<i>Spodoptera frugiperda</i>)、モロコシマダラメイガ(<i>Elasmopalpus lignosellus</i>)、タマナヤガ(<i>Agrotis ipsilon</i>)、ダルブルスマイジス(<i>Dalbulus maidis</i>)、フィロトレタ属の種(<i>Phyllotreta</i> spp)、マメコガネ(<i>Popillia japonica</i>)	
イネ	イッテンオオメイガ(<i>Scirpophaga incertulas</i>)、ニカメイガ(<i>Chilo suppressalis</i>)、コブノメイガ(<i>Cnaphalocrocis medinalis</i>)、トビイロウンカ(<i>Nilaparvata lugens</i>)、セジロウンカ(<i>Sogatella furcifera</i>)、ヒメトビウンカ(<i>Laodelphax striatellus</i>)、ツマグロヨコバイ属の種(<i>Nephotettix</i> spp)、ユースキスツスヘロス(<i>Euschistus heros</i>)、ピエゾドルスリツラツス(<i>Piezodorus lituratus</i>)、ミナミアオカメムシ(<i>Nezara viridula</i>)、ジケロブスフルカツス(<i>Dichelops furcatus</i>)、メクラカメムシ属の種(<i>Lygus</i> spp)、ホソクモヘリカメムシ(<i>Leptocoris acuta</i>)、クサギカメムシ(<i>Halyomorpha halys</i>)、メキシコワタミゾウムシ(<i>Anthonomus grandis</i>)、メリゲテスアエネウス(<i>Meligethes aeneus</i>)、フィロトレタ属の種(<i>Phyllotreta</i> spp)、コロラドハムシ(<i>Leptinotarsa decemlineata</i>)	10 20
柑橘類	ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)、ネギアザミウマ(<i>Thrips tabaci</i>)、チャノキイロアザミウマ(<i>Scirtothrips dorsalis</i>)、ミカンキイロアザミウマ(<i>Frankliniella occidentalis</i>)	
ジャガイモ	ナミハダニ(<i>Tetranychus urticae</i>)、リンゴハダニ(<i>Panonychus ulmi</i>)、チャノホコリダニ(<i>Polyphagotarsonemus latus</i>)、ミカンサビダニ(<i>Phyllocoptruta oleivora</i>)、ブレビパルプス属の種(<i>Brevipalpus</i> spp)、トマトサビダニ(<i>Aculops lycopersici</i>)、ウェスタンコーンルートワーム(<i>Diabrotica virgifera virgifera</i>)、アグリオテス属の種(<i>Agriotes</i> spp)、ヒプノイズスピコロール(<i>Hypnoidus bicolor</i>)、リモニウムカヌス(<i>Limonius canus</i>)、キャベツハナバエ(<i>Delia radicum</i>)、マメコガネ(<i>Popillia japonica</i>)、メキシコワタミゾウムシ(<i>Anthonomus grandis</i>)、メリゲテスアエネウス(<i>Meligethes aeneus</i>)、フィロトレタ属の種(<i>Phyllotreta</i> spp)、コロラドハムシ(<i>Leptinotarsa decemlineata</i>)	30
穀類(コムギ、モロコシ属)	ウェスタンコーンルートワーム(<i>Diabrotica virgifera virgifera</i>)、アグリオテス属の種(<i>Agriotes</i> spp)、ヒプノイズスピコロール(<i>Hypnoidus bicolor</i>)、リモニウムカヌ	40

【表 8 - 6】

(Sorghum)、オオムギ)	ス(Limonius canus)、キャベツハナバエ(Delia radicum)、マメコガネ(Popillia japonica)、メキシコワタミゾウムシ(Anthonomus grandis)、メリゲテスアエネウス(Meligethes aeneus)、フィロトレタ属の種(Phyllotreta spp)、コロラドハムシ(Leptinotarsa decemLineata)
多様な農作物	ウェスタンコーンルートワーム(Diabrotica virgifera vigifera)、アグリオテス属の種(Agriotes spp)、ヒプノイズスピコロール(Hypnoidus bicolor)、リモニウムカヌス(Limonius canus)、キャベツハナバエ(Delia radicum)、マメコガネ(Popillia japonica)
結果野菜	ネギアザミウマ(Thrips tabaci)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)、
ピーナッツ	ネギアザミウマ(Thrips tabaci)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)
タマネギ	ネギアザミウマ(Thrips tabaci)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)
アブラナ	メキシコワタミゾウムシ(Anthonomus grandis)、メリゲテスアエネウス(Meligethes aeneus)、フィロトレタ属の種(Phyllotreta spp)、コロラドハムシ(Leptinotarsa decemLineata)
観賞用植物	ネギアザミウマ(Thrips tabaci)、チャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalis)、ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)
特 殊 作 物 (https://www.ams.usda.gov/services/grants/scbgp/specialty-crop に定義されている)	タバココナジラミ(Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum)、ワタアブラムシ(Aphis gossypii)、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)

10

20

30

40

【 0 2 5 7 】

各態様の好ましい実施形態では、化合物 TX (ここで、略記「TX」は、「表 1 ~ 5 及び表 P で定義されている化合物から選択される 1 種の化合物」を意味する) は、スポドブレタ属の種 (Spodoptera spp) (例えば、スポドブレタフルギペルダ (Spodoptera frugiperda)、エジプトヨトウ (Spodoptera littoralis))、オオタバコガ (Helicoverpa armigera)、ニセアメリカタバコガ (Heliothis virescens)、ナスノメイガ (Leucinodes orbonalis)、トマトキバガ (Tuta absoluta)、コナガ (Plutella xylostella)、コドリリング (Cydi

50

a pomonella)、ロベシア属の種(Lobesia spp)、トルトリックス属の一種(Tortrix sp.)、マメノメイガ(Maruca vitrata)、クリソデイキスインクルデンス(Chrysodeixis includens)、タマナヤガ(Agrotis ipsilon)、モロコシマダラメイガ(Elasmopalpus lignosellus)、ダルブルスマイジス(Dalbulus maidis)、フィロトレタ属の種(Phyllostreta spp)、マメコガネ(Popillia japonica)、イッテンオオメイガ(Scirpophaga incertulas)、ニカメイガ(Chilo suppressalis)、コブノメイガ(Cnaphalocrosis medinalis)、トビイロウンカ(Nilaparvata lugens)、セジロウンカ(Sogatella fruci- 10
fera)、ヒメトビウンカ(Laodelphax striatellus)、ツマグロヨコバイ属の種(Nephotettix spp)、タバココナジラミ(Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum)、ワタアブラムシ(Aphis gossypii)及びモモアカアブラムシ(Myzus persicae); スポドブレタ属の種(Spodoptera spp)など(例えば、スポドブレタフルギペルダ(Spodoptera frugiperda)、エジプトヨトウ(Spodoptera littoralis)) + TX、オオタバコガ(Helicoverpa armigera) + TX、ニセアメリカタバコガ(Heliothis virescens) + TX、ナスノメイガ(Leucinodes orbonalis) + TX、トマトキバガ(Tuta abs- 20
oluta) + TX、コナガ(Plutella xylostella) + TX、コドリリング(Cydia pomonella) + TX、ロベシア属の種(Lobesia spp) + TX、トルトリックス属の種(Tortrix spp) + TX、マメノメイガ(Maruca vitrata) + TX、クリソデイキスインクルデンス(Chrysodeixis includens) + TX、タマナヤガ(Agrotis ipsilon) + TX、モロコシマダラメイガ(Elasmopalpus lignosellus) + TX、ダルブルスマイジス(Dalbulus maidis) + TX、フィロトレタ属の種(Phyllostreta spp) + TX、マメコガネ(Popillia japonica) + TX、イッテンオオメイガ(Scirpophaga incertulas) + TX、ニカメイガ(Chilo suppressalis) + 30
TX、コブノメイガ(Cnaphalocrosis medinalis) + TX、トビイロウンカ(Nilaparvata lugens) + TX、セジロウンカ(Sogatella fruci-
fera) + TX、ヒメトビウンカ(Laodelphax striatellus) + TX、ツマグロヨコバイ属の種(Nephotettix spp) + TX、タバココナジラミ(Bemisia tabaci) + TX、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum) + TX、ワタアブラムシ(Aphis gossypii) + TX 及びモモアカアブラムシ(Myzus persicae) + TX の1種以上を防除する。

【0258】

本発明に係る化合物は、とりわけ、昆虫に対して植物を保護するための有利なレベルの 40
生物学的活性又は農芸化学的有効成分として用いられるための優れた特性(例えば、高い生物学的活性、有利な活性範囲、高い安全性プロファイル(地上及び地下の非標的生物(魚類、鳥類及びハチ類など)に対して、向上した物理化学的特性又は高い生分解性)を含むいずれかの数の有益性を有し得る。特に、特定の式(I)の化合物は、特にミツバチ、単生ミツバチ及びマルハナバチなどの受粉媒介者といった非標的節足動物に対して有利な安全性プロファイルを示し得ることが意外なことに見出された。最も具体的には、セイヨウミツバチ(Apis mellifera)である。

【0259】

本発明に係る化合物は、未変性の形態で殺有害生物剤として使用可能であるが、これらは、一般に、種々の方法でキャリア、溶剤及び表面活性物質などの配合助剤を用いて組成 50

物に配合される。配合物は、例えば、散粉粉末、ゲル、水和剤、水分散性顆粒、水分散性錠剤、発泡性ペレット、乳化性濃縮物、マイクロ乳化性濃縮物、水中油型エマルジョン、油性フロアブル、水性分散体、油性分散体、サスポエマルジョン、カプセル懸濁液、乳化性顆粒、可溶性液体、水溶性濃縮物（キャリアとして水又は水和性の有機溶剤を含む）、含浸ポリマーフィルムの状態又は例えば the Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010) から公知である他の形態といった種々の物理的形態であり得る。このような配合物は、直接用いられるか又は使用前に希釈され得る。希釈は、例えば、水、液体肥料、微量元素、生物学的生体、油又は溶剤により行うことが可能である。

10

【0260】

配合物は、例えば、微細固形分、顆粒、溶液、分散体又はエマルジョンの形態で組成物を得るために、有効成分を配合助剤と混合することにより調製可能である。有効成分は、微細固形分、鉱油、植物性油若しくは動物性油、植物性変性油若しくは動物性変性油、有機溶剤、水、表面活性物質又はこれらの組み合わせなどの他の補助剤とも配合可能である。

【0261】

有効成分は、きわめて微細なマイクロカプセル中にも含まれ得る。マイクロカプセルは、多孔性キャリア中に有効成分を含有する。これにより、有効成分を、制御された量（例えば、緩効性）で環境中に放出させることが可能である。マイクロカプセルは、通常、0.1 ~ 500 ミクロンの直径を有する。これらは、有効成分をカプセル重量基準で約 25 ~ 95 重量 % の量で含有する。有効成分は、一塊の固体の形態、固体若しくは液体分散体中の微細な粒子の形態又は好適な溶液の形態であり得る。封入メンブランは、例えば、天然若しくは合成ゴム、セルロース、スチレン/ブタジエンコポリマー、ポリアクリロニトリル、ポリアクリレート、ポリエステル、ポリアミド、ポリウレア、ポリウレタン又は化学変性ポリマー及びキサントゲン酸デンプン又は当業者に公知である他のポリマーを含むことが可能である。代わりに、きわめて微細なマイクロカプセルは、基剤の固体マトリックス中に微細粒子の形態で有効成分を含有して形成され得るが、マイクロカプセル自体は、封入されていない。

20

30

【0262】

本発明に係る組成物の調製に好適である配合助剤は、それら自体公知である。液体キャリアとしては、水、トルエン、キシレン、石油エーテル、植物油、アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン、酸無水物、アセトニトリル、アセトフェノン、酢酸アミル、2-ブタノン、ブチレンカーボネート、クロロベンゼン、シクロヘキサン、シクロヘキサノール、酢酸のアルキルエステル、ジアセトンアルコール、1,2-ジクロロプロパン、ジエタノールアミン、p-ジエチルベンゼン、ジエチレングリコール、アビエチン酸ジエチレングリコール、ジエチレングリコールブチルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエーテル、N,N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、1,4-ジオキサン、ジプロピレングリコール、ジプロピレングリコールメチルエーテル、ジプロピレングリコールジベンゾエート、ジプロキシトール、アルキルピロリドン、酢酸エチル、2-エチルヘキサノール、エチレンカーボネート、1,1,1-トリクロロエタン、2-ヘプタノン、 α -ピネン、d-リモネン、乳酸エチル、エチレングリコール、エチレングリコールブチルエーテル、エチレングリコールメチルエーテル、 γ -ブチロラクトン、グリセロール、グリセロールアセテート、グリセロールジアセテート、グリセロールトリアセテート、ヘキサデカン、ヘキシレングリコール、酢酸イソアミル、酢酸イソボルニル、イソオクタン、イソホロン、イソプロピルベンゼン、ミリスチン酸イソプロピル、乳酸、ラウリルアミン、メシチルオキシド、メトキシプロパノール、メチルイソアミルケトン、メチルイソブチルケトン、ラウリン酸メチル、オクタン酸メチル、オレイン酸メチル、塩化メチレン、m-キシレン、n-ヘキサン、n-オクチ

40

50

ルアミン、オクタデカン酸、オクチルアミンアセテート、オレイン酸、オレイルアミン、
o - キシレン、フェノール、ポリエチレングリコール、プロピオン酸、プロピル乳酸塩、
炭酸プロピレン、プロピレングリコール、プロピレングリコールメチルエーテル、p - キ
シレン、トルエン、リン酸トリエチル、トリエチレングリコール、キシレンスルホン酸、
パラフィン、鉱油、トリクロロエチレン、パークロロエチレン、酢酸エチル、酢酸アミル
、酢酸ブチル、プロピレングリコールメチルエーテル、ジエチレングリコールメチルエー
テル、メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアミルアルコール、テトラヒドロ
フルフリルアルコール、ヘキサノール、オクタノール、エチレングリコール、プロピレン
グリコール、グリセロール、N - メチル - 2 - ピロリドンなどの高分子量アルコール等が
用いられ得る。

10

【 0 2 6 3 】

好適な固体キャリアは、例えば、タルク、二酸化チタン、葉ろう石クレイ、シリカ、ア
タパルジャイトクレイ、キースラガー、石灰岩、炭酸カルシウム、ベントナイト、カルシ
ウムモンモリロナイト、綿殻、コムギ粉、ダイズ粉、軽石、木粉、粉碎したクルミの殻、
リグニン及び同様の物質である。

【 0 2 6 4 】

多数の表面活性物質は、固体及び液体配合物の両方、特に使用前にキャリアで希釈可能
である配合物で有利に用いられ得る。表面活性物質は、アニオン性、カチオン性、ノニオ
ン性又は高分子であり得、これらは、乳化剤、湿潤剤若しくは懸濁剤として又は他の目的
のために用いられ得る。典型的な表面活性物質としては、例えば、ジエタノールアンモニ
ウムラウリルスルフェートなどのアルキルスルフェートの塩；ドデシルベンゼンスルホン
酸カルシウムなどのアルキルアールスルホネートの塩；ノニルフェノールエトキシレー
トなどのアルキルフェノール / アルキレンオキシド付加生成物；トリデシルアルコールエ
トキシレートなどのアルコール / アルキレンオキシド付加生成物；ステアリン酸ナトリウ
ムなどのセッケン；ジブチルナフタレンスルホン酸ナトリウムなどのアルキルナフタレン
スルホネートの塩；ジ（ 2 - エチルヘキシル ）スルホコハク酸ナトリウムなどのスルホコ
ハク酸塩のジアルキルエステル；ソルビトールオレアートなどのソルビトールエステル；
ラウリルトリメチル塩化アンモニウムなどの第 4 級アミン、ポリエチレングリコールステ
アレートなどの脂肪酸のポリエチレングリコールエステル；エチレンオキシド及びプロピ
レンオキシドのブロックコポリマー；並びにモノ - 及びジ - アルキルホスフェートエステ
ルの塩；並びに例えば *McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual*, *MC Publishing Corp.*, *Ridg*
ewood New Jersey (1 9 8 1) に記載のさらなる物質が挙げられる。

20

30

【 0 2 6 5 】

有害生物防除配合物で用いられ得るさらなる補助剤としては、結晶化抑制剤、粘度調整
剤、懸濁剤、染料、抗酸化剤、発泡剤、吸光剤、混合助剤、消泡剤、錯化剤、中和剤又は
pH 調整剤及び緩衝剤、腐食抑制剤、芳香剤、湿潤剤、取り込み増強剤、微量元素、可塑
剤、滑剤、潤滑剤、分散剤、増粘剤、不凍剤、殺菌剤並びに液体及び固体肥料が挙げられ
る。

【 0 2 6 6 】

本発明に係る組成物は、植物性油又は動物性油、鉱油、このような油のアルキルエステ
ル又はこのような油及び油誘導体の混合物を含む添加剤を含むことが可能である。本発明
に係る組成物における油添加剤の量は、一般に、適用される混合物に基づいて 0 . 0 1 ~
1 0 % である。例えば、油添加剤は、噴霧混合物が調製された後、噴霧タンク中に所望の
濃度で添加することが可能である。好ましい油添加剤は、鉱油又は例えばナタネ油、オリ
ーブ油若しくはヒマワリ油といった植物性油、乳化植物油、例えばメチル誘導体といった
植物性油のアルキルエステル又は魚油若しくは牛脂などの動物性油を含む。好ましい油添
加剤は、C₈ ~ C₂₂ 脂肪酸のアルキルエステル、特に C₁₂ ~ C₁₈ 脂肪酸のメチル誘導体
であり、例えばラウリン酸、パルミチン酸及びオレイン酸のメチルエステル（それぞれラ
ウリン酸メチル、パルミチン酸メチル及びオレイン酸メチル）を含む。多くの油誘導体は

40

50

、 the Compendium of Herbicide Adjuvants , 10th Edition , Southern Illinois University , 2010 から公知である。

【0267】

本発明の組成物は、一般に、0.1～99重量%、特に0.1～95重量%の本発明の化合物と、1～99.9重量%の配合助剤（これは、0～25重量%の表面活性物質を含むことが好ましい）とを含む。商業用の製品は、濃縮物として配合されることが好ましいことがあり得るが、エンドユーザーは、通常、希釈配合物を利用することとなる。

【0268】

適用量は、幅広い範囲内で様々であり、土壌の性質、適用方法、作物植物、防除される有害生物、主な気象条件並びに適用方法、適用時期及び標的作物によって左右される他の要因に応じる。一般的なガイドラインのとおり、化合物は、1～2000l/ha、特に10～1000l/haの量で適用され得る。

【0269】

好ましい配合物は、以下の組成（重量%）を有することが可能である。

乳化性濃縮物：

有効成分：1～95%、好ましくは60～90%

表面活性薬剤：1～30%、好ましくは5～20%

液体キャリア：1～80%、好ましくは1～35%

【0270】

粉剤：

有効成分：0.1～10%、好ましくは0.1～5%

固体キャリア：99.9～90%、好ましくは99.9～99%

【0271】

懸濁液濃縮物：

有効成分：5～75%、好ましくは10～50%

水：94～24%、好ましくは88～30%

表面活性薬剤：1～40%、好ましくは2～30%

【0272】

水和剤：

有効成分：0.5～90%、好ましくは1～80%

表面活性薬剤：0.5～20%、好ましくは1～15%

固体キャリア：5～95%、好ましくは15～90%

【0273】

顆粒：

有効成分：0.1～30%、好ましくは0.1～15%

固体キャリア：99.5～70%、好ましくは97～85%

【0274】

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

【0275】

本明細書における有効成分への好適な添加剤は、例えば、以下の種類の有効成分が代表例である：有機リン化合物、ニトロフェノール誘導体、チオ尿素、幼若ホルモン、ホルムアミジン、ベンゾフェノン誘導体、尿素、ピロール誘導体、カルバメート、ピレスロイド、塩素化炭化水素、アシル尿素、ピリジニルメチレンアミノ誘導体、マクロライド、ネオ

ニコチノイド及びバチルスチューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) 調製物。

【 0 2 7 6 】

式 (I) の化合物と有効物質との以下の混合物が好ましい (略記「TX」は、「表 1 ~ 5 及び表 P で定義されている化合物から選択される 1 種の化合物」を意味する) :

石油 (代替名) (6 2 8) + TX から構成される物質群から選択される補助剤 ;

アバメクチン + TX、アセキノシル + TX、アセタミプリド + TX、アセトプロール + TX、
 アクリナトリン + TX、アシノナピル + TX、アフイドピロベン + TX、アフオキシソ
 ラネル + TX、アラニカルブ + TX、アレトリン + TX、 α -シベルメトリン + TX、 α
 メトリン + TX、アミドフルメト + TX、アミノカルブ + TX、アゾシクロチン + TX、
 ベンサルタップ + TX、ベンゾキメート + TX、ベンズピリモキササン + TX、 β シフルト
 リン + TX、 β -シベルメトリン + TX、ピフェナゼート + TX、ピフェントリン + TX
 、ピナバクリル + TX、ピオアレトリン + TX、S-ピオアレトリン + TX、ピオレスメ
 トリン + TX、ピストリフルロン + TX、プロフラニリド + TX、プロフルトリネート +
 TX、プロモホス-エチル + TX、ブプロフェジン + TX、ブトカルボキシム + TX、カ
 ズサホス + TX、カルバリル + TX、カルボスルファン + TX、カルタップ + TX、CA
 S 番号 : 1 6 3 2 2 1 8 - 0 0 - 8 + TX、CAS 番号 : 1 8 0 8 1 1 5 - 4 9 - 2 + T
 X、CAS 番号 : 2 0 3 2 4 0 3 - 9 7 - 5 + TX、CAS 番号 : 2 0 4 4 7 0 1 - 4 4
 - 0 + TX、CAS 番号 : 2 1 2 8 7 0 6 - 0 5 - 6 + TX、CAS 番号 : 2 0 9 5 4 7
 0 - 9 4 - 1 + TX、CAS 番号 : 2 3 7 7 0 8 4 - 0 9 - 6 + TX、CAS 番号 : 1 4
 4 5 6 8 3 - 7 1 - 5 + TX、CAS 番号 : 2 4 0 8 2 2 0 - 9 4 - 8 + TX、CAS 番
 号 : 2 4 0 8 2 2 0 - 9 1 - 5 + TX、CAS 番号 : 1 3 6 5 0 7 0 - 7 2 - 9 + TX、
 CAS 番号 : 2 1 7 1 0 9 9 - 0 9 - 3 + TX、CAS 番号 : 2 3 9 6 7 4 7 - 8 3 - 2
 + TX、CAS 番号 : 2 1 3 3 0 4 2 - 3 1 - 4 + TX、CAS 番号 : 2 1 3 3 0 4 2 -
 4 4 - 9 + TX、CAS 番号 : 1 4 4 5 6 8 4 - 8 2 - 1 + TX、CAS 番号 : 1 4 4 5
 6 8 4 - 8 2 - 1 + TX、CAS 番号 : 1 9 2 2 9 5 7 - 4 5 - 6 + TX、CAS 番号 :
 1 9 2 2 9 5 7 - 4 6 - 7 + TX、CAS 番号 : 1 9 2 2 9 5 7 - 4 7 - 8 + TX、CA
 S 番号 : 1 9 2 2 9 5 7 - 4 8 - 9 + TX、CAS 番号 : 2 4 1 5 7 0 6 - 1 6 - 8 + T
 X、CAS 番号 : 1 5 9 4 6 2 4 - 8 7 - 9 + TX、CAS 番号 : 1 5 9 4 6 3 7 - 6 5
 - 6 + TX、CAS 番号 : 1 5 9 4 6 2 6 - 1 9 - 3 + TX、CAS 番号 : 1 9 9 0 4 5
 7 - 5 2 - 7 + TX、CAS 番号 : 1 9 9 0 4 5 7 - 5 5 - 0 + TX、CAS 番号 : 1 9
 9 0 4 5 7 - 5 7 - 2 + TX、CAS 番号 : 1 9 9 0 4 5 7 - 7 7 - 6 + TX、CAS 番
 号 : 1 9 9 0 4 5 7 - 6 6 - 3 + TX、CAS 番号 : 1 9 9 0 4 5 7 - 8 5 - 6 + TX、
 CAS 番号 : 2 2 2 0 1 3 2 - 5 5 - 6 + TX、CAS 番号 : 1 2 5 5 0 9 1 - 7 4 - 7
 + TX、CAS 番号 : 2 7 1 9 8 4 8 - 6 0 - 7 + TX、CAS 番号 : 1 9 5 6 3 2 9 -
 0 3 - 5 + TX、クロラントラニリプロール + TX、クロルダン + TX、クロルフェナピ
 ル + TX、クロロブラレトリン + TX、クロマフェノジド + TX、クレンピリン + TX、
 クロエトカルブ + TX、クロチアニジン + TX、2-クロロフェニルN-メチルカルバメ
 ート (C P M C) + TX、シアノフェンホス + TX、シアントラニリプロール + TX、シ
 クラニリプロール + TX、シクロブトリフルラム + TX、シクロプロトリン + TX、シク
 ロキサプリド + TX、シエノピラフェン + TX、シエトピラフェン (又はエトピラフェン)
 + TX、シフルメトフェン + TX、シフルトリン + TX、シハロジアミド + TX、シハ
 ロトリン + TX、シベルメトリン + TX、シフェノトリン + TX、シプロフラニリド + T
 X、シロマジン + TX、デルタメトリン + TX、ジアフェンチウロン + TX、ジアリホス
 + TX、ジプロム + TX、ジクロロメゾチアズ + TX、ジフロヴィダジン + TX、ジフル
 ベンズロン + TX、ジンプロピリダズ + TX、ジナクチン + TX、ジノカップ + TX、ジ
 ノテフラン + TX、ジオキサベンゾホス + TX、エマメクチン (又はエマメクチン安息香
 酸塩) + TX、エムペントリン + TX、 ϵ -モンフルオロトリン + TX、 ϵ -メトフルト
 リン + TX、エスフェンバレレート + TX、エチオン + TX、エチプロール + TX、エト
 フェンブロックス + TX、エトキサゾール + TX、ファンファー + TX、フェナザキン +

TX、フェンフルトリン+TX、フェンメゾジチアズ+TX、フェニトロチオン+TX、
 フェノブカルブ+TX、フェノチオカルブ+TX、フェノキシカルブ+TX、フェンプロ
 バトリン+TX、フェンピロキシメート+TX、フェンスルホチオン+TX、フェンチオ
 ン+TX、フェンチンアセテート+TX、フェンバレレート+TX、フィプロニル+TX
 、フロメトキン+TX、フロニカミド+TX、フルアクリピリム+TX、フルアザインド
 リジン+TX、フルアズロン+TX、フルベンジアミド+TX、フルベンジミン+TX、
 フルクロルジニリプロール+TX、フルシトリネート+TX、フルシクロクスロン+TX
 、フルシトリネート+TX、フルエンスルホン+TX、フルフェネリム+TX、フルフェ
 ンブロックス+TX、フルフィプロール+TX、フルヘキサホン+TX、フルメトリン+
 TX、フルオピラム+TX、フルベンチオフェノックス+TX、フルピラジフロン+TX 10
 、フルピロキシストリピン+TX、フルピリミン+TX、フルララナー+TX、フルバリ
 ネート+TX、フルキサメタミド+TX、ホスチアゼート+TX、γ-シハロトリン+TX
 X、グアジビル+TX、ハロフェノジド+TX、ハルフェンプロクス+TX、ヘプタフル
 トリン+TX、ヘキシチアゾクス+TX、ヒドラメチルノン+TX、イミシアホス+TX
 、イミダクロブリド+TX、イミプロトリン+TX、インダザピロキシメト+TX、イン
 ドキサカルブ+TX、ヨードメタン+TX、イプロジオン+TX、イソシクロセラム+TX
 X、イソチオエート+TX、イベルメクチン+TX、κ-ピフェントリン+TX、κ-テ
 フルトリン+TX、ラムダ-シハロトリン+TX、レドプロナ+TX、レピメクチン+TX
 X、ロチラネル+TX、ルフエヌロン+TX、メタフルミゾン+TX、メタアルデヒド+
 TX、メタム+TX、メソミル+TX、メトキシフェノジド+TX、メトフルトリン+TX 20
 X、メトルカルブ+TX、メキサカルベート+TX、ミルベメクチン+TX、モンフルオ
 ロトリン+TX、ニコロスアミド+TX、ニコフルプロール+TX；ニテンピラム+TX
 、ニチアジン+TX、オメトエート+TX、オキサミル+TX、オキサゾスルフィル+TX
 X、パラチオン-エチル+TX、ペルメトリン+TX、フェノトリン+TX、ホスホカル
 ブ+TX、ピペロニルブトキシド+TX、ピリミカーブ+TX、ピリミホス-エチル+TX
 X、ピリミホス-メチル+TX、多角体ウイルス+TX、プラレトリン+TX、プロフェ
 ノホス+TX、プロフルトリン+TX、プロパルギット+TX、プロベタムホス+TX、
 プロボキスル+TX、プロチオホス+TX、プロトリフェンブト+TX、ピフルブミド+
 TX、ピメトロジン+TX、ピラクロホス+TX、ピラフルプロール+TX、ピリダベン
 +TX、ピリダリル+TX、ピリフルキナゾン+TX、ピリミジフェン+TX、ピリミノ 30
 ストロピン+TX、ピリプロール+TX、ピリプロキシフェン+TX、レスメスリン+TX
 X、サロラネル+TX、セラメクチン+TX、シラフルオフエン+TX、スピネトラム+
 TX、スピノサド+TX、スピロブジフェン+TX；スピロジクロフェン+TX、スピロ
 メシフェン+TX、スピロビジオン+TX、スピロテトラマト+TX、スピドキサマト+
 TX、スルホキサフロル+TX、テブフェノジド+TX、テブフェンピラド+TX、テブ
 ピリミホス+TX、テフルトリン+TX、テメホス+TX、テトラクロラントラニリプロ
 ール+TX、テトラジホン+TX、テトラメトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX
 X、テトラナクチン+TX、テトラニリプロール+TX、θ-シベルメトリン+TX、チ
 アクロブリド+TX、チアメトキサム+TX、チオシクラム+TX、チオジカルブ+TX
 、チオファノックス+TX、チオメトン+TX、チオスルタップ+TX、チゴラネル+TX 40
 X、チオラントラニリプロール+TX；チオキサザフェン+TX、トルフェンピラド+TX
 X、トキサフェン+TX、トラロメトリン+TX、トランスフルトリン+TX、トリアザ
 メート+TX、トリアゾホス+TX、トリクロルホン+TX、トリクロロネート+TX、
 トリクロルホン+TX、トリフルエンフロネート+TX、トリフルメゾピリン+TX、チ
 クロピラゾフロル+TX、Z-シベルメトリン+TX、海草抽出物及びメラッセ由来の発
 酵生成物+TX、海草抽出物及び尿素を含むメラッセ由来の発酵生成物+TX、アミノ酸
 +TX、カリウム及びモリブデン及びEDTA-キレート化マンガン+TX、海草抽出物
 及び発酵植物生成物+TX、海草抽出物及び植物ホルモンを含む発酵植物生成物+TX、
 ビタミン+TX、EDTA-キレート化銅+TX、亜鉛+TX及び鉄+TX、アザジラク
 チン+TX、パチルス属アイザワイ(Bacillus aizawai)+TX、パチ

10

20

30

40

50

ルスキチノスポルス (*Bacillus chitinosporus*) A Q 7 4 6 (N
 R R L 受入番号 B - 2 1 6 1 8) + T X、バチルスフィルムス (*Bacillus f*
irmus) + T X、バチルス属クルスターキ (*Bacillus kurstaki*)
 + T X、バチルスマイコイデス (*Bacillus mycoides*) A Q 7 2 6 (N
 R R L 受入番号 B - 2 1 6 6 4) + T X、バチルスプミルス (*Bacillus pum*
ilus) (N R R L 受入番号 B - 3 0 0 8 7) + T X、バチルスプミルス (*Bacil*
lus pumilus) A Q 7 1 7 (N R R L 受入番号 B - 2 1 6 6 2) + T X、バチ
 ルス属の一種 (*Bacillus sp.*) A Q 1 7 8 (A T C C 受入番号 5 3 5 2 2)
 + T X、バチルス属の一種 (*Bacillus sp.*) A Q 1 7 5 (A T C C 受入番号
 5 5 6 0 8) + T X、バチルス属の一種 (*Bacillus sp.*) A Q 1 7 7 (A T
 C C 受入番号 5 5 6 0 9) + T X、バチルスサブチリス (*Bacillus subt*
ilis) 不特定の + T X、バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)
 A Q 1 5 3 (A T C C 受入番号 5 5 6 1 4) + T X、バチルスサブチリス (*Bacill*
us subtilis) A Q 3 0 0 0 2 (N R R L 受入番号 B - 5 0 4 2 1) + T X、
 バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) A Q 3 0 0 0 4 (N R R L
 受入番号 B - 5 0 4 5 5) + T X、バチルスサブチリス (*Bacillus subt*
ilis) A Q 7 1 3 (N R R L 受入番号 B - 2 1 6 6 1) + T X、バチルスサブチリス (*Bacill*
us subtilis) A Q 7 4 3 (N R R L 受入番号 B - 2 1 6 6 5)
 + T X、バチルスチューリングゲンシス (*Bacillus thuringiensis*)
 A Q 5 2 (N R R L 受入番号 B - 2 1 6 1 9) + T X、バチルスチューリングゲンシス (*Bacill*
us thuringiensis) B D # 3 2 (N R R L 受入番号 B - 2
 1 5 3 0) + T X、バチルスチューリングゲンシス亜種クルスターキ (*Bacillus*
thuringiensis subspec. kurstaki) B M P 1 2 3 + T
 X、ベアウベリアバッシアナ (*Beauveria bassiana*) + T X、D - リ
 モネン + T X、グラニュロウイルス + T X、ハルピン + T X、オオタバコガ (*Helic*
overpa armigera) 核多核体ウイルス + T X、アメリカタバコガ (*Hel*
icoverpa zea) 核多核体ウイルス + T X、ニセアメリカタバコガ (*Hel*
iothis virescens) 核多核体ウイルス + T X、ヘリオチスプンクチゲラ (*Hel*
iothis punctigera) 核多核体ウイルス + T X、メタリジウム属
 の種 (*Metarhizium spp.*) + T X、ムスコドルアルブス (*Muscod*
or albus) 6 2 0 (N R R L 受入番号 3 0 5 4 7) + T X、ムスコドルロセウス
 (*Muscodor roseus*) A 3 - 5 (N R R L 受入番号 3 0 5 4 8) + T X、
 ニームツリー (*Neem tree*) 系生成物 + T X、パエシロマイセスフモソロセウス
 (*Paecilomyces fumosoroseus*) + T X、パエシロマイセスリ
 ラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) + T X、パストリアニシザ
 ワエ (*Pasteuria nishizawae*) + T X、パストリアペネトランス (*Pasteu*
ria ramosa) + T X、パストリアソルネイ (*Pasteuria th*
ornei) + T X、パストリアウスガエ (*Pasteuria usgae*) + T X、P
 - シメン + T X、コナガ (*Plutella xylostella*) グラニュローシス
 ウイルス + T X、コナガ (*Plutella xylostella*) 核多核体ウイルス
 + T X、多角体ウイルス + T X、ジョチュウギク + T X、Q R D 4 2 0 (テルペノイド
 ブレンド) + T X、Q R D 4 5 2 (テルペノイドブレンド) + T X、Q R D 4 6 0 (テ
 ルペノイドブレンド) + T X、キラヤサボナリア (*Quillaja saponar*
ia) + T X、ロドコッカスグロベルルス (*Rhodococcus globerul*
us) A Q 7 1 9 (N R R L 受入番号 B - 2 1 6 6 3) + T X、スポドプテラフルギベル
 ダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多核体ウイルス + T X、ストレプ
 トマイセスガルブス (*Streptomyces galbus*) (N R R L 受入番号 3
 0 2 3 2) + T X、ストレプトマイセス属の一種 (*Streptomyces sp.*)
 (N R R L 受入番号 B - 3 0 1 4 5) + T X、テルペノイドブレンド + T X 及びベルチシ

リウム属の種 (*Verticillium* spp.) + TX

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

アバメクチン (1) + TX、クルホマート (1011) + TX、シクロブトリフルラム + TX、ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX、エマメクチン (291) + TX、エマメクチン安息香酸塩 (291) + TX、エブリノメクチン (代替名) [CCN] + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、ピペラジン [CCN] + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) 及びチオファネート (1435) + TX からなる物質の群から選択される駆虫剤；

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

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

リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) GV (代替名) (12) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacter*) (代替名) (13) + TX、ムチカブリダニ属 (*Amblyseius* spp.) (代替名) (19) + TX、アナグラファファルシフェラ (*Anagrapa falcifera*) NPV (代替名) (28) + TX、アナグルスアトムス (*Anagrus atomus*) (代替名) (29) + TX、アフエリヌスアブドミナリス (*Aphelinus abdominalis*) (代替名) (33) + TX、アフイジウスコレマニ (*Aphidius colemani*) (代替名) (34) + TX、アフイドレテスアフイジミザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (代替名) (35) + TX、オートグラファカリフォルニカ (*Autographa californica*) NPV (代替名) (38) + TX、バチルスフィルムス (*Bacillus firmus*) (代替名) (48) + TX、バチルススフェリクスネイデ (*Bacillus sphaericus* Neide) (学名) (49) + TX、バチルスチューリンゲンシスベルリナー (*Bacillus thuringiensis* Berliner) (学名) (51) + TX、バチルスチューリンゲンシス亜種アイザワイ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリンゲンシス亜種イスラエンシス (*Bacillus thu*

10

20

30

40

50

ringiensis subsp. *israelensis*) (学名) (51) + TX
 、バチルスチューリングゲンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルス
 チューリングゲンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルスチューリングゲンシス
 亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ビューベリアバシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ビューベリアブロングニアルテ
 イ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、クリ
 ソペラカルネア (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX 10
 、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*)
 (代替名) (178) + TX、コドリング (*Cydia pomonella*) GV (代
 替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代
 替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代
 替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*)
 (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロラブディティスバクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) 及び H. メギディス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、レプトマスティクスダクチロ
 ピ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、
 マクロロフスカリギノス (*Macrolophus caliginosus*) (代替
 名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代
 替名) (494) + TX、メタフィカスヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウムアニソプリエ変種アクリヅム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウムアニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツ
 ノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、オリウス属 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、ペシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シ
 ロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) 多カブシド核多角体病ウイル
 ス (学名) (741) + TX、スタイナーネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマカルポカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナー
 ネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) +
 TX、スタイナーネマグラッセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名 40
) (742) + TX、スタイナーネマリオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマリオブラビス (*Steinernema riobravense*) (代替名) (742) + TX、スタイナーネマスカプテリ
 シ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、
 スタイナーネマ属 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、
 トリコグラムマ属 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX
 、チフロドロムスオシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びバーティシリウムレカニ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤；
 ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX からなる物質 50

の群から選択される土壌滅菌剤；

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

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテート及び (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC 名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC 名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (438) + TX、(Z) - イコサ - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC 名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC 名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC 名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オール及び 4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC 名) (544) + TX、 α - マルチストリアチン（代替名） [CCN] + TX、ブレビコミン（代替名） [CCN] + TX、コドレルア（代替名） [CCN] + TX、コドレモン（代替名） (167) + TX、キュールア（代替名） (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (286) + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (287) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (284) + TX、ドミニカルア（代替名） [CCN] + TX、4 - メチルオクタン酸エチル (IUPAC 名) (317) + TX、オイゲノール（代替名） [CCN] + TX、フロンタリン（代替名） [CCN] + TX、Gossypure（登録商標）（代替名；ヘキサデカ - 7, 11 - ジエン - 1 - イル - アセテートの (Z, E) 及び (Z, Z) 異性体の 1:1 混合物）(420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I（代替名）(421) + TX、グランドルア II（代替名）(421) + TX、グランドルア III（代替名）(421) + TX、グランドルア IV（代替名）(421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イブスジエノール（代替名） [CCN] + TX、イブセノール（代替名） [CCN] + TX、ジャボニルア（代替名）(481) + TX、リネアチン（代替名） [CCN] + TX、リトルア（代替名） [CCN] + TX、ルーブルア（代替名） [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸（代替名） [CCN] + TX、メチルオイゲノール（代替名）(540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (588) + TX、オクタデカ - 3, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC 名) (589) + TX、オルフラルア（代替名） [CCN] + TX、オリクタールア（代替名）(317) + TX、オストラモン（代替名） [CCN] + TX、シグルア [CCN] + TX、ソルジジン（代替名）(736) + TX、スルカトール（代替名） [CCN] + TX、テトラデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテ

ト (I U P A C 名) (7 8 5) + T X、トリメドルア (8 3 9) + T X、トリメドルア A (代替名) (8 3 9) + T X、トリメドルア B₁ (代替名) (8 3 9) + T X、トリメドルア B₂ (代替名) (8 3 9) + T X、トリメドルア C (代替名) (8 3 9) 及びトランク - コール (t r u n c - c a l l) (代替名) [C C N] + T X からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

2 - (オクチルチオ) エタノール (I U P A C 名) (5 9 1) + T X、ブトピロノキシル (9 3 3) + T X、ブトキシ (ポリプロピレングリコール) (9 3 6) + T X、アジピン酸ジブチル (I U P A C 名) (1 0 4 6) + T X、フタル酸ジブチル (1 0 4 7) + T X、コハク酸ジブチル (I U P A C 名) (1 0 4 8) + T X、ジエチルトルアミド [C C N] + T X、ジメチルカルベート [C C N] + T X、フタル酸ジメチル [C C N] + T X、エチルヘキサジオール (1 1 3 7) + T X、ヘキサアミド [C C N] + T X、メトキン - ブチル (1 2 7 6) + T X、メチルネオデカンアミド [C C N] + T X、オキサメート [C C N] 及びピカリジン [C C N] + T X からなる物質の群から選択される昆虫忌避剤

10

、
ビス (トリブチルスズ) オキシド (I U P A C 名) (9 1 3) + T X、プロモアセトアミド [C C N] + T X、ヒ酸カルシウム [C C N] + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、アセト亜ヒ酸銅 [C C N] + T X、硫酸銅 (1 7 2) + T X、フェンチン (3 4 7) + T X、リン酸第二鉄 (I U P A C 名) (3 5 2) + T X、メタアルデヒド (5 1 8) + T X、メチオカルブ (5 3 0) + T X、ニクロサミド (5 7 6) + T X、ニクロサミド - オールアミン (5 7 6) + T X、ペンタクロロフェノール (6 2 3) + T X、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (6 2 3) + T X、タジムカルブ (1 4 1 2) + T X、チオジカルブ (7 9 9) + T X、酸化トリブチルスズ (9 1 3) + T X、トリフェンモルフ (1 4 5 4) + T X、トリメタカルブ (8 4 0) + T X、酢酸トリフェニルスズ (I U P A C 名) (3 4 7) 及び水酸化トリフェニルスズ (I U P A C 名) (3 4 7) + T X、ピリプロール [3 9 4 7 3 0 - 7 1 - 3] + T X からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤

20

、
A K D - 3 0 8 8 (化合物コード) + T X、1, 2 - ジブロモ - 3 - クロロプロパン (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1 0 4 5) + T X、1, 2 - ジクロロプロパン (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1 0 6 2) + T X、1, 2 - ジクロロプロパン及び1, 3 - ジクロロプロペン (I U P A C 名) (1 0 6 3) + T X、1, 3 - ジクロロプロペン (2 3 3) + T X、3, 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン1, 1 - ジオキシド (I U P A C / ケミカルアブストラクツ名) (1 0 6 5) + T X、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルローダニン (I U P A C 名) (9 8 0) + T X、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1, 3, 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸 (I U P A C 名) (1 2 8 6) + T X、6 - イソペンテニルアミノプリン (代替名) (2 1 0) + T X、アバメクチン (1) + T X、アセトプロール [C C N] + T X、アラニカルブ (1 5) + T X、アルジカルブ (1 6) + T X、アルドキシカルブ (8 6 3) + T X、A Z 6 0 5 4 1 (化合物コード) + T X、ベンクロチアズ [C C N] + T X、ベノミル (6 2) + T X、ブチルピリダベン (代替名) + T X、カズサホス (1 0 9) + T X、カルボフラン (1 1 8) + T X、二硫化炭素 (9 4 5) + T X、カルボスルファン (1 1 9) + T X、クロロピクリン (1 4 1) + T X、クロルピリホス (1 4 5) + T X、クロエトカルブ (9 9 9) + T X、シクロブトリフルラム + T X、サイトカイニン (代替名) (2 1 0) + T X、ダゾメット (2 1 6) + T X、D B C P (1 0 4 5) + T X、D C I P (2 1 8) + T X、ジアミダホス (1 0 4 4) + T X、ジクロフェンチオン (1 0 5 1) + T X、ジクリホス (代替名) + T X、ジメトエート (2 6 2) + T X、ドラメクチン (代替名) [C C N] + T X、エマメクチン (2 9 1) + T X、エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + T X、エプリノメクチン (代替名) [C C N] + T X、エトプロホス (3 1 2) + T X、二臭化エチレン (3 1 6) + T X、フェナミホス (3 2 6) + T X、フェンピラド (代替名) + T X、フェンスルホチオン (1 1 5 8) + T X、ホスチアゼート (4 0 8) + T X、ホスチエタン (1 1 9 6) + T X、フルフラール (代替名) [C C N] + T X、G Y - 8 1 (開発コー

30

40

50

ド) (423) + TX、ヘテロホス [CCN] + TX、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) + TX、イサミドホス (1230) + TX、イサゾホス (1231) + TX、イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX、キネチン (代替名) (210) + TX、メカルフォン (1258) + TX、メタム (519) + TX、メタム - カリウム (代替名) (519) + TX、メタム - ナトリウム (519) + TX、臭化メチル (537) + TX、メチルイソチオシアネート (543) + TX、ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX、モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX、クワ暗斑病菌 (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 (代替名) (565) + TX、NC - 184 (化合物コード) + TX、オキサミル (602) + TX、ホレート (636) + TX、ホスファミドン (639) + TX、ホスホカルブ [CCN] + TX、セブホス (代替名) + TX、セラメクチン (代替名) [CCN] + TX、スピノサド (737) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロチオフェン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1422) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チオナジン (1434) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、キシレノール [CCN] + TX、YI - 5302 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (210) + TX、フルエンシルホン [318290 - 98 - 1] + TX、フルオピラム + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤、
 エチルキサントゲン酸カリウム [CCN] 及びニトラピリン (580) + TX からなる物質の群から選択される硝化阻害剤、
 アシベンゾラル (6) + TX、アシベンゾラル - S - メチル (6) + TX、プロベナゾール (658) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、
 2 - イソバレリルインダン - 1, 3 - ジオン (IUPAC 名) (1246) + TX、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC 名) (748) + TX、 α - クロロヒドリン [CCN] + TX、リン化アルミニウム (640) + TX、アンチュ (*antú*) (880) + TX、三酸化二ヒ素 (882) + TX、炭酸バリウム (891) + TX、ビスチオセミ (912) + TX、プロディファコウム (89) + TX、プロマジオロン (アルファ - プロマジオロンを含む) + TX、プロメタリン (92) + TX、シアン化カルシウム (444) + TX、クロラロース (127) + TX、クロロファシノン (140) + TX、コレカルシフェロール (代替名) (850) + TX、クマクロール (1004) + TX、クマフリル (1005) + TX、クマテトラリル (175) + TX、クリミジン (1009) + TX、ジフェナコウム (246) + TX、ジフェチアロン (249) + TX、ジファシノン (273) + TX、エルゴカルシフェロール (301) + TX、フロクマフェン (357) + TX、フルオロアセトアミド (379) + TX、フルプロパダイン (1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩 (1183) + TX、 γ - HCH (430) + TX、HCH (430) + TX、シアン化水素 (444) + TX、ヨードメタン (IUPAC 名) (542) + TX、リンダン (430) + TX、リン化マグネシウム (IUPAC 名) (640) + TX、臭化メチル (537) + TX、ノルボルミド (1318) + TX、ホサセチム (1336) + TX、ホスフィン (IUPAC 名) (640) + TX、リン [CCN] + TX、ピンドン (1341) + TX、亜ヒ酸カリウム [CCN] + TX、ピリヌロン (1371) + TX、シリロシド (1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム [CCN] + TX、シアン化ナトリウム (444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム (735) + TX、ストリキニーネ (745) + TX、硫酸タリウム [CCN] + TX、ワルファリン (851) 及びリン化亜鉛 (640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、
 2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート (IUPAC 名) (934) + TX、5 - (1, 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン (IUPAC 名) (903) + TX、ファルネソール及びネロリドール (代替名) (324) + TX、MB - 599 (開発コード) (498) + TX、MGK 264 (開発コード) (296) + TX、ピペロニルブトキシド (649) + TX、ピプロタル (1

10

20

30

40

50

343) + TX、プロピル異性体(1358) + TX、S421(開発コード)(724) + TX、セサメクス(1393) + TX、セサモリン(1394)及びスルホキシド(1406) + TXからなる物質の群から選択される共力剤、

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

イマニン(代替名)[CCN]及びリバビリン(代替名)[CCN] + TXからなる物質の群から選択される殺ウイルス剤、

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

1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール + TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート + TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-シンナムアルデヒド + TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン + TX、アセトプロール + TX、アルドキシカルブ + TX、アミジチオン + TX、アミドチオエート + TX、アミトン + TX、シュウ酸水素アミトン + TX、アミトラズ + TX、アラマイト + TX、三酸化ヒ素 + TX、アゾベンゼン + TX、アゾトエート + TX、ベノミル + TX、ベノキサホス + TX、ベンジル安息香酸塩 + TX、ピキサフェン + TX、プロフェンバレレート + TX、プロモシクレン + TX、プロモホス + TX、プロモプロピレート + TX、ブプロフェジン + TX、ブトカルボキシム + TX、ブトキシカルボキシム + TX、ブチルピリダベン + TX、多硫酸カルシウム + TX、カンフェクロール + TX、カルパノレート + TX、カルボフェノチオン + TX、シミアゾール + TX、チノメチオナート + TX、クロルベンシド + TX、クロルジメホルム + TX、クロルジメホルムヒドロクロリド + TX、クロルフェネトール + TX、クロルフェンソン + TX、クロロフェンスルフィド + TX、クロロベンジレート + TX、クロロメブホルム + TX、クロロメチウロン + TX、クロロプロピレート + TX、クロルチオホス + TX、シネリンI + TX、シネリンII + TX、シネリンS + TX、クロサンテル + TX、クマホス + TX、クロタミトン + TX、クロトキシホス + TX、クフラエブ + TX、シアントエート + TX、DCPM + TX、DDT + TX、デメフィオン + TX、デメフィオン-O + TX、デメフィオン-S + TX、デメトン-メチル + TX、デメトン-O + TX、デメトン-O-メチル + TX、デメトン-S + TX、デメトン-S-メチル + TX、デメトン-S-メチルスルホン + TX、ジクロフルアニド + TX、ジクロルボス + TX、ジクリホス + TX、ジエノクロル + TX、ジメホクス + TX、ジネクス + TX、ジネクスジクレキシム + TX、ジノカップ-4 + TX、ジノカップ-6 + TX、ジノクトン + TX、ジノペントン + TX、ジノスルホン + TX、ジノテルボン + TX、ジオキサチオン + TX、ジフェニルスルホン + TX、ジスルフィラム + TX、DNOC + TX、ドフェナビン + TX、ドラメクチン + TX、エンドチオン + TX、エピリノメクチン + TX、エトエートメチル + TX、エトリムホス + TX、フェナザフロル + TX、酸化フェンブタスズ + TX、フェノチオカルブ + TX、フェンピラド + TX、フェンピロキシメート + TX、フェンピラザミン + TX、フェンソン + TX、フェントリファニル + TX、フルベンジミン + TX、フルシクロクスロン + TX、フルエネチル + TX、フルオルベンシド + TX、FMC 1137 + TX、ホルメタネート + TX、ホルメタネートヒドロクロリド + TX、ホルムパラネート + TX、γ-HCH + TX、グリオジン + TX、ハルフェンブロクス + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート + TX、イソカルボホス + TX、ジャスモリンI + TX、ジャスモリンII + TX、ジョドフェンホス + TX、リンダン + TX、マロノベン + TX、メカルバム + TX、メホスフォラン + TX、メスルフェン + TX、メタクリホス + TX、臭化メチル + TX、メトルカルブ + TX、メキサカルベート + TX、ミルベマイシンオキシム + TX、ミパホクス + TX、モノクロト

10

20

30

40

50

ホス + T X、モルホチオン + T X、モキシデクチン + T X、ナレド + T X、4 - クロロ -
 2 - (2 - クロロ - 2 - メチル - プロピル) - 5 - [(6 - ヨード - 3 - ピリジル) メト
 キシ] ピリダジン - 3 - オン + T X、ニフルリジド + T X、ニッコマイシン + T X、ニト
 リラカルブ + T X、ニトリラカルブ 1 : 1 塩化亜鉛錯体 + T X、オメトエート + T X、オ
 キシデプロホス + T X、オキシジスルホトン + T X、p p ' - D D T + T X、パラチオン
 + T X、ペルメトリン + T X、フェンカプトン + T X、ホサロン + T X、ホスホラン + T
 X、ホスファミドン + T X、ポリクロロテルペン + T X、ポリナクチン + T X、プロクロ
 ノール + T X、プロマシル + T X、プロボキスル + T X、プロチダチオン + T X、プロト
 エート + T X、ピレトリン I + T X、ピレトリン II + T X、ピレトリン + T X、ピリダ
 フェンチオン + T X、ピリミテート + T X、キナルホス + T X、キンチオホス + T X、R
 - 1 4 9 2 + T X、ホスグリシン + T X、ロテノン + T X、シュラダン + T X、セブホス
 + T X、セラメクチン + T X、ソファミド + T X、S S I - 1 2 1 + T X、スルフィラム
 + T X、スルフラミド + T X、スルホテブ + T X、硫黄 + T X、ジフロビダジン + T X、
 τ - フルバリネート + T X、T E P P + T X、テルバム + T X、テトラジホン + T X、テ
 トラスル + T X、チアフェノクス + T X、チオカルボキシム + T X、チオフアノックス +
 T X、チオメトン + T X、チオキノックス + T X、ツリングエンシン + T X、トリアミホ
 ス + T X、トリアラテン + T X、トリアゾホス + T X、トリアズロン + T X、トリフェノ
 ホス + T X、トリナクチン + T X、バミドチオン + T X、バニリプロール + T X、ベトキ
 サジン + T X、ニオクタノン酸銅 + T X、硫酸銅 + T X、シブトリン + T X、ジクロン +
 T X、ジクロロフェン + T X、エンドタール + T X、フェンチン + T X、消石灰 + T X、
 ナーバム + T X、キノクラミン + T X、キノンアミド + T X、シマジン + T X、酢酸トリ
 フェニルスズ + T X、水酸化トリフェニルスズ + T X、クルホメート + T X、ピペラジン
 + T X、チオフアネート + T X、クロラロース + T X、フェンチオン + T X、ピリジン -
 4 - アミン + T X、ストリキニン + T X、1 - ヒドロキシ - 1 H - ピリジン - 2 - チオン
 + T X、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド + T X、8 - 硫
 酸ヒドロキシキノリン + T X、プロノポール + T X、水酸化銅 + T X、クレゾール + T X
 、ジピリチオン + T X、ドジチン + T X、フェナミノスルフ + T X、ホルムアルデヒド +
 T X、ヒドラルガフェン + T X、カスガマイシン + T X、カスガマイシンヒドロクロリド
 水和物 + T X、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート) + T X、ニトラピリン + T
 X、オクチリノン + T X、オキソリン酸 + T X、オキシテトラサイクリン + T X、硫酸ヒ
 ドロキシキノリンカリウム + T X、プロベナゾール + T X、ストレプトマイシン + T X、
 ストレプトマイシンセスキスルフェート + T X、テクロフタラム + T X、チオメルサール
 + T X、リングコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) G V + T X、ア
 グロバクテリウムラジオバクター (*Agrobacterium radiobacte*
r) + T X、アムブリセイウス属の種 (*Amblyseius spp.*) + T X、ア
 ナグラファファルシフェラ (*Anagrapta falcifera*) N P V + T X、
 アングルスアトムス (*Anagrus atomus*) + T X、アブラコバチ (*Aphe*
linus abdominalis) + T X、コレマンアブラバチ (*Aphidius*
colemani) + T X、ショクガタマバエ (*Aphidoletes aphidi*
myza) + T X、オートグラファカリホルニカ (*Autographa califo*
rnic) N P V + T X、バチルススファエリクス (*Bacillus sphaer*
icus Neide) + T X、ベアウベリアブロングニアルチイ (*Beauveria*
brongniartii) + T X、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla c*
arne) + T X、ツマアカオオヒメテントウ (*Cryptolaemus mont*
rouzieri) + T X、コドリングア (*Cydia pomonella*) G V + T X
 、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) + T X、イサエアヒメコバ
 チ (*Diglyphus isaea*) + T X、オンシツツヤコバチ (*Encarsia*
formosa) + T X、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicu*
s) + T X、ヘテロルハブジチスバクテリオホラ (*Heterorhabditis b*
acteriophora) 及び H . メギジス (*H. megidis*) + T X、ヒポダミ

10

20

30

40

50

アコンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) + TX、フジコナヒ
 ゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) + TX、マクロロ
 フスカリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) + TX、
 ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV + TX、メタフィクスヘルボ
 ルス (*Metaphycus helvolus*) + TX、メタリジウムアニソプリエ変
 種アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) + TX、メタリジウムアニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium a*
nisopliae var. *anisopliae*) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV 及び N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV + TX、ヒメハナカメムシ属の種 (*Orius* spp.) + TX、バエシロマ
 イセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX
 、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) + TX、ステイ
 ネルネマビビオニス (*Steinernema bibionis*) + TX、ステイネル
 ネマカルボカプサエ (*Steinernema carpocapsae*) + TX、ステ
 イネルネマフェルチアエ (*Steinernema feltiae*) + TX、ステイネル
 ネマグラセリ (*Steinernema glaseri*) + TX、ステイネルネマリ
 オブラエb (*Steinernema riobrave*) + TX、ステイネルネマリオ
 ブラビス (*Steinernema riobravis*) + TX、ステイネルネマスカ
 プテリスキ (*Steinernema scapterisci*) + TX、ステイネルネ
 マ属の種 (*Steinernema* spp.) + TX、トリコグラマ属の種 (*Tric*
hogramma spp.) + TX、チフロドロムスオクシデンタリス (*Typhlo*
dromus occidentalis) + TX、ベルチシリウムレカニイ (*Vert*
icillium lecanii) + TX、アホレート + TX、ピサジル + TX、ブス
 ルファン + TX、ジマチフ + TX、ヘメル + TX、ヘムパ + TX、メテパ + TX、メチオ
 テパ + TX、メチルアホレート + TX、モルジド + TX、ペンフルロン + TX、テパ + T
 X、チオヘムパ + TX、チオテパ + TX、トレタミン + TX、ウレデパ + TX、(E) -
 デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートと (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2
 - エン - 4 - オール + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセ
 テート + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート + TX、(Z) - ヘキサ
 デカ - 11 - エナル + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート + T
 X、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート + TX、(Z)
 - イコサ - 13 - エン - 10 - オン + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アル +
 TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エ
 ン - 1 - イルアセテート + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルア
 セテート + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテ
 ート + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールと 4 - メ
 チルノナン - 5 - オン + TX、 α - ムルチストリアチン + TX、ブレビコミン + TX、コ
 ドレルレ + TX、コドレモン + TX、クエルレ + TX、ジスパールア + TX、ドデカ - 8
 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ドデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート + TX、ド
 デカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、ドミニカルア + TX、エチ
 ル4 - メチルオクタノエート + TX、オイゲノール + TX、フロンタリン + TX、グラン
 ドルア + TX、グランドルア I + TX、グランドルア II + TX、グランドルア III +
 TX、グランドルア IV + TX、ヘキササルア + TX、イブスジエノール + TX、イブセノ
 ール + TX、ジャボニルア + TX、リネアチン + TX、リトルア + TX、ルーブルア + T
 X、メドルア + TX、メガトモ酸 + TX、メチルオイゲノール + TX、ムスカルア + TX
 、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オクタデカ - 3, 13 -
 ジエン - 1 - イルアセテート + TX、オルフラルア + TX、オリクタルア + TX、オスト
 ラモン + TX、シグルア + TX、ソルジジン + TX、スルカトール + TX、テトラデカ -

10

20

30

40

50

1 1 - エン - 1 - イルアセテート + T X、トリメドルア + T X、トリメドルア A + T X、
 トリメドルア B₁ + T X、トリメドルア B₂ + T X、トリメドルア C + T X、トランク -
 コール (t r u n c - c a l l) + T X、2 - (オクチルチオ) - エタノール + T X、ブ
 タピロノキシル + T X、プトキシ (ポリプロピレングリコール) + T X、ジブチルアジペ
 ート + T X、フタル酸ジブチル + T X、ジブチルコハク酸塩 + T X、ジエチルトルアミド
 + T X、ジメチルカルベート + T X、ジメチルフタレート + T X、エチルヘキサンジオー
 ル + T X、ヘキサミド + T X、メトキン - ブチル + T X、メチルネオデカンアミド + T X
 、オキサメート + T X、ピカリジン + T X、1 - ジクロロ - 1 - ニトロエタン + T X、1
 , 1 - ジクロロ - 2 , 2 - ビス (4 - エチルフェニル) - エタン + T X、1 , 2 - ジクロ
 ロプロパンと 1 , 3 - ジクロロプロペン + T X、1 - ブロモ - 2 - クロロエタン + T X、
 2 , 2 , 2 - トリクロロ - 1 - (3 , 4 - ジクロロフェニル) 酢酸エチル + T X、2 , 2
 - ジクロロビニル 2 - エチルスルフィニルエチルメチルリン酸塩 + T X、2 - (1 , 3 -
 ジチオラン - 2 - イル) フェニルジメチルカルバメート + T X、2 - (2 - ブトキシエト
 キシ) エチルチオシアネート + T X、2 - (4 , 5 - ジメチル - 1 , 3 - ジオキソラン -
 2 - イル) フェニルメチルカルバメート + T X、2 - (4 - クロロ - 3 , 5 - キシリルオ
 キシ) エタノール + T X、2 - クロロビニルジエチルリン酸塩 + T X、2 - イミダゾリド
 ン + T X、2 - イソバレリルインダン - 1 , 3 - ジオン + T X、2 - メチル (プロブ - 2
 - イニル) アミノフェニルメチルカルバメート + T X、2 - チオシアナトエチルラウレ
 ート + T X、3 - ブロモ - 1 - クロロプロブ - 1 - エン + T X、3 - メチル - 1 - フェニル
 ピラゾール - 5 - イルジメチルカルバメート + T X、4 - メチル (プロブ - 2 - イニル)
 アミノ - 3 , 5 - キシリルメチルカルバメート + T X、5 , 5 - ジメチル - 3 - オキソシ
 クロヘキサ - 1 - エニルジメチルカルバメート + T X、アセチオン + T X、アクリロニト
 リル + T X、アルドリン + T X、アロサミジン + T X、アリキシカルブ + T X、α - エク
 ジソン + T X、リン化アルミニウム + T X、アミノカルブ + T X、アナバシン + T X、ア
 チダチオン + T X、アザメチホス + T X、パチルスチューリングゲンシス (B a c i l l u s
 t h u r i n g i e n s i s) δ エンドトキシン + T X、バリウムヘキサフルオロシ
 リケート + T X、バリウムポリスルフィド + T X、バルトリン + T X、バイエル 2 2 / 1
 9 0 + T X、バイエル 2 2 4 0 8 + T X、β - シフルトリン + T X、β - シペルメトリン
 + T X、バイオエタノメトリン + T X、ピオパーメトリン + T X、ビス (2 - クロロエチ
 ル) エーテル + T X、ホウ酸ナトリウム + T X、ブロムフェンビンホス + T X、ブロモ -
 D D T + T X、ブフェンカルブ + T X、ブタカルブ + T X、ブタチオホス + T X、プトネ
 ート + T X、ヒ酸カルシウム + T X、シアン化カルシウム + T X、二硫化炭素 + T X、四
 塩化炭素 + T X、カルタップヒドロクロリド + T X、セバジン + T X、クロルピシクレン
 + T X、クロルダン + T X、クロルデコン + T X、クロロホルム + T X、クロルピクリン
 + T X、クロルホキシム + T X、クロルプラゾホス + T X、シス - レスメスリン + T X、
 シスメトリン + T X、クロシトリン + T X、アセト亜ヒ酸銅 + T X、ヒ酸銅 + T X、オレ
 イン酸銅 + T X、クミトエート + T X、氷晶石 + T X、C S 7 0 8 + T X、シアノフェン
 ホス + T X、シアノホス + T X、シクレトリン + T X、シチオエート + T X、d - テトラ
 メトリン + T X、D A E P + T X、ダゾメット + T X、デカルボフラン + T X、ジアミダ
 ホス + T X、ジカプトン + T X、ジクロロフェンチオン + T X、ジクレシル + T X、ジシ
 クラニル + T X、ディルドリン + T X、ジエチル 5 - メチルピラゾール - 3 - イルリン酸
 塩 + T X、ジロール + T X、ジメフルトリン + T X、ジメタン + T X、ジメトリン + T X
 、ジメチルビンホス + T X、ジメチラン + T X、ジノプロブ + T X、ジノサム + T X、ジ
 ノセブ + T X、ジオフェノラン + T X、ジオキサベンゾホス + T X、ジチクロホス + T X
 、
 D S P + T X、エクジステロン + T X、E I 1 6 4 2 + T X、E M P C + T X、E P B
 P + T X、エタホス + T X、エチオフェンカルブ + T X、ギ酸エチル + T X、エチレンジ
 プロミド + T X、ジクロロエタン + T X、エチレンオキシド + T X、E X D + T X、フェ
 ンクロルホス + T X、フェネタカルブ + T X、フェニトロチオン + T X、フェノキサクリ
 ム + T X、フェンピリトリン + T X、フェンスルホチオン + T X、フェンチオン - エチル

10

20

30

40

50

+ T X、フルコフロン + T X、ホスメチラン + T X、ホスピレート + T X、ホスチエタン
 + T X、フラチオカルブ + T X、フレトリン + T X、グアザチン + T X、グアザチン酢酸
 塩 + T X、ナトリウムテトラチオカルボネート + T X、ハルフェンプロクス + T X、H C
 H + T X、H E O D + T X、ヘプタクロール + T X、ヘテロホス + T X、H H D N + T X
 、シアン化水素 + T X、ヒキンカルブ + T X、I P S P + T X、イサゾホス + T X、イソ
 ベンザン + T X、イソドリン + T X、イソフェンホス + T X、イソラン + T X、イソプロ
 チオラン + T X、イソキサチオン + T X、幼虫ホルモン I + T X、幼虫ホルモン I I + T
 X、幼虫ホルモン I I I + T X、ケレバン + T X、キノブレン + T X、砒酸鉛 + T X、レ
 プトホス + T X、リリムホス + T X、リチダチオン + T X、m - クメニルメチルカルバメ
 ート + T X、リン化マグネシウム + T X、マジドクス + T X、メカルホン + T X、メナゾ
 ン + T X、塩化第一水銀 + T X、メスルフェンホス + T X、メタム + T X、メタム - カリ
 ウム + T X、メタム - ナトリウム + T X、メタンフッ化スルホニル + T X、メトクロトホ
 ス + T X、メトブレン + T X、メトトリン + T X、メトキシクロル + T X、メチルイソチ
 オシアネート + T X、メチルククロホルム + T X、塩化メチレン + T X、メトキサジアゾ
 ン + T X、ミレックス + T X、ナフタロホス + T X、ナフタレン + T X、N C - 1 7 0 +
 T X、ニコチン + T X、ニコチンスルフェート + T X、ニチアジン + T X、ノルニコチン
 + T X、O - 5 - ジクロロ - 4 - ヨードフェニル O - エチルエチルホスホノチオエート +
 T X、O , O - ジエチル O - 4 - メチル - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 7 - イルホスホ
 ロチオネート + T X、O , O - ジエチル O - 6 - メチル - 2 - プロピルピリミジン - 4 -
 イルホスホロチオネート + T X、O , O , O ' , O ' - テトラプロピルジチオピロホスフェ
 ート + T X、オレイン酸 + T X、パラ - ジクロロベンゼン + T X、パラチオン - メチル +
 T X、ペンタクロロフェノール + T X、ラウリン酸ペンタクロロフェニル + T X、P H
 6 0 - 3 8 + T X、フェンカプトン + T X、ホスニクロル + T X、ホスフィン + T X、ホ
 キシム - メチル + T X、ピリメタホス + T X、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体 +
 T X、亜ヒ酸カリウム + T X、カリウムチオシアネート + T X、プレコセン I + T X、プ
 レコセン I I + T X、プレコセン I I I + T X、ピリミドホス + T X、プロフルトリン +
 T X、プロメカルブ + T X、プロチオホス + T X、ピラゾホス + T X、ピレスメトリン +
 T X、カッシア + T X、キナルホス - メチル + T X、キノチオン + T X、ラホキサニド +
 T X、レスメスリン + T X、ロテノン + T X、カデトリン + T X、リアニア + T X、リア
 ノジン + T X、サバジラ) + T X、シュラダン + T X、セブホス + T X、S I - 0 0 0 9
 + T X、チアプロニル + T X、亜ヒ酸ナトリウム + T X、シアン化ナトリウム + T X、ナ
 トリウムフッ化物 + T X、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム + T X、ペンタクロロフェノ
 キシドナトリウム塩 + T X、セレン酸ナトリウム + T X、チオシアン酸ナトリウム + T X
 、スルコフロン + T X、スルコフロン - ナトリウム + T X、スルフリルフッ化物 + T X、
 スルプロホス + T X、タール油 + T X、チオナジン + T X、T D E + T X、テブピリムホ
 ス + T X、テメホス + T X、テラレスリン + T X、テトラクロロエタン + T X、チクロホ
 ス + T X、チオシクラム + T X、チオシクラム水素オキサレート + T X、チオナジン + T
 X、チオスルタップ + T X、チオスルタップ - ナトリウム + T X、トラロメトリン + T X
 、トランスパーメトリン + T X、トリアザメート + T X、トリクロルメタホス - 3 + T X
 、トリクロロナト + T X、トリメタカルブ + T X、トルプロカルブ + T X、トリクロピリ
 カルブ + T X、トリブレン + T X、ベラトリジン + T X、ベラトリン + T X、X M C + T
 X、γメトリン + T X、亜鉛ホスフィド + T X、ゾラプロホス + T X、メベルフルトリン
 + T X、テトラメチルフルトリン + T X、ビス (トリブチルスズ) オキシド + T X、プロ
 モアセタミド + T X、第二鉄リン酸塩 + T X、ニクロスアミド - オラミン + T X、酸化ト
 リブチルスズ + T X、ピリモルフ + T X、トリフェンモルフ + T X、1 , 2 - ジブromo -
 3 - クロロプロパン + T X、1 , 3 - ジクロロプロベン + T X、3 , 4 - ジクロロテトラ
 ヒドロチオフエン 1 , 1 - ジオキシド + T X、3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチル
 ロダニン + T X、5 - メチル - 6 - チオキソ - 1 , 3 , 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢
 酸 + T X、6 - イソペンテニルアミノプリン + T X、アニシフルプリン + T X、ベンクロ
 チアズ + T X、サイトカニン + T X、D C I P + T X、ルフラール + T X、イサミドホ

10

20

30

40

50

ス + T X、カイネチン + T X、ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 組成物 + T X、テトラクロロチオフエン + T X、キシレノルス + T X、ゼアチン + T X、エチルキサントゲン酸カリウム + T X、アシベンゾラル + T X、アシベンゾラル - S - メチル + T X、オオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 + T X、 α - クロロヒドリン + T X、アンツ + T X、炭酸バリウム + T X、ビスチオセミ + T X、プロジファクム + T X、プロマジオロン + T X、プロメタリン + T X、クロロファシノン + T X、コレカルシフェロール + T X、クマクロル + T X、クマフリル + T X、クマテトラリル + T X、クリミジン + T X、ジフェナクム + T X、ジフェチアロン + T X、ジファシノン + T X、エルゴカルシフェロール + T X、フロクマフェン + T X、フルオロアセタミド + T X、フルプロバジン + T X、フルプロバジンヒドロクロリド + T X、ノルボルミド + T X、ホスアセチム + T X、リン + T X、ピンドン + T X、ピリヌロン + T X、シリロシド + T X、 - フルオロ酢酸ナトリウム + T X、硫酸タリウム + T X、ワルファリン + T X、 - 2 - (2 - ブトキシエトキシ) エチルピペロニレート + T X、5 - (1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イル) - 3 - ヘキシルシクロヘキサ - 2 - エノン + T X、ファルネソールとネロリドール + T X、ベルブチン + T X、M G K 264 + T X、ピペロニルブトキシド + T X、ピプロタール + T X、プロピル異性体 + T X、S 421 + T X、セサメックス + T X、セサスモリン + T X、スルホキシド + T X、アントラキノン + T X、ナフテン酸銅 + T X、オキシ塩化銅 + T X、ジシクロペンタジエン + T X、チラム + T X、ナフテン酸亜鉛 + T X、ジラム + T X、イマニン + T X、リバピリン + T X、クロロインコナジド + T X、酸化水銀 (I I) + T X、チオファネート - メチル + T X、アザコナゾール + T X、ピテルタノール + T X、プロムコナゾール + T X、シプロコナゾール + T X、ジフェノコナゾール + T X、ジニコナゾール + T X、エポキシコナゾール + T X、フェンブコナゾール + T X、フルキンコナゾール + T X、フルシラゾール + T X、フルトリアホール + T X、フラメトピル + T X、ヘキサコナゾール + T X、イマザリル + T X、イミベンコナゾール + T X、イブコナゾール + T X、メトコナゾール + T X、ミクロブタニル + T X、パクロブトラゾール + T X、ペフラゾエート + T X、ペンコナゾール + T X、プロチオコナゾール + T X、ピリフェノックス + T X、プロクロラズ + T X、プロピコナゾール + T X、ピリソキサゾール + T X、 - シメコナゾール + T X、テブコナゾール + T X、テトラコナゾール + T X、トリアジメホン + T X、トリアジメノール + T X、トリフルミゾール + T X、トリチコナゾール + T X、アンシミドール + T X、フェナリモル + T X、ヌアリモル + T X、ブピリメート + T X、ジメチリモール + T X、エチリモール + T X、ドデモルフ + T X、フェンプロピジン + T X、フェンプロピモルフ + T X、スピロキサミン + T X、トリデモルフ + T X、シプロジニル + T X、メバニピリム + T X、ピリメタニル + T X、フェンピクロニル + T X、フルジオキソニル + T X、ベナラキシル + T X、フララキシル + T X、メタラキシル + T X、R - メタラキシル + T X、オフレース + T X、オキサジキシル + T X、カルベンダジム + T X、デバカルブ + T X、フベリダゾール + T X、チアベンダゾール + T X、クロゾリネート + T X、ジクロゾリン + T X、ミクロゾリン + T X、プロシミドン + T X、ピンクロゾリン + T X、ボスカリド + T X、カルボキシン + T X、フェンフラム + T X、フルトラニル + T X、メプロニル + T X、オキシカルボキシン + T X、ペンチオピラド + T X、チフルザミド + T X、ドジン + T X、イミノクタジン + T X、アゾキシストロビン + T X、ジモキシストロビン + T X、エネストロプリン + T X、フェナミンストロビン + T X、フルフェノキシストロビン + T X、フルオキサストロビン + T X、クレソキシム - メチル + T X、メトミノストロビン + T X、トリフロキシストロビン + T X、オリザストロビン + T X、ピコキシストロビン + T X、ピラクロストロビン + T X、ピラメトストロビン + T X、ピラオキシストロビン + T X、フェルバム + T X、マンコゼブ + T X、マンネブ + T X、メチラム + T X、プロピネブ + T X、ジネブ + T X、カプタホール + T X、キャプタン + T X、フルオロイミド + T X、ホルベット + T X、トリルフルアニド + T X、ボルドー液 + T X、酸化銅 + T X、マンカップー + T X、オキシシン銅 + T X、ニトロタル - イソプロピル + T X、エディフェンホス + T X、イプロベンホス + T X、ホスジフェン + T X、トルコホ

10

20

30

40

50

ス - メチル + T X、アニラジン + T X、ベンチアバリカルブ + T X、ブラストサイジン -
 S + T X、クロロネブ + T X、クロロタロニル + T X、シフルフェナミド + T X、シモキ
 サニル + T X、ジクロシメット + T X、ジクロメジン + T X、ジクロラン + T X、ジエト
 フェンカルブ + T X、ジメトモルフ + T X、フルモルフ + T X、ジチアノン + T X、エタ
 ボキサム + T X、エトリジアゾール + T X、ファミキサドン + T X、フェンアミドン + T
 X、フェノキサニル + T X、フェリムゾン + T X、フルアジナム + T X、フルメチルスル
 ホリム + T X、フルオピコリド + T X、フルオキシチオコナゾール + T X、フルスルファ
 ミド + T X、フルキサピロキサド + T X、- フェンヘキサミド + T X、ホセチル - アルミ
 ニウム + T X、ヒメキサゾール + T X、イプロバリカルブ + T X、シアゾファミド + T X
 、メタスルホカルブ + T X、メトラフェノン + T X、ベンシクロン + T X、フタリド + T
 X、ポリオキシシン + T X、プロパモカルブ + T X、ピリベンカルブ + T X、プロキナジド
 + T X、ピロキロン + T X、ピリオフェノン + T X、キノキシフェン + T X、キントゼン
 + T X、チアジニル + T X、トリアゾキシド + T X、トリシクラゾール + T X、トリホリ
 ン + T X、バリダマイシン + T X、バリフェナレート + T X、ゾキサミド + T X、マンジ
 プロバミド + T X、イソピラザム + T X、セダキサン + T X、ベンゾビンジフルピル + T
 X、ピジフルメトフェン + T X、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール
 - 4 - カルボン酸 (3 ' , 4 ' , 5 ' - トリフルオロ - ビフェニル - 2 - イル) - アミド +
 T X、イソフルシブラム + T X、イソチアニル + T X、ジピメチトロン + T X、6 - エチ
 ル - 5 , 7 - ジオキソ - ピロロ [4 , 5] [1 , 4] ジチイノ [1 , 2 - c] イソチアゾ
 ール - 3 - カルボニトリル + T X、2 - (ジフルオロメチル) - N - [3 - エチル - 1 ,
 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X、4 - (2 ,
 6 - ジフルオロフェニル) - 6 - メチル - 5 - フェニル - ピリダジン - 3 - カルボニトリ
 ル + T X、(R) - 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 + T X、4 - (2 - プロモ -
 4 - フルオロ - フェニル) - N - (2 - クロロ - 6 - フルオロ - フェニル) - 2 , 5 - ジ
 メチル - ピラゾール - 3 - アミン + T X、4 - (2 - プロモ - 4 - フルオロフェニル) -
 N - (2 - クロロ - 6 - フルオロフェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 1 H - ピラゾール - 5
 - アミン + T X、フルインダピル + T X、クメトキシストロピン (ジアキシアングジュン
 ジ (j i a x i a n g j u n z h i)) + T X、ルベンミキシアナン (l v b e n m i x
 i a n a n) + T X、ジクロベンチアゾクス + T X、マンデストロピン + T X、3 - (4
 , 4 - ジフルオロ - 3 , 4 - ジヒドロ - 3 , 3 - ジメチルイソキノリン - 1 - イル) キノ
 ロン + T X、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 + T X、オキサチアピプロリン + T X、t - ブ
 チル N - [6 - [[(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 + T X、ピラジフルミド + T X、イ
 ンビルフルキサム + T X、ツロールプロカルブ + T X、メフェントリフルコナゾール + T
 X、イブフェントリフルコナゾール + T X、2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 R)
 - 3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド
 + T X、N ' - (2 , 5 - ジメチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メ
 チル - ホルムアミジン + T X、N ' - [4 - (4 , 5 - ジクロロチアゾール - 2 - イル)
 オキシ - 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 + T
 X、[2 - [3 - [2 - [1 - [2 - [3 , 5 - ビス (ジフルオロメチル) ピラゾール -
 1 - イル] アセチル] - 4 - ピペリジル] チアゾール - 4 - イル] - 4 , 5 - ジヒドロイ
 ソキサゾール - 5 - イル] - 3 - クロロ - フェニル] メタンスルホン酸 + T X、ブタ - 3
 - イニル 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 + T X、メチル N - [
 [5 - [4 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) トリアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - フ
 エニル] メチル] カルバメート + T X、3 - クロロ - 6 - メチル - 5 - フェニル - 4 - (2 ,
 4 , 6 - トリフルオロフェニル) ピリダジン + T X、ピリダクロメチル + T X、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

10

20

30

40

50

] ピラゾール - 4 - カルボキサミド + TX、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
 ザール - 5 - オン + TX、1 - メチル - 4 - [3 - メチル - 2 - [[2 - メチル - 4 - (3 , 4 , 5 - トリメチルピラゾール - 1 - イル) フェノキシ] メチル] フェニル] テトラ
 ザール - 5 - オン + TX、アミノピリフェン + TX、アメトクトラジン + TX、アミスル
 ブロム + TX、ペンフルフェン + TX、(Z , 2 E) - 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 + TX、フロリルピコキサミド + TX、フェンピコキサミド + TX、メタリ
 ルピコキサミド + TX、テブフロキン + TX、イブプルフェノキン + TX、キノフメリン
 + TX、イソフェタミド + TX、エチル 1 - [[4 - [[2 - (トリフルオロメチル) - 10
 1 , 3 - ジオキソラン - 2 - イル] メトキシ] フェニル] メチル] ピラゾール - 3 - カル
 ボキシレート + TX (国際公開第 2 0 2 0 / 0 5 6 0 9 0 号に記載の方法で調製され得る)、
 エチル 1 - [[4 - [(Z) - 2 - エトキシ - 3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロブ -
 1 - エノキシ] フェニル] メチル] ピラゾール - 3 - カルボキシレート + TX (国際公開
 第 2 0 2 0 / 0 5 6 0 9 0 号に記載の方法で調製され得る)、メチル N - [[4 - [1 -
 (4 - シクロプロピル - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) ピラゾール - 4 - イル] - 2 -
 メチル - フェニル] メチル] カルバメート + TX (国際公開第 2 0 2 0 / 0 9 7 0 1 2 号
 に記載の方法で調製され得る)、メチル N - [[4 - [1 - (2 , 6 - ジフルオロ - 4 -
 イソプロピル - フェニル) ピラゾール - 4 - イル] - 2 - メチル - フェニル] メチル] カ
 ルバメート + TX (国際公開第 2 0 2 0 / 0 9 7 0 1 2 号に記載の方法で調製され得る) 20
 、6 - クロロ - 3 - (3 - シクロプロピル - 2 - フルオロ - フェノキシ) - N - [2 - (2 , 4 -
 ジメチルフェニル) - 2 , 2 - ジフルオロ - エチル] - 5 - メチル - ピリダジン
 - 4 - カルボキサミド + TX (国際公開第 2 0 2 0 / 1 0 9 3 9 1 号に記載の方法で調製
 され得る)、6 - クロロ - N - [2 - (2 - クロロ - 4 - メチル - フェニル) - 2 , 2 -
 ジフルオロ - エチル] - 3 - (3 - シクロプロピル - 2 - フルオロ - フェノキシ) - 5 -
 メチル - ピリダジン - 4 - カルボキサミド + TX (国際公開第 2 0 2 0 / 1 0 9 3 9 1 号
 に記載の方法で調製され得る)、6 - クロロ - 3 - (3 - シクロプロピル - 2 - フルオロ
 - フェノキシ) - N - [2 - (3 , 4 - ジメチルフェニル) - 2 , 2 - ジフルオロ - エチ
 ル] - 5 - メチル - ピリダジン - 4 - カルボキサミド + TX (国際公開第 2 0 2 0 / 1 0
 9 3 9 1 号に記載の方法で調製され得る)、N - [2 - [2 , 4 - ジクロロ - フェノキシ 30
] フェニル] - 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 + TX、N - [2 - [2 - クロロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル
] - 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 + TX、
 ベンゾチオストロピン + TX、フェナマクリル + TX、5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジ
 アゾール - 2 - チオール亜鉛塩 (2 : 1) + TX、フルオピラム + TX、フルフェノキサ
 ジアザム + TX、フルチアニル + TX、フルオピモミド + TX、ピラプロポイン + TX、
 ピカルブトラゾクス + TX、2 - (ジフルオロメチル) - N - (3 - エチル - 1 , 1 - ジ
 メチル - インダン - 4 - イル) ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、2 - (ジフルオロ
 メチル) - N - ((3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピリジン - 3
 - カルボキサミド + TX、4 - [[6 - [2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - 1 , 1 40
 - ジフルオロ - 2 - ヒドロキシ - 3 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル
] - 3 - ピリジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、メチルテトラプロール + TX、2 -
 (ジフルオロメチル) - N - ((3 R) - 1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル)
 ピリジン - 3 - カルボキサミド + TX、 α - (1 , 1 - ジメチルエチル) - α - [4 ' -
 (トリフルオロメトキシ) [1 , 1 ' - ビフェニル] - 4 - イル] - 5 - ピリミジンメタ
 ノール + TX、フルオキサピプロリン + TX、エノキサストロピン + TX、メチル (Z)
 - 3 - メトキシ - 2 - [2 - メチル - 5 - [4 - (トリフルオロメチル) トリアゾール -
 2 - イル] フェノキシ] プロブ - 2 - エノエート + TX、メチル (Z) - 3 - メトキシ -
 2 - [2 - メチル - 5 - (4 - プロピルトリアゾール - 2 - イル) フェノキシ] プロブ -
 2 - エノエート + TX、メチル (Z) - 2 - [5 - (3 - イソプロピルピラゾール - 1 - 50

イル) - 2 - メチル - フェノキシ] - 3 - メトキシ - プロブ - 2 - エノエート + TX、メ
 チル(Z) - 3 - メトキシ - 2 - [2 - メチル - 5 - (3 - プロピルピラゾール - 1 - イ
 ル) フェノキシ] プロブ - 2 - エノエート + TX、メチル(Z) - 3 - メトキシ - 2 - [
 2 - メチル - 5 - [3 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 1 - イル] フェノキシ] プ
 ロブ - 2 - エノエート + TX (これらの化合物は、国際公開第2020/079111号
 に記載の方法で調製され得る)、メチル(Z) - 2 - (5 - シクロヘキシル - 2 - メチル
 - フェノキシ) - 3 - メトキシ - プロブ - 2 - エノエート + TX、メチル(Z) - 2 - (
 5 - シクロペンチル - 2 - メチル - フェノキシ) - 3 - メトキシ - プロブ - 2 - エノエ
 ート + TX (これらの化合物は、国際公開第2020/193387号に記載の方法で調製
 され得る)、4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ
 - 2 - ヒドロキシ - 3 - (1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリ
 ジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロ
 キシ - 3 - (5 - スルファニル - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリ
 ジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、
 4 - [[6 - [2 - (2, 4 - ジフルオロフェニル) - 1, 1 - ジフルオロ - 2 - ヒドロ
 キシ - 3 - (5 - チオキソ - 4H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロピル] - 3 - ピリ
 ジル] オキシ] ベンゾニトリル + TX、トリネキサパック + TX、クモキシスト
 ロピン + TX、チョンサンマイシン(zhongshengmycin) + TX、チオジ
 アゾール銅 + TX、亜鉛チアゾール + TX、アメクトラクチン + TX、イプロジオン +
 TX、セボクチルアミン + TX; N' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - [(1S) - 1
 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ] - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホ
 ルムアミジン + TX、N' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - [(1R) - 1 - メチル -
 2 - プロボキシ - エトキシ] - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジ
 ン + TX、N' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロボキシ - エト
 キシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [5
 - クロロ - 2 - メチル - 6 - (1 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル
] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + TX、N' - [5 - ブロモ - 2 - メチル
 - 6 - (1 - メチル - 2 - プロボキシ - エトキシ) - 3 - ピリジル] - N - イソプロピル
 - N - メチル - ホルムアミジン + TX (これらの化合物は、国際公開第2015/155
 075号に記載の方法で調製され得る); N' - [5 - ブロモ - 2 - メチル - 6 - (2 -
 プロボキシプロボキシ) - 3 - ピリジル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン +
 TX (この化合物は、IPC000249876Dに記載の方法により調製され得る)
 ; N - イソプロピル - N' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - (2, 2, 2 - トリフ
 ルオロ - 1 - ヒドロキシ - 1 - フェニル - エチル) フェニル] - N - メチル - ホルムアミ
 ジン + TX、N' - [4 - (1 - シクロプロピル - 2, 2, 2 - トリフルオロ - 1 - ヒド
 ロキシ - エチル) - 5 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル] - N - イソプロピル - N - メ
 チル - ホルムアミジン + TX (これらの化合物は、国際公開第2018/228896号
 に記載の方法で調製され得る); N - エチル - N' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 -
 [(2 - トリフルオロメチル) オキセタン - 2 - イル] フェニル] - N - メチル - ホルム
 アミジン + TX、N - エチル - N' - [5 - メトキシ - 2 - メチル - 4 - [(2 - トリフ
 ルオロメチル) テトラヒドロフラン - 2 - イル] フェニル] - N - メチル - ホルムアミジ
 ン + TX (これらの化合物は、国際公開第2019/110427号に記載の方法で調製
 され得る); N - [(1R) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - プタ - 3 - エニ
 ル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1S) - 1 - ベン
 ジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - プタ - 3 - エニル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カ
 ルボキサミド + TX、N - [(1R) - 1 - ベンジル - 3, 3, 3 - トリフルオロ - 1 -
 メチル - プロピル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1
 S) - 1 - ベンジル - 3, 3, 3 - トリフルオロ - 1 - メチル - プロピル] - 8 - フルオ
 ロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1R) - 1 - ベンジル - 1, 3 - ジ
 メチル - プチル] - 7, 8 - ジフルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [

(1S) - 1 - ベンジル - 1, 3 - ジメチル - ブチル] - 7, 8 - ジフルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、8 - フルオロ - N - [(1R) - 1 - [(3 - フルオロフェニル)メチル] - 1, 3 - ジメチル - ブチル]キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、8 - フルオロ - N - [(1S) - 1 - [(3 - フルオロフェニル)メチル] - 1, 3 - ジメチル - ブチル]キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1R) - 1 - ベンジル - 1, 3 - ジメチル - ブチル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - [(1S) - 1 - ベンジル - 1, 3 - ジメチル - ブチル] - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - ((1R) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - ブタ - 3 - エニル) - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX、N - ((1S) - 1 - ベンジル - 3 - クロロ - 1 - メチル - ブタ - 3 - エニル) - 8 - フルオロ - キノリン - 3 - カルボキサミド + TX (これらの化合物は、国際公開第 2017/153380 号に記載の方法で調製され得る)；1 - (6, 7 - ジメチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 3 - イル) - 4, 4, 5 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、1 - (6, 7 - ジメチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 3 - イル) - 4, 4, 6 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (6 - メチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 3 - イル)イソキノリン + TX、4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (7 - メチルピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 3 - イル)イソキノリン + TX、1 - (6 - クロロ - 7 - メチル - ピラゾロ[1, 5 - a]ピリジン - 3 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン + TX (これらの化合物は、国際公開第 2017/025510 号に記載の方法で調製され得る)；1 - (4, 5 - ジメチルベンズイミダゾール - 1 - イル) - 4, 4, 5 - トリフルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、1 - (4, 5 - ジメチルベンズイミダゾール - 1 - イル) - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、6 - クロロ - 4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - (4 - メチルベンズイミダゾール - 1 - イル)イソキノリン + TX、4, 4 - ジフルオロ - 1 - (5 - フルオロ - 4 - メチル - ベンズイミダゾール - 1 - イル) - 3, 3 - ジメチル - イソキノリン + TX、3 - (4, 4 - ジフルオロ - 3, 3 - ジメチル - 1 - イソキノリル) - 7, 8 - ジヒドロ - 6H - シクロペンタ[e]ベンズイミダゾール + TX (これらの化合物は、国際公開第 2016/156085 号に記載の方法で調製され得る)；N - メトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]シクロプロパンカルボキサミド + TX、N, 2 - ジメトキシ - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド + TX、N - エチル - 2 - メチル - N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド + TX、1 - メトキシ - 3 - メチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素 + TX、1, 3 - ジメトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素 + TX、3 - エチル - 1 - メトキシ - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]尿素 + TX、N - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]プロパンアミド + TX、4, 4 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]イソキサゾリジン - 3 - オン + TX、5, 5 - ジメチル - 2 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]イソキサゾリジン - 3 - オン + TX、エチル 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル]ピラゾール - 4 - カルボキシレート + TX、N, N - ジメチル - 1 - [[4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル]フェニル]メチル] - 1, 2, 4 - トリアゾール - 3 - アミン + TX。この段落中の化合物は、国際公開第 2017/055473 号、国際公開第 2017/055469 号、国際公開第 2017

/ 0 9 3 3 4 8 号及び国際公開第 2 0 1 7 / 1 1 8 6 8 9 号に記載の方法により調製され得る；2 - [6 - (4 - クロロフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 9 1 7 9 号に記載の方法により調製され得る)；2 - [6 - (4 - プロモフェノキシ) - 2 - (トリフルオロメチル) - 3 - ピリジル] - 1 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) プロパン - 2 - オール + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 0 2 9 1 7 9 号に記載の方法により調製され得る)；3 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 2 9 0 号に記載の方法により調製され得る)；3 - [2 - (1 - クロロシクロプロピル) - 3 - (3 - クロロ - 2 - フルオロ - フェニル) - 2 - ヒドロキシ - プロピル] イミダゾール - 4 - カルボニトリル + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 2 9 0 号に記載の方法により調製され得る)；(4 - フェノキシフェニル) メチル 2 - アミノ - 6 - メチル - ピリジン - 3 - カルボキシレート + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 4 / 0 0 6 9 4 5 号に記載の方法により調製され得る)；2 , 6 - ジメチル - 1 H , 5 H - [1 , 4] ジチイノ [2 , 3 - c : 5 , 6 - c '] ジピロール - 1 , 3 , 5 , 7 (2 H , 6 H) - テトロン + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 8 2 8 1 号に記載の方法により調製され得る)；N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンゼンカルボチオアミド + T X；N - メチル - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + T X；(Z , 2 E) - 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 - ベンタ - 3 - エンアミド + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 1 5 3 7 0 7 号に記載の方法により調製され得る)；N ' - (2 - クロロ - 5 - メチル - 4 - フェノキシ - フェニル) - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X；N ' - [2 - クロロ - 4 - (2 - フルオロフェノキシ) - 5 - メチル - フェニル] - N - エチル - N - メチル - ホルムアミジン + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 2 0 2 7 4 2 号に記載の方法により調製され得る)；2 - (ジフルオロメチル) - N - [(3 S) - 3 - エチル - 1 , 1 - ジメチル - インダン - 4 - イル] ピリジン - 3 - カルボキサミド + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 4 / 0 9 5 6 7 5 号に記載の方法により調製され得る)；(5 - メチル - 2 - ピリジル) - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + T X、(3 - メチルイソキサゾール - 5 - イル) - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] メタノン + T X (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 2 2 0 4 8 5 号に記載の方法により調製され得る)；2 - オキソ - N - プロピル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 0 6 5 4 1 4 号に記載の方法により調製され得る)；エチル 1 - [[5 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] - 2 - チエニル] メチル] ピラゾール - 4 - カルボキシレート + T X (この化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 1 5 8 3 6 5 号に記載の方法により調製され得る)；2 , 2 - ジフルオロ - N - メチル - 2 - [4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] フェニル] アセトアミド + T X、N - [(E) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + T X、N - [(Z) - メトキシイミノメチル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + T X、N - [N - メトキシ - C - メチル - カルボンイミドイル] - 4 - [5 - (トリフルオロメチル) - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル] ベンズアミド + T X (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 2 0 2 4 2 8 号に記載の方法により調製され得る)から選択される生物学的に有効な物質；

以下のものを含む微生物：アシネトバクテールオフィイ (*A c i n e t o b a c t e r*

lwoffii) + TX、アクレモニウムアルタナツム (Acremonium alternatum) + TX + TX、アクレモニウムセファロスポリウム (Acremonium cephalosporium) + TX + TX、アクレモニウムディオスピリ (Acremonium diospyri) + TX、アクレモニウムオブクラバツム (Acremonium obclavatum) + TX、リンゴコカクモンハマキ顆粒病ウイルス (Adoxophyes orana granulovirus) (AdoxGV) (Capex (登録商標)) + TX、アグロバクテリウムラジオバクター (Agrobacterium radiobacter) 菌株 K84 (Galltrol - A (登録商標)) + TX、アルテルナリアアルテルナータ (Alternaria alternata) + TX、アルテルナリアアカシアエ (Alternaria cassia) + TX、アルテルナリアデストルエンス (Alternaria destruens) (Smolder (登録商標)) + TX、アンペロマイセススキカリス (Ampelomyces quisqualis) (AQ10 (登録商標)) + TX、アスペルギルスフラブス (Aspergillus flavus) AF36 (AF36 (登録商標)) + TX、アスペルギルスフラブス (Aspergillus flavus) NRRL 21882 (Aflaguard (登録商標)) + TX、アスペルギルス属 (Aspergillus spp.) + TX、アウレオバシジウムブルランス (Aureobasidium pullulans) + TX、アゾスピリillum属 (Azospirillum) (MicroAZ (登録商標)、TAZO B (登録商標)) + TX、アゾトバクター属 (Azotobacter) + TX、アゾトバクタークロオコッカム (Azotobacter chroococcum) (Azotomeal (登録商標)) + TX、アゾトバクター (Azotobacter) シスト (cyst) (Bionatural Blooming Blossoms (登録商標)) + TX、バチルスアミロリケファシエンス (Bacillus amyloliquefaciens) + TX、セレウス菌 (Bacillus cereus) + TX、バチルスキチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株 CM - 1 + TX、バチルスキチノスポルス (Bacillus chitinosporus) 菌株 AQ746 + TX、バチルスリケニフォルミス (Bacillus licheniformis) 菌株 HB - 2 (例えば、Biostart (商標)、旧名 Rhizoboost (登録商標)) + TX、バチルスリケニフォルミス (Bacillus licheniformis) 菌株 3086 (EcoGuard (登録商標)、Green Releaf (登録商標)) + TX、バチルスサーキュランス (Bacillus circulans) + TX、バチルスフィルムス (Bacillus firmus) (BioSafe (登録商標)、BioNem - WP (登録商標)、VOTiVO (登録商標)) + TX、バチルスフィルムス (Bacillus firmus) 菌株 I - 1582 + TX、バチルスマセランス (Bacillus macerans) + TX、バチルスマリスモルトウイ (Bacillus marismortui) + TX、バチルスメガテリウム (Bacillus megaterium) + TX、バチルスミコイデス (Bacillus mycoides) 菌株 AQ726 + TX、バチルスボピリエ (Bacillus papillae) (Milky Spore Powder (登録商標)) + TX、バチルスプミルス種 (Bacillus pumilus spp.) + TX、バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 菌株 GB34 (Yield Shield (登録商標)) + TX、バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 菌株 AQ717 + TX、バチルスプミルス (Bacillus pumilus) 菌株 QST 2808 (Sonata (登録商標)、Ballad Plus (登録商標)) + TX、バチルススフェリカス (Bacillus spahericus) (VectoLex (登録商標)) + TX、バチルス属 (Bacillus spp.) + TX、バチルス属 (Bacillus spp.) 菌株 AQ175 + TX、バチルス属 (Bacillus spp.) 菌株 AQ177 + TX、バチルス属 (Bacillus spp.) 菌株 AQ178 + TX、枯草菌 (Bacillus subtilis) 菌株 QST 713 (CEASE (登録商標)、Serenade (

登録商標)、Rhapsody(登録商標))+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)菌株QST 714(JAZZ(登録商標))+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)菌株AQ153+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)菌株AQ743+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)菌株QST3002+TX、枯草菌(Bacillus subtilis)菌株QST3004+TX、枯草菌変種アミロリケファシエンス(Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens)菌株FZB24(Taegro(登録商標)、Rhizopro(登録商標))+TX、バチルスチューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)Cry 2Ae+TX、バチルスチューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)Cry1Ab+TX、
 10 バチルスチューリングエンシスアイザワイ(Bacillus thuringiensis aizawai)GC 91(Agree(登録商標))+TX、バチルスチューリングエンシスイスラエレンシス(Bacillus thuringiensis israelensis)(BMP123(登録商標)、Aquabac(登録商標)、VectoBac(登録商標))+TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ(Bacillus thuringiensis kurstaki)(Javelin(登録商標)、Deliver(登録商標)、CryMax(登録商標)、Bonide(登録商標)、Scutella WP(登録商標)、Turilav WP(登録商標)、Astuto(登録商標)、Dipel WP(登録商標)、Biobit(登録商標)、Foray(登録商標))+TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ(Bacillus thuringiensis kurstaki)BMP 123(Baritone(登録商標))+TX、バチルスチューリングエンシスクルスターキ(Bacillus thuringiensis kurstaki)HD-1(Bioprotect-CAF/3P(登録商標))+TX、バチルスチューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)菌株BD#32+TX、バチルスチューリングエンシス(Bacillus thuringiensis)菌株AQ52+TX、バチルスチューリングエンシス変種アイザワイ(Bacillus thuringiensis var. aizawai)(XenTari(登録商標)、Dipel(登録商標))+TX、細菌種(bacteria spp.)(GROWMEND(登録商標)、GROWSWEET(登録商標)、Shootup(登録商標))+TX、クラビバクターミシガネンシ
 20 30 (Clavipacter michiganensis)のバクテリオファージ(AgriPhage(登録商標))+TX、Bakflor(登録商標))+TX、白きょう病菌(Beauveria bassiana)(Beaugenic(登録商標)、Brocaril WP(登録商標))+TX、白きょう病菌(Beauveria bassiana)GHA(Mycotrol ES(登録商標)、Mycotrol O(登録商標)、BotaniGuard(登録商標))+TX、ピューベリアブロングニアルティ(Beauveria brongniartii)(Engerlingspilz(登録商標)、Schweizer Beauveria(登録商標)、Melocont(登録商標))+TX、ピューベリア属(Beauveria spp.))+TX、灰色かび病菌(Botrytis cineria)+TX、ブラディリゾビウムジャ
 40 ポニクム(Bradyrhizobium japonicum)(TerraMax(登録商標))+TX、ブレビバチルスブレビス(Brevibacillus brevis)+TX、バチルスチューリングエンシステネブリオニス(Bacillus thuringiensis tenebrionis)(Novodor(登録商標))+TX、BtBooster+TX、バークホルデリアセパシア(Burkholderia cepacia)(Deny(登録商標)、Intercept(登録商標)、Blue Circle(登録商標))+TX、バークホルデリアグラディ(Burkholderia gladii)+TX、バークホルデリアグラディオリ(Burkholderia gladioli)+TX、バークホルデリア属(Burkholderia spp.))+TX、セイヨウトゲアザミの菌(Canadian thistle 50

fungus) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標))
 + TX、カンジダブチリ (Candida butyri) + TX、カンジダファマータ
 (Candida famata) + TX、カンジダフルクタス (Candida fructus)
 + TX、カンジダグラブラタ (Candida glabrata) + TX
 、カンジダギリエルモンディ (Candida guilliermondii) + TX
 、カンジダメリピオシカ (Candida melibiosica) + TX、カンジダ
 オレオフィラ (Candida oleophila) 菌株 O + TX、カンジダパラプシ
 ロシス (Candida parapsilosis) + TX、カンジダペリキュローザ
 (Candida pelliculosa) + TX、カンジダプルケリマ (Candi
 da pulcherrima) + TX、カンジダレウカウフィ (Candida re 10
 ukauarii) + TX、カンジダサイトアナ (Candida saitoana) (Bio - Coat (登録商標)、Biocure (登録商標)) + TX、カンジダサケ (Candida sake) + TX、カンジダ属 (Candida spp.) + TX、カンジダテヌイス (Candida tenuis) + TX、セデセアダビセ (Cedecea dravisae) + TX、セルロモナスフラビゲナ (Cellulomonas flavigena) + TX、カエトミウムコクリオイデス (Chaetomium cochliodes) (Nova - Cide (登録商標)) + TX、カエトミウムグロ
 ボスム (Chaetomium globosum) (Nova - Cide (登録商標)) + TX、クロモバクテリウムスブツガエ (Chromobacterium subts 20
 sugae) 菌株 PRAA4 - 1T (Grandevo (登録商標)) + TX、クラドス
 ポリウムクラドスポリオイデス (Cladosporium cladosporioi
 des) + TX、クラドスポリウムオキシスポルム (Cladosporium oxy
 sporium) + TX、クラドスポリウムクロロセファルム (Cladosporium chlorocephalum) + TX、クラドスポリウム属 (Cladosporiu
 m spp.) + TX、クラドスポリウムテヌイシマム (Cladosporium t
 enuissimum) + TX、クロノスタキスロゼア (Clonostachys r
 oseae) (EndoFine (登録商標)) + TX、コレトトリクムアクタータム (C
 olletotrichum acutatum) + TX、コニオチリウムミニタンス (Coniothyrium minitans) (Cotans WG (登録商標)) +
 TX、コニオチリウム属 (Coniothyrium spp.) + TX、クリプトコッ 30
 カスアルピダス (Cryptococcus albidus) (YIELDPLUS (登録商標)) + TX、クリプトコッカスフミコラ (Cryptococcus humicola) + TX、クリプトコッカスインフィルモ - ミニアツス (Cryptococcus infirmo - miniatus) + TX、クリプトコッカスローレンティ (Cryptococcus laurentii) + TX、クリプトフレビアレウコトレタ
 顆粒病ウイルス (Cryptophlebia leucotreta granulo
 virus) (Cryptex (登録商標)) + TX、カプリアビダスカンピネンシス (Cupriavidus campinensis) + TX、コドリング顆粒病ウイルス (Cydia pomonella granulo 40
 virus) (Madex (登録商標)、Madex (登録商標) Plus (登録
 商標)、Madex (登録商標) Max、Carpovirusine Evo2 (登録
 商標)) + TX、エピコウヤクタケ (Cylindrobasidium laeve)
 (Stumpout (登録商標)) + TX、シリンドロクラジウム属 (Cylindro
 cladium) + TX、デバリオマイセスハンセニイ (Debaryomyces h
 ansenii) + TX、ドレクスレラハワイエンシス (Drechslera haw
 aiiensis) + TX、エンテロバクタークロアカ (Enterobacter
 cloacae) + TX、腸内細菌科 (Enterobacteriaceae) + TX
 、エントモフトラビルレンタ (Entomophthora virulenta) (Ve
 ktor (登録商標)) + TX、エピコッカムニグラム (Epicoccum nigr 50

um) + TX、エピコッカムパーパラセンス (Epicoccum purpurascens) + TX、エピコッカム属 (Epicoccum spp.) + TX、フィロバシ
 ディウムフロリフォルム (Filobasidium floriforme) + TX、
 フザリウムアクミナツム (Fusarium acuminatum) + TX、フザリウ
 ムクラミドスポルム (Fusarium chlamydosporum) + TX、フザ
 リウムオキシスポルム (Fusarium oxysporum) (Fusaclean
 (登録商標)、Biofox C (登録商標)) + TX、フザリウムプロリフェラツム (Fusarium proliferatum) + TX、フザリウム属 (Fusarium spp.) + TX、ガラクトマイセスゲオトリスム (Galactomyces geotrichum) + TX、グリオクラジウムカテヌラツム (Gliocladium catenulatum) (Primastop (登録商標)、Prestop (登録商標)) + TX、グリオクラジウムロセウム (Gliocladium roseum) + TX、グリオクラジウム属 (Gliocladium spp.) (SoilGard (登録商標)) + TX、グリオクラジウムビレンス (Gliocladium virens) (Soilgard (登録商標)) + TX、顆粒病ウイルス (Granulovirus) (Granupom (登録商標)) + TX、ハロバチルスハロフィラス (Halobacillus halophilus) + TX、ハロバチルスリトラリス (Halobacillus litoralis) + TX、ハロバチルストルウエペリ (Halobacillus trueperi) + TX、ハロモナス属 (Halomonas spp.) + TX、ハロモナススブグラシエスコラ (Halomonas subglaciesscola) + TX、ハロビブリオバリアビリス (Halovibrio variabilis) + TX、ハンセニアスポラウバルム (Hanseniaspora uvarum) + TX、オオタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa armigera nucleopolyhedrovirus) (Helicovex (登録商標)) + TX、アメリカタバコガ核多角体病ウイルス (Helicoverpa zea nuclear polyhedrosis virus) (Gemstar (登録商標)) + TX、イソフラボン - ホルモノネチン (Myconate (登録商標)) + TX、クロエケラアピキュラータ (Kloeckera apiculata) + TX、クロエケラ属 (Kloeckera spp.) + TX、ラゲニジウムギガンテウム (Lagenidium giganteum) (Laginex (登録商標)) + TX、レ
 カニシリウムロンギスポルム (Lecanicillium longisporum) (Vertiblast (登録商標)) + TX、レカニシリウムムスカリウム (Lecanicillium muscarium) (Vertikil (登録商標)) + TX、マイマイガ核多角体病ウイルス (Lymantria dispar nucleopolyhedrosis virus) (Disparvirus (登録商標)) + TX、マリノコッカスハロフィルス (Marinococcus halophilus) + TX、メイラゲウラコニギイ (Meirageulakonigii) + TX、メタリジウムアニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Met52 (登録商標)) + TX、メタリジウムアニソプリエ (Metarhizium anisopliae) (Destruxin WP (登録商標)) + TX、メチニコピアフルクチコラ (Metschnikowia fruticola) (Shemer (登録商標)) + TX、メチニコピアブルケリマ (Metschnikowia pulcherrima) + TX、ミクロドチウムジメルム (Microdochium dimerum) (Antibot (登録商標)) + TX、ミクロモノスポラケルレア (Micromonospora coerulea) + TX、ミクロスファエロプシスオクラセ (Microsphaeropsis ochracea) + TX、ムスコドルアルブス (Muscodor albus) 620 (Muscudor (登録商標)) + TX、ムスコドルロセウス (Muscodor roseus) 菌株 A3 - 5 + TX、ミコリザエ属 (Mycorrhizae spp.) (AMykor (登録商標)、Root Maximizer (登録商標)) + TX、クワ暗斑病菌 (Myrothecium verru

10

20

30

40

50

caria) 菌株 AARC - 0255 (*DiTera* (登録商標)) + TX、BROS
 PLUS (登録商標) + TX、オフィオストマピリフェルム (*Ophiostoma p*
iliiferum) 菌株 D97 (*Sylvanex* (登録商標)) + TX、ペシロマイセ
 スファリノス (*Paecilomyces farinosus*) + TX、ペシロマイ
 セスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (PFR
 - 97 (登録商標)、PreFeRal (登録商標)) + TX、ペシロマイセスリラシヌ
 ス (*Paecilomyces linacinus*) (BioStat WP (登録商
 標)) + TX、ペシロマイセスリラシヌス (*Paecilomyces lilacin*
us) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標)) + TX、パエニバチルスポリミ
 キサ (*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエアアグロメラ 10
 ンス (*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9 - 1 (登
 録商標)) + TX、パントエア属 (*Pantoea spp.*) + TX、パスツéria属
 (*Pasteuria spp.*) (Econem (登録商標)) + TX、パスツéria
 ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウムオーラ
 ンティオグリセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + T
 X、ペニシリウムビライ (*Penicillium billai*) (Jumpstar
 t (登録商標)、TagTeam (登録商標)) + TX、ペニシリウムブレビコンパクト
 ム (*Penicillium brevicompactum*) + TX、ペニシリウムフ
 レクエンタス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウ
 ムグリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペ 20
 ニシリウムブルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + T
 X、ペニシリウム属 (*Penicillium spp.*) + TX、ペニシリウムビリデ
 ィカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオブシス
 ギガンテア (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotsstop (登録商
 標)) + TX、リン酸塩溶解細菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィ
 トファトラクリプトゲア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フ
 イトファトラバルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devi
 ne (登録商標)) + TX、ピヒアアノマラ (*Pichia anomala*) + TX、
 ピヒアギリエルモンディ (*Pichia guilermundii*) + TX、ピヒアメ
 ンブラネファシエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピ 30
 ヒアオニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピヒアスチピチス (*Pichi*
a stipites) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginos*
a) + TX、シュードモナスオーレオファシエンス (*Pseudomonas aure*
ofasciens) (Spot - Less Biofungicide (登録商標))
 + TX、シュードモナスセパシア (*Pseudomonas cepacia*) + TX、
 シュードモナスクロロラフィス (*Pseudomonas chlororaphis*)
 (AtEze (登録商標)) + TX、シュードモナスコルガータ (*Pseudomona*
s corrugate) + TX、蛍光菌 (*Pseudomonas fluoresc*
ens) 菌株 A506 (BlightBan A506 (登録商標)) + TX、シュ
 ードモナスプチダ (*Pseudomonas putida*) + TX、シュードモナスリア 40
 クタンス (*Pseudomonas reactans*) + TX、シュードモナス属 (*P*
seudomonas spp.) + TX、シュードモナスシリंगाエ (*Pseudom*
onas syringae) (Bio - Save (登録商標)) + TX、シュードモナ
 スビリジフラバ (*Pseudomonas viridiflava*) + TX、蛍光菌 (*Pseudomons*
fluorescens) (Zequanox (登録商標)) +
 TX、シュードジマフロクロサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 P
 F - A22 UL (*Sporodex L* (登録商標)) + TX、プッシニアカナリクラ
 タ (*Puccinia canaliculata*) + TX、プッシニアテラスペオス (*Puccinia*
thlaspeos) (Wood Warrior (登録商標)) +
 TX、ピシウムパレカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、 50

ピシウムオリガンドルム (*Pythium oligandrum*) (*Polygandron* (登録商標)、*Polyversum* (登録商標)) + TX、ピシウム病菌 (*Pythium periplocum*) + TX、ラーネラアクアティリス (*Rhanelia aquatilis*) + TX、ラーネラ属 (*Rhanelia* spp.) + TX、リゾビウム属 (*Rhizobia*) (*Dormal* (登録商標)、*Vault* (登録商標)) + TX、リゾクトニア属 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカスグロベルルス (*Rhodococcus globerulus*) 菌株 AQ719 + TX、ロドスポリジウムディオボバタム (*Rhodosporidium diobovatum*) + TX、ロドスポリジウムトルロイデス (*Rhodosporidium toruloides*) + TX、ロドトルラ属 (*Rhodotorula* spp.) + TX、ロドトルラグルチニス (*Rhodotorula glutinis*) + TX、ロドトルラグラミニス (*Rhodotorula graminis*) + TX、ロドトルラムチラギノーザ (*Rhodotorula mucilagnosa*) + TX、ロドトルラルブラ (*Rhodotorula rubra*) + TX、サッカロマイセスセレビシエ (*Saccharomyces cerevisiae*) + TX、サリニコッカスロセウス (*Salinococcus roseus*) + TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*) + TX、スクレロチニアミノル (*Sclerotinia minor*) (*SARRITOR* (登録商標)) + TX、スキタリジウム属 (*Scytalidium* spp.) + TX、スキタリジウムウレジニコラ (*Scytalidium uredinicola*) + TX、シロイチモジヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera exigua nuclear polyhedrosis virus*) (*Spod-X* (登録商標)、*Spexit* (登録商標)) + TX、セラチアマルセッセンス (*Serratia marcescens*) + TX、セラチアプリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラチア属 (*Serratia* spp.) + TX、ソルダリアフィミコーラ (*Sordaria fimicola*) + TX、エジプトヨトウ核多角体病ウイルス (*Spodoptera littoralis nucleopolyhedrovirus*) (*Littovir* (登録商標)) + TX、スポロボロマイセスロセウス (*Sporobolomyces roseus*) + TX、ステノトロホモナスマルトフィリア (*Stenotrophomonas maltophilica*) + TX、ストレプトマイセスヒグロスコピクス (*Streptomyces ahYGroscopicus*) + TX、ストレプトマイセスアルパドゥンカス (*Streptomyces albaduncus*) + TX、ストレプトマイセスエクスフォリエータス (*Streptomyces exfoliates*) + TX、ストレプトマイセスガルバス (*Streptomyces galbus*) + TX、ストレプトマイセスグリセオプラヌス (*Streptomyces griseoplanus*) + TX、ストレプトマイセスグリセオビリディス (*Streptomyces griseoviridis*) (*Mycostop* (登録商標)) + TX、ストレプトマイセスリディカス (*Streptomyces lydicus*) (*Actinovate* (登録商標)) + TX、ストレプトマイセスリディカス (*Streptomyces lydicus*) WYEC-108 (*ActinoGrow* (登録商標)) + TX、ストレプトマイセスビオラセウス (*Streptomyces violaceus*) + TX、チレチオブシスミノル (*Tilletiopsis minor*) + TX、チレチオブシス属 (*Tilletiopsis* spp.) + TX、トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) (*T34 Biocontrol* (登録商標)) + TX、トリコデルマガムシイ (*Trichoderma gamsii*) (*Tenet* (登録商標)) + TX、トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*) (*Plantmate* (登録商標)) + TX、トリコデルマハマトム (*Trichoderma hamatum*) TH 382 + TX、トリコデルマハルジアヌムリファイ (*Trichoderma harzianum rifai*) (*Mycostar* (登録商標)) + TX、トリコデルマハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*

) T - 2 2 (T r i a n u m - P (登 録 商 標) 、 P l a n t S h i e l d H C (登 録 商 標) 、 R o o t S h i e l d (登 録 商 標) 、 T r i a n u m - G (登 録 商 標)) + T X 、
 トリコデルマハルジアヌム (T r i c h o d e r m a h a r z i a n u m) T - 3 9 (T r i c h o d e x (登 録 商 標)) + T X 、 トリコデルマインハマトム (T r i c h o d e r m a i n h a m a t u m) + T X 、 トリコデルマコニング (T r i c h o d e r m a k o n i n g i i) + T X 、 トリコデルマ属 (T r i c h o d e r m a s p p .)
 L C 5 2 (S e n t i n e l (登 録 商 標)) + T X 、 トリコデルマリグノルム (T r i c h o d e r m a l i g n o r u m) + T X 、 トリコデルマロンギブラキアタム (T r i c h o d e r m a l o n g i b r a c h i a t u m) + T X 、 トリコデルマポリスボ
 ラム (T r i c h o d e r m a p o l y s p o r u m) (B i n a b T (登 録 商 標)) + T X 、 トリコデルマタキシ (T r i c h o d e r m a t a x i) + T X 、 トリコデル
 マビレンス (T r i c h o d e r m a v i r e n s) + T X 、 トリコデルマビレンス (T r i c h o d e r m a v i r e n s) (旧 グリオクラジウムビレンス (G l i o c l a d i u m v i r e n s) G L - 2 1) (S o i l G u a r d (登 録 商 標)) + T X
 、 トリコデルマビリデ (T r i c h o d e r m a v i r i d e) + T X 、 トリコデルマ
 ビリデ (T r i c h o d e r m a v i r i d e) 菌株 I C C 0 8 0 (R e m e d i e r (登 録 商 標)) + T X 、 トリコスポロンブルランス (T r i c h o s p o r o n p u l l u l a n s) + T X 、 トリコスポロン属 (T r i c h o s p o r o n s p p .) +
 T X 、 トリコセシウム属 (T r i c h o t h e c i u m s p p .) + T X 、 トリコセシ
 ウムロセウム (T r i c h o t h e c i u m r o s e u m) + T X 、 アカエガマノホタ
 ケ (T y p h u l a p h a c o r r h i z a) 菌株 9 4 6 7 0 + T X 、 アカエガマノホ
 タケ (T y p h u l a p h a c o r r h i z a) 菌株 9 4 6 7 1 + T X 、 ウロクラジウ
 ムアトラム (U l o c l a d i u m a t r u m) + T X 、 ウロクラジウムオウデマンシ
 イ (U l o c l a d i u m o u d e m a n s i i) (B o t r y - Z e n (登 録 商 標)) + T X 、 トウモロコシ黒穂病菌 (U s t i l a g o m a y d i s) + T X 、 様々な細
 菌及び補助微量栄養素 (N a t u r a l I I (登 録 商 標)) + T X 、 様々な真菌 (M i l l e n n i u m M i c r o b e s (登 録 商 標)) + T X 、 バーチシリウムクラミドス
 ポリウム (V e r t i c i l l i u m c h l a m y d o s p o r i u m) + T X 、 バー
 チシリウムレカニ (V e r t i c i l l i u m l e c a n i i) (M y c o t a l (登 録 商 標) 、 V e r t a l e c (登 録 商 標)) + T X 、 V i p 3 A a 2 0 (V I P t e r a
 (登 録 商 標)) + T X 、 ビルジバチルスマリスモルツイ (V i r g i b a c l i l l u s m a r i s m o r t u i) + T X 、 キサントモナスカムベストリス病原型ポアエ (X a n t h o m o n a s c a m p e s t r i s p v . P o a e) (C a m p e r i c o (登 録 商 標)) + T X 、 ゼノラブダスボヴィエニイ (X e n o r h a b d u s b o v i e n i i) + T X 、 ゼノラブダスネマトフィラ (X e n o r h a b d u s n e m a t o p h i l u s) + T X ;
 以下のものを含む植物抽出物：松油 (R e t e n o l (登 録 商 標)) + T X 、 アザジラク
 チン (P l a s m a N e e m O i l (登 録 商 標) 、 A z a G u a r d (登 録 商 標) 、
 M e e m A z a l (登 録 商 標) 、 M o l t - X (登 録 商 標) 、 植物性の昆虫成長制御剤 (B o t a n i c a l I G R) (N e e m a z a d (登 録 商 標) 、 N e e m i x (登 録 商 標)) + T X 、 ナタネ油 (L i l l y M i l l e r V e g o l (登 録 商 標)) + T X
 、 アメリカアリタソウ (C h e n o p o d i u m a m b r o s i o i d e s n e a r a m b r o s i o i d e s) (R e q u i e m (登 録 商 標)) + T X 、 キク属 (C h r y s a n t h e m u m) 抽出物 (C r i s a n t (登 録 商 標)) + T X 、 ニーム油の抽出物 (T r i l o g y (登 録 商 標)) + T X 、 シソ科植物 (L a b i a t a e) の精油 (B o t a n i a (登 録 商 標)) + T X 、 クローブローズマリーペパーミント及びタイム油の抽出物 (G a r d e n i n s e c t k i l l e r (登 録 商 標)) + T X 、 グリシンベタイン (G r e e n s t i m (登 録 商 標)) + T X 、 ニンニク + T X 、 レモングラス油 (G r e e n M a t c h (登 録 商 標)) + T X 、 ニーム油 + T X 、 イヌハッカ (N e p e t a c a t a r i a) (キヤットニップ油) + T X 、 イヌハッカ (N e p e t a c a t a r

ina) + TX、ニコチン + TX、オレガノ油 (Moss Buster (登録商標)) + TX、ゴマ科植物 (Pedaliaceae) 油 (Nematon (登録商標)) + TX、除虫菊 + TX、シャボンノキ (Quillaja saponaria) (NemaQ (登録商標)) + TX、オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) (Regalia (登録商標)、Sakalia (登録商標)) + TX、ロテノン (Eco Rotten (登録商標)) + TX、ミカン科植物 (Rutaceae) 抽出物 (Soleo (登録商標)) + TX、大豆油 (Ortho ecosense (登録商標)) + TX、ティーツリー (Melaleuca alternifolia) 抽出物 (ティーツリー油とも呼ばれる) (Timorex Gold (登録商標)) + TX、タイム油 + TX、AGNIQUE (登録商標) MMF + TX、Bug Oil (登録商標) + TX、ローズマリーゴマペパーミントタイム及びシナモン抽出物の混合物 (EF 300 (登録商標)) + TX、クローブローズマリー及びペパーミント抽出物の混合物 (EF 400 (登録商標)) + TX、クローブペパーミントニンク油及びミントの混合物 (Soil Shot (登録商標)) + TX、カオリン (Screen (登録商標)) + TX、褐藻類の貯蔵グルカン (Laminarin (登録商標)) + TX；

以下のものを含むフェロモン：クロネハイイロヒメハマキ (black headed fireworm) フェロモン (3M Sprayable Blackheaded Fireworm Pheromone (登録商標)) + TX、コドリング (Codling Moth) フェロモン (Paramount dispenser - (CM) / Isomate C - Plus (登録商標)) + TX、グレープベリーモス (Grape Berry Moth) フェロモン (3M MEC - GBM Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、ハマキガ科のガ (Leafroller) フェロモン (3M MEC - LR Sprayable Pheromone (登録商標)) + TX、Muscamone (Snip7 Fly Bait (登録商標)、Starbar Premium Fly Bait (登録商標)) + TX、ナシヒメシンクイ (Oriental Fruit Moth) フェロモン (3M oriental fruit moth sprayable pheromone (登録商標)) + TX、スカシバガ科のガ (Peachtree Borer) フェロモン (Isomate - P (登録商標)) + TX、トマトピンworm (Tomato Pinworm) フェロモン (3M Sprayable pheromone (登録商標)) + TX、Entostat 粉末 (ヤシの木からの抽出物) (Exosex CM (登録商標)) + TX、(3E, 8Z, 11Z) - 3, 11 - テトラデカトリエニルアセテート + TX、(7Z, 11Z, 13E) - 7, 11, 13 - ヘキサデカトリエナル + TX、(E, Z) - 7, 9 - ドデカジエン - 1 - イルアセテート + TX、2 - メチル - 1 - ブタノール + TX、酢酸カルシウム + TX、Scenturion (登録商標) + TX、Biolure (登録商標) + TX、Check - Mate (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオエート + TX；

以下のものを含む生物 (Macrobials)：アフエリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) + TX、アフイジウス・エルビ (Aphidius ervi) (Aphelinus - System (登録商標)) + TX、アセロファガス・パパイヤ (Acerophagus papaya) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adalia - System (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Adaline (登録商標)) + TX、フタモンテントウ (Adalia bipunctata) (Aphidalia (登録商標)) + TX、アゲニアスピス・シトリコラ (Ageniaspis citricola) + TX、アゲニアスピス・フシコリス (Ageniaspis fuscicollis) + TX、アンブリセイウス・アンデルソニ (Amblyseius andersoni) (Anderline (登録商標)、Andersoni - System (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・カリフォルニクス (Amblyseius californicus) (Amblyline (登録商標)、Spical (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ククメリス (Amblyseius

s cucumeris) (*Thripex* (登録商標)、*Bugline cucum*
eris (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・ファラキス (*Amblyseius*
fallacis) (*Fallacis* (登録商標)) + TX、アンブリセイウス・スウ
 イルスキ (*Amblyseius swirskii*) (*Bugline swirs*
kii (登録商標)、*Swirskii-Mite* (登録商標)) + TX、アンブリセイ
 ウス・ウォマースレイ (*Amblyseius womersleyi*) (*Womer M*
ite (登録商標)) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (*Amitus hesperi*
dum) + TX、アナグルス・アトムス (*Anagrus atomus*) + TX、アナ
 ギルス・フスシベントリス (*Anagyrus fusciventris*) + TX、ア
 ナギルス・カマリ (*Anagyrus kamali*) + TX、*Anagyrus lo*
ecki + TX、アナギルス・シュードコッカス (*Anagyrus pseudoco*
cci) (*Citripar* (登録商標)) + TX、アニセツス・ベネフィクス (*Ani*
cetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (*Anisopter*
omalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (*Anthoc*
oris nemoralis) (*Anthocoris-System* (登録商標))
 + TX、アフエリヌス・アブドミナリス (*Aphelinus abdominalis*
) (*Apheline* (登録商標)、*Aphiline* (登録商標)) + TX、アフエリ
 ヌス・アシキス (*Aphelinus asychis*) + TX、アフイジウス・コレマ
 ニ (*Aphidius colemani*) (*Ahipar* (登録商標)) + TX、ア
 フィジウス・エルビ (*Aphidius ervi*) (*Ervipar* (登録商標)) +
 TX、アフイジウス・ギフエンシス (*Aphidius gifuensis*) + TX、
 アフィジウス・マトリカリアエ (*Aphidius matricariae*) (*Aph*
ipar-M (登録商標)) + TX、アフイドレテス・アフイディマイザ (*Aphido*
letes aphidimyza) (*Aphidend* (登録商標)) + TX、アフイ
 ドレテス・アフイディマイザ (*Aphidoletes aphidimyza*) (*Ap*
hidoline (登録商標)) + TX、アフイチス・リングナネンシス (*Aphyti*
s lingnanensis) + TX、アフイチス・メリヌス (*Aphytis me*
linus) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイ (*Aprostocetus h*
agenowii) + TX、アセタ・コリアリア (*Atheta coriaria*) (*S*
taphyline (登録商標)) + TX、マルハナバチ属 (*Bombus spp.*
) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bombus terrestris*) (*Nat*
upol Beehive (登録商標)) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (*Bomb*
us terrestris) (*Beeline* (登録商標)、*Tripol* (登録商標
)) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (*Cephalonomia step*
hanoderis) + TX、チノコルス・ニグリツス (*Chilocorus nig*
ritus) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoperla carnea*) (*C*
hrysoline (登録商標)) + TX、ヤマトクサカゲロウ (*Chrysoper*
la carnea) (*Chrysopa* (登録商標)) + TX、クリソペルラ・ルフイ
 ラブリス (*Chrysoperla rufilabris*) + TX、シロスピルス・イ
 ングヌウス (*Cirrospilus ingenuus*) + TX、シロスピルス・クア
 ドリストリアツス (*Cirrospilus quadristriatus*) + TX、
 シトロステクス・フィロクニストイデス (*Citrostichus phyllocn*
istoides) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (*Closterocer*
us chamaeleon) + TX、クロステロセルス属 (*Closteroceru*
s spp.) + TX、コシドキセノイデス・ペルミヌツス (*Coccidoxeno*
ides perminutus) (*Planopar* (登録商標)) + TX、コッコファ
 グス・コウペリ (*Coccophagus cowperi*) + TX、コッコファグス・
 リシムニア (*Coccophagus lycimnia*) + TX、キアシサムライコマ
 ユバチ (*Cotesia flavipes*) + TX、コナガサムライコマユバチ (*Co*
tesia plutellae) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptol*

10

20

30

40

50

aemus montrouzeri) (Cryptobug (登録商標)、Cryptoline (登録商標)) + TX、キムネタマキスイ (Cybocephalus nipponicus) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (Minusa (登録商標)) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (Diminex (登録商標)) + TX、デルファスツス・カタリナエ (Delphastus catalinae) (Delphastus (登録商標)) + TX、デルファスツス・ブシルス (Delphastus pusillus) + TX、ジアカスミモルファ・クラウシイ (Diachasmimorpha krausii) + TX、ジアカスミモルファ・ロンギカウダタ (Diachasmimorpha longicaudata) + TX、ジアパルシス・ジユクンダ (Diaparsis jucunda) + TX、ジアホレンシルツス・アリガレンシス (Diaphorencyrtus aligarhensis) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) + TX、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) (Miglyphus (登録商標)、Digline (登録商標)) + TX、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) (DacDigline (登録商標)、Minex (登録商標)) + TX、ディベルシネルプス属 (Diversinervus spp.) + TX、エンカルシア・シトリナ (Encarsia citrina) + TX、オンシツツヤコバチ (Encarsia formosa) (Encarsia max (登録商標)、Encarline (登録商標)、En-Strip (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Enermix (登録商標)) + TX、エンカルシア・グアデロウパエ (Encarsia guadeloupae) + TX、エンカルシア・ハンティエンシス (Encarsia haitiensis) + TX、ホソヒラタアブ (Episyrphus balteatus) (Syrphidend (登録商標)) + TX、エルトモセリス・シフォニニ (Eretmoceris siphonini) + TX、エルトモセルス・カリフォルニクス (Eretmocerus californicus) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Ercal (登録商標)、Eretline e (登録商標)) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmocerus eremicus) (Bemimix (登録商標)) + TX、エルトモセルス・ハヤチ (Eretmocerus hayati) + TX、エルトモセルス・ムンツス (Eretmocerus mundus) (Bemipar (登録商標)、Eretline m (登録商標)) + TX、エルトモセルス・シフォニニ (Eretmocerus siphonini) + TX、エキソコムス・クアドリプスツラツス (Exochomus quadripustulatus) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Spidend (登録商標)) + TX、フェルチエラ・アカリスガ (Feltiella acarisuga) (Feltiline (登録商標)) + TX、フォピウス・アリサヌス (Fopius arisanus) + TX、フォピウス・セラチチボルス (Fopius ceratitivorus) + TX、ホルモノネチン (Wirless Beehome (登録商標)) + TX、アリガタシマアザミウマ (Franklinothrips vespiiformis) (Vespop (登録商標)) + TX、ガレンドロムス・オシデンタリス (Galendromus occidentalis) + TX、ゴニオズス・レグネリ (Goniozus legneri) + TX、シマメイガコマユバチ (Habrobracon hebetor) + TX、ナミテントウ (Harmonia axyridis) (HarmoBeetle (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス属 (Heterorhabditis spp.) (Lawn Patrol (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (Heterorhabditis bacteriophora) (NemaShield HB (登録商標)、Nemaseek (登録商標)、Terranem-Nam (登録商標)、Terranem (登録商標)、Larvanem (登録商標)、B-Green (登録商標)、NemAt

tack (登録商標)、Nematop (登録商標)) + TX、ヘテロラブディティス・
 メジデイス (Heterorhabditiis megidiis) (Nemasys H
 (登録商標)、BioNem H (登録商標)、Exhibitline hm (登録商
 標)、Larvanem - M (登録商標)) + TX、サカハチテントウ (Hippoda
 mia convergens) + TX、ヒポアスピス・アクレイファー (Hypoas
 pis aculeifer) (Aculeifer - System (登録商標)、
 Entomite - A (登録商標)) + TX、ヒポアスピス・ミルス (Hypoaspi
 s miles) (Hypoline m (登録商標)、Entomite - M (登録商
 標)) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbalia leucospoides
) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (Lecanoideus flocciss
 imus) + TX、レモファグス・エラブンツス (Lemophagus errabu
 ndus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Leptomastidea a
 bnormis) + TX、レプトマスチクス・ダクチロピ (Leptomastix d
 actylopii) (Leptopar (登録商標)) + TX、レプトマスチクス・エ
 ボナ (Leptomastix epona) + TX、リンドルス・ロファンタエ (Li
 ndorus lophanthae) + TX、リボレクシス・オレグマエ (Lipol
 exis oregmae) + TX、ルシリア・カエサル (Lucilia caesa
 r) (Natufly (登録商標)) + TX、リシフレブス・テストケイペス (Lysi
 phlebus testaceipes) + TX、マクロロフス・カリギノスス (Ma
 crolophus caliginosus) (Mirical - N (登録商標)、M
 acroline c (登録商標)、Mirical (登録商標)) + TX、メソセイウ
 ルス・ロンギペス (Mesoseiulus longipes) + TX、メタフィクス
 ・フラプス (Metaphycus flavus) + TX、メタフィクス・ロウンズブ
 リイ (Metaphycus lounsburyi) + TX、ミクロムス・アングラツ
 ス (Micromus angulatus) (Milacewing (登録商標)) +
 TX、ミクロテリス・フラプス (Microterys flavus) + TX、ムスシ
 ディフラクス・ラボトレルス (Muscidi furax raptorellus) 及
 びスパランギア・カメロニ (Spalangia cameroni) (Biopar (登
 録商標)) + TX、ネオドリイヌス・チフロシバエ (Neodryinus typh
 locybae) + TX、ミヤコカブリダニ (Neoseiulus californ
 icus) + TX、ネオセイウルス・ククメリス (Neoseiulus cucume
 ris) (THRYPEX (登録商標)) + TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neo
 seiulus fallacis) + TX、ネシディオコリス・テヌイス (Nesid
 eocoris tenuis) (Nesidio Bug (登録商標)、Nesibug
 (登録商標)) + TX、オフィラ・アエネセンス (Ophyra aenescens)
 (Biofly (登録商標)) + TX、シノビハナカメムシ (Orius insidi
 osus) (Thripor - I (登録商標)、Oriline i (登録商標)) + T
 X、エルヒメハナカメムシ (Orius laevigatus) (Thripor - L
 (登録商標)、Oriline l (登録商標)) + TX、オリウス・マジュスクルス (O
 rius majusculus) (Oriline m (登録商標)) + TX、タイ
 リクヒメハナカメムシ (Orius strigicollis) (Thripor - S
 (登録商標)) + TX、パウエシア・ジュニペロルム (Pauesia juniper
 orum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pediobius foveol
 atus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmarha
 bditis hermaphrodita) (Nemaslug (登録商標)) + TX
 、フィマスティクス・コフエア (Phymastichus coffea) + TX、フ
 イトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus) +
 TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (Spid
 ex (登録商標)、Phytoline p (登録商標)) + TX、ポディスス・マクリ
 ベントリス (Podisus maculiventris) (Podisus (登録商

10

20

30

40

50

標) + TX、シューダクテオン・クルバツス (Pseudacteon curvatus) + TX、シューダクテオン・オブツス (Pseudacteon obtusus) + TX、シューダクテオン・トリクスピス (Pseudacteon tricuspis) + TX、シューダフィクス・マクリペンニス (Pseudaphycus maculipennis) + TX、シュードレプトマスティクス・メキシカーナ (Pseudleptomastix mexicana) + TX、サイラエファグス・ピロス (Psyllaephagus pilosus) + TX、サイタリア・コンコロール (Psytalia concolor) (複合体) + TX、クアドラスティクス属 (Quadrastichus spp.) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (Rhyzobius lophanthae) + TX、ベダリアテントウ (Rodolia cardinalis) + TX、オオクビキレガイ (Rumina decollate) + TX、セミアラケア・ペティオラツス (Semielacher petiolatus) + TX、シトビオン・アベナエ (Sitobion avenae) (Ervibank (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・カーポプサエ (Steinernema carpocapsae) (Nematac C (登録商標)、Millenium (登録商標)、BioNem C (登録商標)、NemAttack (登録商標)、Nemastar (登録商標)、Capsanem (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (Steinernema feltiae) (NemaShield (登録商標)、Nemasys F (登録商標)、BioNem F (登録商標)、Steinernema-System (登録商標)、NemAttack (登録商標)、Nemaplus (登録商標)、Exhibitline sf (登録商標)、Scia-rid (登録商標)、Entonem (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・クラッセイ (Steinernema kraussei) (Nemasys L (登録商標)、BioNem L (登録商標)、Exhibitline srb (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・リオブラベ (Steinernema riobrave) (BioVector (登録商標)、BioVektor (登録商標)) + TX、スタイナーネマ・スカプテリシ (Steinernema scapterisci) (Nematac S (登録商標)) + TX、スタイナーネマ属 (Steinernema spp.) + TX、スタイナーネマチド属 (Steinernematid spp.) (Guardian Nematodes (登録商標)) + TX、ステルス・punkチルム (Stethorus punctillum) (Stethorus (登録商標)) + TX、タマリキシア・ラジアタ (Tamarixia radiate) + TX、テトラスティクス・セティファー (Tetrastichus setifer) + TX、トリポビウス・セミルテウス (Thripobius semiluteus) + TX、トリムス・シネンシス (Torymus sinensis) + TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Tricholine b (登録商標)) + TX、タマゴヤドリバチ (Trichogramma brassicae) (Tricho-Strip (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (Trichogramma evanescens) + TX、トリコグラマ・ミヌツム (Trichogramma minutum) + TX、アワノメイガタマゴバチ (Trichogramma ostriniae) + TX、トリコグラマ・プラトネリ (Trichogramma platneri) + TX、トリコグラマ・プレチオスム (Trichogramma pretiosum) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (Xanthopimpla stematior) + TX ;

以下のものを含む他の生物学的製剤：アブシジン酸 + TX、bioSea (登録商標) + TX、コンドロステレウム・ブルブレウム (Chondrostereum purpureum) (Chontrol Paste (登録商標)) + TX、コレトトリクム・グレオスポリオイデス (Colletotrichum gloeosporioides) (Collego (登録商標)) + TX、オクタン酸銅 (Cueva (登録商標)) + TX、デルタトラップ (Trapline d (登録商標)) + TX、エルウィニア・ア

ミロボラ (*Erwinia amylovora*) (ハービン) (ProAct (登録商標)、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標)) + TX、エクストラバージンオリーブ油の天然副生成物由来の脂肪酸 (FLIPPER (登録商標)) + TX、リン酸第二鉄 (Ferric-phosphate) (Ferramol (登録商標)) + TX、ファネルトラップ (Trapline y (登録商標)) + TX、Gallex (登録商標) + TX、Grower's Secret (登録商標) + TX、ホモブラシノリド (Homo-brassonolide) + TX、リン酸鉄 (Lilly Miller Worry Free Ferramol Slug & Snail Bait (登録商標)) + TX、MCP hailトラップ (Trapline f (登録商標)) + TX、ミクロクトヌス・ヒペロダエ (*Microctonus hyperodae*) + TX、ミコレプトジスクス・テレストリス (*Mycroleptodiscus terrestris*) (Des-X (登録商標)) + TX、BioGain (登録商標) + TX、Aminomite (登録商標) + TX、Zenox (登録商標) + TX、フェロモントラップ (Thripline ams (登録商標)) + TX、炭酸水素カリウム (Mil Stop (登録商標)) + TX、脂肪酸のカリウム塩 (Sanova (登録商標)) + TX、ケイ酸カリウム溶液 (Sil-Matrix (登録商標)) + TX、ヨウ化カリウム + チオシアン酸カリウム (Enzicur (登録商標)) + TX、SuffOil-X (登録商標) + TX、クモ毒 + TX、ノセマ・ロクスタエ (*Nosema locustae*) (Semaspore Organic Grasshopper Control (登録商標)) + TX、粘着トラップ (Trapline YF (登録商標)、Rebell Amarillo (登録商標)) + TX 及びトラップ (Takitrapi line y + b (登録商標)) + TX ;

(1) 以下の群から選択される抗細菌剤 :

(1.1) その例は、以下のとおりであるバクテリア : Certis USA LLC からのバチルスモハベンシス (*Bacillus mojavenensis*) 菌株 R3B (受入番号 NCAIM (P) B001389) (国際公開第 2013/034938 号) + TX ; バチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に NRRL 受入番号 50185 を有する菌株 BU F-33 (BASF 製の CARTISSA (登録商標)、EPA 登録番号 71840-19) + TX ; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 QST713/AQ713 (Bayer CropScience LP, US からの SERENADE OPTI 又は SERENADE ASO、NRRL 受入番号 B21661 を有する、米国特許第 6,060,051 号明細書) + TX ; バチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 BU1814 (BASF SE 製の VELONDIS (登録商標) PLUS、VELONDIS (登録商標) FLEX 及び VELONDIS (登録商標) EXTRA) + TX ; 受入番号 DSM10271 を有するバチルスサブチリス var. アミロリクエファシエンス (*Bacillus subtilis* var. *amyroliquefaciens*) 菌株 FZB24 (Novozymes から TAEGRO (登録商標) 又は TAEGRO (登録商標) ECO (EPA 登録番号 70127-5) として入手可能) + TX ; Certis USA LLC からのバチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) CX-9060 + TX ; バチルス属の一種 (*Bacillus* sp.)、特に菌株 D747 (クミアイ化学工業株式会社製の DOUBLE NICKEL (登録商標) として入手可能)、受入番号 FERM BP-8234 を有する、米国特許第 7,094,592 号明細書 + TX ; 受入番号 NRRL B-50972 又は受入番号 NRRL B-67129 を有するパエニバチルス属の一種 (*Paenibacillus* sp.) 菌株、国際公開第 2016/154297 号 + TX ; パエニバチルスポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*)、特に菌株 AC-1 (例えば Green Biotech Company Ltd. 製の TOPSEED (登録商標)) + TX ; パントエアアグロメランス (*Pantoea agglomerans*)、特に菌株 E325 (受入番号 NRRL B-21856) (Northwest Agri Products 製の BLOOMTIM

E BIOLOGICAL (商標) FD BIOPESTICIDEとして入手可能) + TX; Sourcon Padenaからのシュードモナスプロラディクス(Pseudomonas proradix)(例えばPRORADIX(登録商標)) + TX; 並びに

(1.2) その例は、以下のとおりである真菌: アウレオバシジウムプルランス(Aureobasidium pullulans)、特に菌株DSM 14940の分芽胞子、菌株DSM 14941の分芽胞子又は菌株DSM 14940及びDSM 14941の分芽胞子の混合物(例えば、bio-ferm, CH製のBOTECTOR(登録商標)及びBLOSSOM PROTECT(登録商標)) + TX; シュードザイマアフィジス(Pseudozyma aphidis)(Yissum Research Development Company of the Hebrew University of Jerusalemによる国際公開第2011/151819号に開示されている) + TX; サッカロマイセスセレビスエ(Saccharomyces cerevisiae)、特に菌株CNCM番号1-3936、CNCM番号1-3937、CNCM番号1-3938又はCNCM番号1-3939(Lesaffre et Compagnie, FRからの国際公開第2010/086790号に開示されている) + TX;

10

(2) 以下の群から選択される生物学的殺菌・殺カビ剤:

(2.1) その例は、以下のとおりであるバクテリア: アグロバクテリウムラジオバクター(Agrobacterium radiobacter) 菌株K84(例えばAgBioChem, CA製のGALLTROL-A(登録商標)) + TX; アグロバクテリウムラジオバクター(Agrobacterium radiobacter) 菌株K1026(例えばBASF SE製のNOGALL(商標)) + TX; 受入番号DSM 10271を有するバチルスサブチリスvar. アミロリケファシエンス(Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens) 菌株FZB24(NovozymesからTAEGRO(登録商標)又はTAEGRO(登録商標)ECO(EPA登録番号70127-5)として入手可能) + TX; バチルスアミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)、特に菌株D747(クミアイ化学工業株式会社からDouble Nickel(商標)として入手可能、受入番号FERM BP-8234を有する、米国特許第7,094,592号明細書) + TX; バチルスアミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens) 菌株F727(菌株MBI110としても公知である)(NRRL受入番号B-50768、国際公開第2014/028521号)(Marrone Bio Innovations製のSTARGUS(登録商標)) + TX; バチルスアミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens) 菌株FZB42、受入番号DSM 23117(ABITEP, DEからRHIZO VITAL(登録商標)として入手可能) + TX; バチルスアミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens) アイソレートB246(例えばUniversity of Pretoria製のAVOGREEN(商標)) + TX; バチルスリケニホルミス(Bacillus licheniformis)、特に受入番号ATCC 55406を有する菌株SB3086、国際公開第2003/000051号(NovozymesからECOGUARD(登録商標) Biofungicide及びGREEN RELEAF(商標)として入手可能) + TX; バチルスリケニホルミスFMCH001(Bacillus licheniformis FMCH001)及びバチルスサブチリスFMCH002(Bacillus subtilis FMCH002)(FMC Corp.製のQUARTZO(登録商標)(WG)及びPRESENCE(登録商標)(WP)) + TX; バチルスメチロトロフィカス(Bacillus methylotrophicus) 菌株BAC-9912(Chinese Academy of Sciences' Institute of Applied Ecology製) + TX; Certis USA LLCからのバチルスモハベンス(Bacillus mojavensis) 菌株R3B(受入番号NCAIM(P)B001389)(国際公

20

30

40

50

開第2013/034938号)+TX;パチルスマイコイデス(*Bacillus mycoides*)、アイソレート、受入番号B-30890を有する(Certis USA LLCからBMJ TGA I(登録商標)又はWG及びLifeGard(商標)として入手可能)+TX;パチルスプミルス(*Bacillus pumilus*)、特に菌株QST2808(Bayer CropScience LP, USからSONATA(登録商標)として入手可能、受入番号NRRL B-30087を有する、米国特許第6,245,551号明細書に記載)+TX;パチルスプミルス(*Bacillus pumilus*)、特に菌株GB34(Bayer AG, DEからYield Shield(登録商標)として入手可能)+TX;パチルスプミルス(*Bacillus pumilus*)、特にNRRL受入番号50185を有する菌株BU F-33(BASFからのCARTISSA製品の一部として入手可能、EPA登録番号71840-19)+TX;パチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)、特に菌株QST713/AQ713(Bayer CropScience LP, USからSERENADE OPTI又はSERENADE ASOとして入手可能、NRRL受入番号B21661を有する、米国特許第6,060,051号明細書に記載)+TX;パチルスサブチリスY1336(*Bacillus subtilis* Y1336)(Bion-Tech, TaiwanからBIOBAC(登録商標)WPとして入手可能、登録番号4764、5454、5096及び5277で台湾において生物学的殺菌・殺カビ剤として登録されている)+TX;パチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)菌株MBI 600(BASF SEからSUBTILEXとして入手可能)、受入番号NRRL B-50595を有する、米国特許第5,061,495号明細書+TX;パチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)菌株GB03(Bayer AG, DEからKodiak(登録商標)として入手可能)+TX;パチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)菌株BU1814(BASF SEからVELONDIS(登録商標)PLUS、VELONDIS(登録商標)FLEX及びVELONDIS(登録商標)EXTRAとして入手可能)+TX;Certis USA LLC(三井物産株式会社の子会社)からのパチルスサブチリスCX-9060(*Bacillus subtilis* CX-9060)+TX;パチルスサブチリスKTSB(*Bacillus subtilis* KTSB)菌株(Donaghys製のFOLIACTIVE(登録商標))+TX;パチルスサブチリスIAB/BS03(*Bacillus subtilis* IAB/BS03)(STK Bio-Ag Technologies製のAVIV(商標)、Idai Nature製のPORTENTO(登録商標))+TX;パチルスサブチリス(*Bacillus subtilis*)菌株Y1336(Bion-Tech, Taiwan製のBIOBAC(登録商標)WPとして入手可能、登録番号4764、5454、5096及び5277で台湾において生物学的殺菌・殺カビ剤として登録されている)+TX;BASF SEからのパエニパチルスエピフィチカス(*Paenibacillus epiphyticus*)(国際公開第2016/020371号)+TX;BASF SEからのパエニパチルスポリミクスプラントム(*Paenibacillus polymyxa* ssp. *plantarum*)(国際公開第2016/020371号)+TX;受入番号NRRL B-50972又は受入番号NRRL B-67129を有するパエニバシラス属の一種(*Paenibacillus* sp.)菌株、国際公開第2016/154297号+TX;シュードモナスクロロラフィス(*Pseudomonas chlororaphis*)菌株AFS009、受入番号NRRL B-50897を有する、国際公開第2017/019448号(例えば、AgBiome Innovations, US製のHOWLER(商標)及びZIO(登録商標))+TX;シュードモナスクロロラフィス(*Pseudomonas chlororaphis*)、特に菌株MA342(例えばBioagri and KopperによるCEDOMON(登録商標)、CERALL(登録商標)及びCEDRESS(登録商標))+TX;シュードモナスフルオレッセンス(*Pseudomonas fluorescens*)菌株A506(例えばNuFarmによるB

LIGHTBAN (登録商標) A506) + TX; シュードモナスプロラディクス (Pseudomonas proradix) (例えば Sourcon Padena 製の PRORADIX (登録商標)) + TX; ストレプトマイセスグリセオビリディス (Streptomyces griseoviridis) 菌株 K61 (ストレプトマイセスガルブス (Streptomyces galbus) 菌株 K61 としても公知である) (受入番号 DSM7206) (Verdera からの MYCOSTOP (登録商標)、BioWorks 製の PREFENCE (登録商標)、Crop Protection 2006, 25, 468 - 475 を参照されたい) + TX; ストレプトマイセスリディクス (Streptomyces lydicus) 菌株 WYEC108 (ストレプトマイセスリディクス (Streptomyces lydicus) 菌株 WYCD108US としても公知である) (Novozymes 製の ACTINO-IRON (登録商標) 及び ACTINOVATE (登録商標)) + TX; 並びに

(2.2) その例は、以下のとおりである真菌：アムペロマイセススキスクアリス (Ampelomyces quisqualis)、特に菌株 AQ 10 (例えば IntrachemBio Italia による AQ 10 (登録商標)) + TX; 受入番号 CNCM 1-807 を有するアムペロマイセススキスクアリス (Ampelomyces quisqualis) 菌株 AQ10 (例えば、IntrachemBio Italia による AQ 10 (登録商標)) + TX; アスペルギルスフラブス (Aspergillus flavus) 菌株 NRRL 21882 (Syngenta / ChemChina 製の AFLA-GUARD (登録商標) として知られる製品) + TX; アウレオバシジウムブルランス (Aureobasidium pullulans)、特に菌株 DSM14940 の分芽胞子 + TX; アウレオバシジウムブルランス (Aureobasidium pullulans)、特に菌株 DSM 14941 の分芽胞子 + TX; アウレオバシジウムブルランス (Aureobasidium pullulans)、特に菌株 DSM 14940 及び DSM 14941 の分芽胞子の混合物 (例えば bio-ferm, CH による Botelector (登録商標)) + TX; ケトミウムクブレウム (Chaetomium cupreum) (受入番号 CABI 353812) (例えば AgriLife による BLOKUPRUM (商標)) + TX; カエトミウムグロボスム (Chaetomium globosum) (Rivale による RIVADIOM (登録商標) として入手可能) + TX; クラドスポリウムクラドスポリオイデス (Cladosporium cladosporioides)、菌株 H39、受入番号 CBS122244 を有する、米国特許出願公開第 2010/0291039 号明細書 (Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek) + TX; コニオチリウムミニタンス (Coniothyrium minitans)、特に菌株 CON/M/91-8 (受入番号 DSM9660、例えば Bayer CropScience Biologics GmbH 製の Contans (登録商標)) + TX; クリプトコッカスフラベセンス (Cryptococcus flavescens)、菌株 3C (NRRL Y-50378)、(B2.2.99) + TX; ダクチラリアカンジダ (Dactylaria Candida) + TX; ジロホスホラアロペクリ (Dilophosphora alopecuri) (TWIST FUNGUS (登録商標) として入手可能) + TX; フザリウム オキシスポルム (Fusarium oxysporum)、菌株 Fo47 (Natural Plant Protection による FUSACLEAN (登録商標) として入手可能) + TX; グリオクラジウムカテナラタム (Gliocladium catenulatum) (同義語：クロノスタキスロゼアカテナラータ (Clonostachys rosea f. catenulate)) 菌株 J1446 (例えば Lallemand による Prestop (登録商標)) + TX; グリオクラジウムロセウム (Gliocladium roseum) (クロノスタキスロゼアフロゼア (Clonostachys rosea f. rosea) としても公知である)、特に菌 Adjuvants Plus から株 321U、Xue A.G. に開示されている菌株 ACM941 (Efficacy of Clonostachys ro

sea strain ACM941 and fungicide seed treatments for controlling the root rot complex of field pea, Can. J. Plant Sci. 2003, 83(3): 519-524) 又は菌株 IK726 (Jensen DF, et al. Development of a biocontrol agent for plant disease control with special emphasis on the near commercial fungal antagonist *Clonostachys rosea* strain 'IK726', Australasian Plant Pathol. 2007, 36(2), 95-101) + TX;

菌株 KV01 のレカニシリウムレカニイ (*Lecanicillium lecanii*) (過去には、ベルチシリウムレカニイ (*Verticillium lecanii*) として公知) 分生子 (例えば Kopper / Arysta による Vertalec (登録商標)) + TX; メツシュニコウィアフルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*)、特に菌株 NRRL Y-30752、(B2.2.3) + TX; ミクロスファエロプシスオクラセア (*Microsphaeropsis ochracea*) + TX; ムスコドルロセウス (*Muscodora roseus*)、特に菌株 A3-5 (受入番号 NRRL 30548) + TX; BASF SE からのペニシリウムステッキイ (*Penicillium steckii*) (DSM 27859、国際公開第 2015/067800 号) + TX; ペニシリウムベルミクラツム (*Penicillium vermiculatum*) + TX; カミカワタケ (*Phlebiopsis gigantea*) 菌株 VRA 1992 (Danstar Ferment 製の ROTSTOP (登録商標) C) + TX; ピチアアノマラ (*Pichia anomala*)、菌株 WRL-076 (NRRL Y-30842)、米国特許第 7,579,183 号明細書 + TX; シュードジマフロクロッサ (*Pseudozyma flocculosa*)、菌株 PF-A22 UL (Plant Products Co., CA による SPORODEX (登録商標) L として入手可能) + TX; サッカロマイセスセレビシエ (*Saccharomyces cerevisiae*)、特に菌株 LASO2 (Agro-Levures et Derives)、菌株 LAS117 細胞壁 (Lesaffre 製の CEREVISANE (登録商標)、BASF SE 製の ROMEO (登録商標))、Lesaffre et Compagnie, FR からの菌株 CNCM 番号 1-3936、CNCM 番号 1-3937、CNCM 番号 1-3938、CNCM 番号 1-3939 (国際公開第 2010/086790 号) + TX; シンプリシリウムラノソニヴェウム (*Simpliicillium lanosoniueum*) + TX; タラロマイセスフラバス (*Talaromyces flavus*)、菌株 V117b + TX; トリコデルマアスペロイデス JM41R (*Trichoderma asperelloides* JM41R) (受入番号 NRRL B-50759) (BASF SE 製の TRICHOPLUS (登録商標)) + TX; トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*)、特に菌株 kd (例えば Andermatt Biocontrol からの T-Gro) + TX; トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*)、特に菌株 SKT-1、受入番号 FERM P-16510 を有する (例えば クミアイ化学工業株式会社製の ECO-HOPE (登録商標))、菌株 T34 (例えば Biocontrol Technologies S.L., ES による T34 Biocontrol) 又は Isagro からの菌株 ICC 012 + TX; トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に菌株 SC1 (受入番号 CBS 122089、国際公開第 2009/116106 号及び米国特許第 8,431,120 号明細書 (Bi-PA))、菌株 77B (Andermatt Biocontrol からの T77) 又は菌株 LU132 (例えば Agrimm Technologies Ltd. からの Sentinel) + TX; トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株 CNCM 1-1237 (例えば Agrauxine, FR からの Esquive (登録商標) WP) + TX; ト

リコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株番号
 V08/002387+TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma a*
troviride)、菌株NMI番号V08/002388+TX; トリコデルマアト
 ロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株NMI番号V08/
 002389+TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atrov*
iride)、菌株NMI番号V08/002390+TX; トリコデルマアトロビリデ
 (*Trichoderma atroviride*)、菌株LC52 (例えばAgrim
 m Technologies Ltd. によるTenet)+TX; トリコデルマアト
 ロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌株ATCC 2047
 6 (IMI 206040)+TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderm*
a atroviride)、菌株T11 (IMI352941/CECT20498)
 +TX; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)
 、菌株SKT-1 (FERM P-16510)、特開平11-253151号公報+T
 X; トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、菌
 株SKT-2 (FERM P-16511)、特開平11-253151号公報+TX;
 トリコデルマアトロビリデ (*Trichoderma atroviride*)、
 菌株SKT-3 (FERM P-17021)、特開平11-253151号公報+TX
 ; トリコデルマフェルティル (*Trichoderma fertile*) (例えばBA
 SF製の製品TrichoPlus)+TX; トリコデルマガムシイ (*Trichode*
rma gamsii) (旧名T. ヴィリデ (*T. viride*))、菌株ICC080
 (IMI CC 392151 CABI、例えばAGROBIOSOL DE MEX
 ICO, S. A. DE C. V. によるBioDerma)+TX; トリコデルマガムシ
 イ (*Trichoderma gamsii*) (旧名T. ヴィリデ (*T. viride*))
)、菌株ICC 080 (IMI CC 392151 CABI) (AGROBIOS
 OL DE MEXICO, S. A. DE C. V. によるBIODERMA (登録商標
)として入手可能)+TX; トリコデルマハルマツム (*Trichoderma har*
matum)+TX; 受入番号ATCC 28012を有するトリコデルマハルマツム (*Trichoderma harmatum*)+TX; トリコデルマハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) 菌株T-22 (例えばAndermatt
 Biocontrol又はKopper tからのTrianium-P) 又は菌株Cepa
 SimbT5 (Simbiose Agro)+TX; トリコデルマハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)+TX; トリコデルマハルジアヌムリファイ
 T39 (*Trichoderma harzianum rifai T39*) (例えば
 Makhteshim, US製のTrichodex (登録商標))+TX; トリコデル
 マハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、菌株ITEM 90
 8 (例えばKopper tからのTrianium-P)+TX; トリコデルマハルジアヌ
 ム (*Trichoderma harzianum*)、菌株TH35 (例えばMycon
 trolによるRoot-Pro)+TX; トリコデルマハルジアヌム (*Trichod*
erma harzianum)、菌株DB 103 (Dagut at Biolabに
 よりT-GRO (登録商標) 7456として入手可能)+TX; トリコデルマポリスポル
 ム (*Trichoderma polysporum*)、菌株IMI 206039 (例
 えばBINAB Bio-Innovation AB, SwedenによるBinab
 TF WP)+TX; 受入番号Ts3550を有するトリコデルマストロマチウム (*Trichoderma stromaticum*)、(例えばCEPLAC, Brazil
 によるTricovab)+TX; トリコデルマビレンス (*Trichoderma v*
irens) (グリオクラジウムビレンス (*Gliocladium virens*) と
 しても公知である)、特に菌株GL-21 (例えばCertis, USによるSoilG
 ard)+TX; トリコデルマビレンス (*Trichoderma virens*) 菌株
 G-41、過去にグリオクラジウムビレンス (*Gliocladium virens*)
 として公知 (受入番号ATCC 20906) (例えば、BioWorks, US製のR

OOTSHIELD (登録商標) PLUS WP 及び TURF SHIELD (登録商標) PLUS WP) + TX; トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、菌株 TV1 (例えば Kopper t による *Triatum - P*) + TX; トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、特に菌株 B35 (*Pietre t al.*, 1993, *Zesz. Nauk. A R w Szc zecinie* 161:125-137) + TX; トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 ICC 012 (トリコデルマハルジアヌム ICC012 (*Trichoderma harzianum ICC012*)) としても公知である)、受入番号 CABI CC IMI 392716 を有する、トリコデルマガムシ (*Trichoderma gamsii*) (旧名 *T. ヴィリデ* (*T. viride*)) 菌株 ICC 080、受入番号 IMI 392151 (例えば、Isagro USA、Inc. 製の BIO-TAM (商標) 又は Agrobiosol de Mexico, S. A. de C. V. による BIODERMA (登録商標)) の混合物 + TX; 受入番号 NM 99/06216 を有する ウロクラディウム オウデマンシ (*Ulocladium oudemansii*) 菌株 U3 (例えば、Botry-Zen Ltd, New Zealand による BOTRY-ZEN (登録商標) 及び BioWorks, Inc. 製の BOTRYSTOP (登録商標)) + TX; パーティシリウム アルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) (旧名 *V. ダーリエ* (*V. dahliae*))、受入番号 WCS850 を有する 菌株 WCS850、Central Bureau for Fungi Cultures に寄託されている (例えば、Tree Care Innovations 製の DUTCH TRIG (登録商標)) + TX; ベルチシリウム クラミドスポリウム (*Verticillium chlamydosporium*) + TX;

(3) 以下の群から選択される植物の成長及び/又は植物の健康を改善する効果を有する生物学的防除剤:

(3.1) その例は、以下のとおりであるバクテリア: アゾスピリルム ブラシレンセ (*Azospirillum brasilense*) (例えば、KALO, Inc. 製の VIGOR (登録商標)) + TX; アゾスピリルム リポフェルム (*Azospirillum lipoferum*) (例えば、TerraMax, Inc. 製の VERTEX-IF (商標)) + TX; アゾリゾビウム カウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*)、特に菌株 ZB-SK-5 + TX; アゾトバクター クロオコッカム (*Azotobacter chroococcum*)、特に菌株 H23 + TX; アゾトバクター ビネランジイ (*Azotobacter vinelandii*)、特に菌株 ATCC 12837 + TX; アゾトバクター ビネランジイ (*Azotobacter vinelandii*) 及び クロストリジウム パステウリアナム (*Clostridium pasteurianum*) の混合物 (Agrinos から INVIGORATE (登録商標) として入手可能) + TX; パチルス アミロリケファシエンス pm414 (*Bacillus amyloliquefaciens pm414*) (Biofilm Crop Protection 製の LOLI-PEPTA (登録商標)) + TX; パチルス アミロリケファシエンス SB3281 (*Bacillus amyloliquefaciens SB3281*) (ATCC #PTA-7542、国際公開第2017/205258号) + TX; パチルス アミロリケファシエンス TJ1000 (*Bacillus amyloliquefaciens TJ1000*) (Novozymes から QUIKROOTS (登録商標) として入手可能) + TX; パチルス アミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株 IN937a + TX; パチルス アミロリケファシエンス (*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株 FZB42 (例えば ABITEP, DE 製の RHIZOVITAL (登録商標)) + TX; パチルス アミロリケファシエンス BS27 (*Bacillus amyloliquefaciens BS27*) (受入番号 NRRL B-5015) + TX; パチルス セレウス (*Bacillus cereus*) 科の構成員 EE128 (

NRRL 番号 B - 50917) + TX ; パチルスセレウス (*Bacillus cereus*) 科の構成員 EE349 (NRRL 番号 B - 50928) + TX ; パチルスセレウス (*Bacillus cereus*)、特に菌株 BP01 (ATCC 55675、例えば *Arysta Lifescience*, US 製の MEPICHLOR (登録商標)) + TX ; パチルスフィルムス (*Bacillus firmus*)、特に菌株 CNMC 1 - 1582 (例えば BASF SE 製の VOTIVO (登録商標)) + TX ; パチルスマイコイデス BT155 (*Bacillus mycooides* BT155) (NRRL 番号 B - 50921) + TX ; パチルスマイコイデス EE118 (*Bacillus mycooides* EE118) (NRRL 番号 B - 50918) + TX ; パチルスマイコイデス EE141 (*Bacillus mycooides* EE141) (NRRL 番号 B - 50916) + TX ; パチルスマイコイデス BT46 - 3 (*Bacillus mycooides* BT46 - 3) (NRRL 番号 B - 50922) + TX ; パチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株 QST2808 (受入番号 NRRL 番号 B - 30087) + TX ; パチルスプミルス (*Bacillus pumilus*)、特に菌株 GB34 (例えば *Bayer Crop Science*, DE 製の YIELD SHIELD (登録商標)) + TX ; パチルスシアメンシス (*Bacillus siamensis*)、特に菌株 KCTC 13613T + TX ; パチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 QST713 / AQ713 (NRRL 受入番号 B - 21661 を有し、及び米国特許第 6,060,051 号明細書に記載、*Bayer Crop Science LP*, US から SERENADE (登録商標) OPTI 又は SERENADE (登録商標) ASO として入手可能) + TX ; パチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 AQ30002 (受入番号 NRRL B - 50421 及び米国特許出願公開第 13 / 330,576 号明細書に記載) + TX ; パチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 AQ30004 (NRRL 番号 B - 50455 及び米国特許出願公開第 13 / 330,576 号明細書に記載) + TX ; パチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 BU1814、(BASF SE から TEQUALIS (登録商標) として入手可能)、枯草菌 rm303 (*Bacillus subtilis* rm303) (*Biofilm Crop Protection* 製の RHIZOMAX (登録商標)) + TX ; パチルスチューリングエンシス BT013A (*Bacillus thuringiensis* BT013A) (NRRL 番号 B - 50924) (パチルスチューリングエンシス 4Q7 (*Bacillus thuringiensis* 4Q7) としても公知である) + TX ; パチルスリケニホルミス FMCH001 (*Bacillus licheniformis* FMCH001) 及びパチルスサブチリス FMCH002 (*Bacillus subtilis* FMCH002) の混合物 (FMC Corporation から QUARTZO (登録商標) (WG)、PRESENCE (登録商標) (WP) として入手可能) + TX ; パチルスサブチリス (*Bacillus subtilis*)、特に菌株 MBI 600 (例えば BASF SE 製の SUBTILEX (登録商標)) + TX ; パチルステキレンシス (*Bacillus tequilensis*)、特に菌株 NII - 0943 + TX ; ダイズ根粒菌 (*Bradyrhizobium japonicum*) (例えば *Novozymes* 製の OPTIMIZE (登録商標)) + TX ; デルフイアアシドボランス (*Delftia acidovorans*)、特に菌株 RAY209 (例えば *Brett Young Seeds* からの BIOBOOST (登録商標)) + TX ; メソリゾビウムシセリ (*Mesorhizobium cicer*) (例えば、BASF SE からの NODULATOR) + TX ; ラクトパチルス属の一種 (*Lactobacillus* sp.) (例えば *LactoPAFI* 製の LACTOPLANT (登録商標)) + TX ; ヘアリーベッチ根粒菌 (*Rhizobium leguminosarium* biovar *viciae*) (例えば、BASF SE からの NODULATOR) + TX ; シュードモナスプロラディクス (*Pseudomonas proradix*) (例えば *Sourcon Padena* 製の PRORADIX (登録商標)) + TX ; 緑膿

菌 (*Pseudomonas aeruginosa*)、特に菌株 PN1 + TX；リゾビウムレグミノサルム (*Rhizobium leguminosarum*)、特に bv. viceae 菌株 Z25 (受入番号 CECT 4585) + TX；バエニバチルスポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*)、特に菌株 AC-1 (例えば Green Biotech Company Ltd. 製の TOPSEED (登録商標)) + TX；セラチアマルセセンス (*Serratia marcescens*)、特に菌株 SRM (受入番号 MTCC 8708) + TX；アルファルファ根粒菌 (*Sinorhizobium meliloti*) 菌株 NRG-185-1 (Bayer Crop Science 製の NITRAGIN (登録商標) GOLD) + TX；チオバチルス属の一種 (*Bacillus* sp.) (例えば Cropaid Ltd UK 製の CROPAID (登録商標)) + TX；並びに

(3.2) その例は、以下のとおりである真菌：プルプレオチリウムリラシヌム (*Purpureocillium lilacinum*) (過去には、パエシロマイセスリラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) として知られている) 菌株 251 (AGAL 89/030550、例えば Bayer Crop Science Biologics GmbH からの BioAct) + TX；ペニシリウムビライイ (*Penicillium bilaii*)、菌株 ATCC 22348 (例えば Acceleron BioAg 製の JumpStart (登録商標))、タラロマイセスフラバス (*Talaromyces flavus*)、菌株 V117b + TX；トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 CNCM 1-1237 (例えば Agrauxine, FR 製の Esquive (登録商標) WP)、トリコデルマビリデ (*Trichoderma viride*)、例えば菌株 B35 (Pietre et al., 1993, Zesz. Nauk. A R w S z c z e c i n i e 161:125-137) + TX；トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 LC52 (トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 LU132 としても公知である、例えば Agrimm Technologies Ltd. からの Sentinel (登録商標)) + TX；トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*) 菌株 SC1 (国際公開第 2009/116106 号に記載) + TX；トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 kd (例えば Andermatt Biocontrol からの T-Gro) + TX；トリコデルマアスペレルム (*Trichoderma asperellum*) 菌株 (Plant Health Products, ZA 製の Eco-T) + TX、トリコデルマハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) 菌株 T-22 (例えば Andermatt Biocontrol 又は Koppert からの Trianum-P) + TX；ミロテシウムベルカリア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 AARC-0255 (例えば Valent Biosciences 製の DiTera (商標)) + TX；ペニシリウムビライイ (*Penicillium bilaii*) 菌株 ATCC ATCC20851 + TX；ピシウムオリガンドラム (*Pythium oligandrum*) 菌株 M1 (ATCC38472、例えば Bioprepraty, CZ からの Polyversum) + TX；トリコデルマビレンス (*Trichoderma virens*) 菌株 GL-21 (例えば Certis, USA 製の SoilGard (登録商標)) + TX；バーティシリウムアルボアトルム (*Verticillium albo-atrum*) (旧名 V. ダーリエ (*V. dahliae*)) 菌株 WCS850 (CBS276.92、例えば Tree Care Innovations からの Dutch Trig) + TX；トリコデルマアトロピリデ (*Trichoderma atroviride*)、特に菌株番号 V08/002387、菌株番号 NMI 番号 V08/002388、菌株番号 NMI 番号 V08/002389、菌株番号 NMI 番号 V08/002390 + TX；トリコデルマハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*) 菌株 ITEM 908、トリコデルマハルジアヌム (*Trichoderma harzianum*)、菌株

TSTh20+TX;トリコデルマハルジアヌム(*Trichoderma harzianum*)菌株1295-22+TX;ピシウムオリガンドラム(*Pythium oligandrum*)菌株DV74+TX;リゾポゴンアミロポゴン(*Rhizopogon amylopogon*)(例えば、Agri-Enterprise, LLC、旧Helena Chem. CompanyからのMycosol)+TX;リゾポゴンフルビグレバ(*Rhizopogon fulvigleba*)(例えば、Agri-Enterprise, LLC、旧Helena Chem. CompanyからのMycosol)+TX;トリコデルマビレンス(*Trichoderma virens*)菌株GI-3+TX;

(4)以下から選択される殺虫的に有効な生物学的防除剤

10

(4.1)その例は、以下のとおりであるバクテリア:アグロバクテリウムラジオバクター(*Agrobacterium radiobacter*)菌株K84(AgBiochem Inc.からのGalltrol)+TX;バチルスアミロリケファシエンス(*Bacillus amyloliquefaciens*)、特に菌株PTS-4838(例えばValent Biosciences, USからのAVEO)+TX;バチルスフィルムス(*Bacillus firmus*)、特に菌株CNMC1-1582(例えばBASF SE製のVOTIVO(登録商標))+TX;*Bacillus mycoides*, isolate J.(例えばCertis USA LLCからのBmJ)+TX;バチルススファエリクス(*Bacillus sphaericus*)であって、特にSerotype H5a5b菌株2362(菌株ABTS-1743)(例えばValent Biosciences, US製のVECTOLEX(登録商標))+TX;バチルスチューリングエンシスアイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. aizawai)、特に菌株ABTS-1857(SD-1372、例えばValent Biosciences製のXENTARI(登録商標))+TX;バチルスチューリングエンシスアイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. aizawai)、特にserotype H-7(例えばValent Biosciences, US製のFLORBAC(登録商標)WG)+TX;バチルスチューリングエンシスイスラエレンシス(*Bacillus thuringiensis israelensis*)菌株BMP 144(例えばBecker Microbial Products, ILによるAQUABAC(登録商標))+TX;

バチルスチューリングエンシスイスラエレンシス(*Bacillus thuringiensis* subsp. israelensis)(serotype H-14)菌株AM65-52(受入番号ATCC 1276)(例えばValent Biosciences, USによるVECTOBAC(登録商標))+TX;バチルスチューリングエンシスアイザワイ(*Bacillus thuringiensis* subsp. aizawai)菌株GC-91+TX;バチルスチューリングエンシスvar.コルメリ(*Bacillus thuringiensis* var. Colmeri)(例えばChangzhou Jianghai Chemical FactoryによるTIANBAOBT)+TX;バチルスチューリングエンシスvar.ジャポネンシス(*Bacillus thuringiensis* var. japonensis)菌株Buibu

i+TX;バチルスチューリングエンシスクルスターキ(*Bacillus thuringiensis* subsp. kurstaki)菌株BMP 123(Becker Microbial Products, IL製)+TX;Becker Microbial Products, ILによるバチルスチューリングエンシスクルスターキ(*Bacillus thuringiensis* subsp. kurstaki)菌株BMP 123、例えばBayer CropScienceからのBARITONE+TX;バチルスチューリングエンシスクルスターキ(*Bacillus thuringiensis* subsp. kurstaki)菌株HD-1(例えばValent Biosciences, US製のDIPEL(登録商標)ES)+TX;バチルスチューリングエンシスvar.クルスターキ(*Bacillus thuringiensis* var

20

30

40

50

. kurstaki) 菌株 EVB - 113 - 19 (例えば、AEF Global 製の BIOPROTEC (登録商標)) + TX; バチルスチューリングエンシスクルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 ABTS351 + TX; バチルスチューリングエンシスクルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 PB 54 + TX; バチルスチューリングエンシスクルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 SA 11 (Certis, US からの JAVELIN (登録商標)) + TX; バチルスチューリングエンシスクルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 SA 12 (Certis, US からの THURICIDE) + TX; バチルスチューリングエンシス 10
 スクルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 EG2348 (Certis, US からの LEPINOX (登録商標)) + TX; バチルスチューリングエンシスクルスターキ (Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki) 菌株 EG 7841 (Certis, US からの CryMAX (登録商標)) + TX; バチルスチューリングエンシステネブリオニス (Bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis) 菌株 NB176 (SD - 5428、例えば BioFarma 製の NOVODOR (登録商標) FC) + TX; プレビバチルスラテロスポラス (Brevibacillus laterosporus) (Ecolibrium Biologicals Ltd. からの LATERAL (登録商標)) + TX; バークホルデリア属の種 (Burkholderia spp.)、特に バークホルデリアリノジェンシス (Burkholderia rinojensis) 菌株 A396 (バークホルデリアリノジェンシス (Burkholderia rinojensis) 菌株 MBI 305 としても公知である) (受入番号 NRRL B - 50319; 国際公開第 2011/106491 号及び 20
 国際公開第 2013/032693 号; 例えば Marrone Bio Innovations 製の MBI206 TGA I 及び ZELTO (登録商標) + TX; クロモバクテリウムサブツガエ (Chromobacterium subtsugae)、特に 菌株 PRAA4 - 1T (例えば、MBI - 203; 例えば Marrone Bio Innovations 製の GRANDEVO (登録商標)) + TX; レカニシリウムムスカリウム Ve6 (Lecanicillium muscarium Ve6) (Kopper 30
 t からの MYCOTAL) + TX; パエニバチルスポピリエ (Paenibacillus popilliae) (旧名バチルスポピリエ (Bacillus popilliae)); 例えば St. Gabriel Laboratories 製の MILKY SPORE POWDER (商標) 又は MILKY SPORE GRANULAR (商標) + TX; パスツリアニシザワエ (Pasteuria nishizawae) 菌株 Pn1 (Syngenta / ChemChina からの CLARIVA) + TX; セラチアエントモフィラ (Serratia entomophila) (例えば Wrightson Seeds による INVADE (登録商標)) + TX; セラチアマルセセンス (Serratia marcescens)、特に 菌株 SRM (受入番号 MTCC 8708) + TX; トリコデルマアスペレルム (Trichoderma asperellum 40
) (Novozymes からの TRICHODERMAX) + TX; ボルバキアピピエンティス (Wolbachia pipientis) ZAP 菌株 (例えば、MosquitoMate 製の ZAP MALES (登録商標)) + TX; 並びに
 (4.2) 例が以下のものである真菌: ベアウベリアバッシアナ (Beauveria bassiana) 菌株 ATCC 74040 (例えば Intrachem Bio Italia 製の NATURALIS (登録商標)) + TX; ベアウベリアバッシアナ (Beauveria bassiana) 菌株 GHA (受入番号 ATCC 74250、例えば Laverlam Int. Corp. 製の BOTANIGUARD (登録商標) ES 及び MYCONTROL - O (登録商標)) + TX; ベアウベリアバッシアナ (Beauveria bassiana) 菌株 ATP02 (受入番号 DSM 24665) + TX; 50

イサリアフモソロセア (*Isaria fumosorosea*) (過去にはパエシロマイセスフモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) として知られている、菌株 Apopka 97、例えば SePRO からの PREFERAL (登録商標) + TX; メタリジウムアニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) 3213-1 (NRRL 受入番号 67074 で寄託されている、国際公開第 2017/066094 号に開示; Pioneer Hi-Bred International) + TX; メタリジウムロベルツイイ (*Metarhizium robertsii*) 15013-1 (NRRL 受入番号 67073 で寄託されている) + TX; メタリジウムロベルツイイ (*Metarhizium robertsii*) 23013-3 (NRRL 受入番号 67075 で寄託されている) + TX; パエシロマイセスリラスヌス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (Certis, US からの MELOCON (登録商標)) + TX; ズーフトララジカンス (*Zoophthora radicans*) + TX;

(5) 以下からなる群から選択されるウイルス: リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana*) (リンゴコカクモンハマキ) グラニューローシスウイルス (GV) + TX; コドリング (*Cydia pomonella*) (コドリング) グラニューローシスウイルス (GV) + TX; オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) (オオタバコガ (cotton bollworm)) 核多角体病ウイルス (NPV) + TX; シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*) (シロイチモジヨトウ) mNPV + TX; スポドプテラフルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*) (ツマジロクサヨトウ) mNPV + TX; エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ) NPV + TX;

(6) 以下から選択される、植物又は植物部位又は植物組織に「接種株」として付加可能であり、その特定の特性のために、植物の成長及び植物の健康を促進させるバクテリア及び真菌: アグロバクテリウム (*Agrobacterium* spp.) + TX; アゾリゾビウムカウリノダンス (*Azorhizobium caulinodans*) + TX; アゾスピリルム属の種 (*Azospirillum* spp.) + TX; アゾトバクター属の種 (*Azotobacter* spp.) + TX; ブラジリゾビウム属の種 (*Bradyrhizobium* spp.) + TX; バークホルデリア属の種 (*Burkholderia* spp.)、特にバークホルデリアセパシア (*Burkholderia cepacia*) (過去には、シュードモナスセパシア (*Pseudomonas cepacia*) として公知である) + TX; ギガスポラ属の種 (*Gigaspora* spp.) 又はギガスポラモノスポルム (*Gigaspora monosporum*) + TX; グロムス属の種 (*Glomus* spp.) + TX; キツネタケ属の種 (*Laccaria* spp.) + TX; ラクトバチルスブクネリ (*Lactobacillus buchneri*) + TX; パラグロムス属の種 (*Paraglomus* spp.) + TX; コツブタケ (*Pisolithus tinctorius*) + TX; シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.) + TX; リゾビウム属の種 (*Rhizobium* spp.)、特にクローバー根粒菌 (*Rhizobium trifolii*) + TX; ショウロ属の種 (*Rhizopogon* spp.) + TX; ニセショウロ属の種 (*Scleroderma* spp.) + TX; ヌメリイグチ属の種 (*Suillus* spp.) + TX; ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces* spp.) + TX;

(7) 以下から選択される、生物学的防除剤として使用可能である、タンパク質及び二次代謝産物を含む微生物により形成された植物抽出物及び生成物: ニンニク (*Allium sativum*) (Eco-Spray からの NEMGUARD); ADAMA からの BRALIC) + TX; Armour-Zen + TX; ニガヨモギ (*Artemisia absinthium*) + TX; アザジラクチン (例えば Certis, US からの AZATIN XL) + TX; Biokeeper WP + TX; アブラナ科 (*Brassicaceae*) 抽出物、特にアブラナ粉末又はマスタード粉末 + TX; カシヤニグリカ

ンス (Cassia nigricans) + TX ; ケラストルスアングラツス (Celastrus angulatus) + TX ; ケンボジウムアンテルミンチウム (Chenopodium anthelminticum) + TX ; キチン + TX ; セイヨウオシダ (Dryopteris filix-mas) + TX ; スギナ (Equisetum arvense) + TX ; Fortune Aza + TX ; Fungastop + TX ; キヌア種子からのキヌア (Chenopodium quinoa) サポニン抽出物 (例えば、Heads Up plant Protectants, CA製のHeads Up (登録商標) (キヌアのサポニン)) + TX ; ルピナス種子から抽出された天然のBladポリペプチド (Certis EU製のPROBLAD (登録商標)) + TX ; ルピナス種子から抽出された天然のBladポリペプチド (FMC製のFRAC TURE (登録商標)) + TX ; ジョチュウギクノピレトリン + TX ; クアッシアアマラ (Quassia amara) + TX ; コナラ属 (Quercus) + TX ; キラヤ属 (Quillaja) 抽出物 (BAS FからのQL AGRI 35) + TX ; オオイタドリ (Reynoutria sachalinensis) 抽出物 (Marrone BioからのREGALLIA (登録商標) REGALLIA (登録商標) MAXX) + TX ; 「Requiem (商標) Insecticide」 + TX ; ロテノン + TX ; リアニアノリアノジン + TX ; ヒレハリソウ (Symphytum officinale) + TX ; タンジー (Tanacetum vulgare) + TX ; チモール + TX ; ゲラニオールと混合したチモール (Eden ResearchからのCEDROZ) + TX ; ゲラニオール及びオイゲノールと混合したチモール (Eden ResearchからのMEVALONE (登録商標)) + TX ; Triact 70 + TX ; TriCon + TX ; キンレンカ (Tropaeolum majus) + TX ; メラレウカアルテルニフォリア (Melaleuca alternifolia) 抽出物 (STKからのTIMOREX GOLD (登録商標)) + TX ; セイヨウイラクサ (Urtica dioica) + TX ; ベラトリン + TX ; 及びセイヨウヤドリギ (Viscum album) + TX ; 並びに
 ベノキサコール + TX、クロキントセット (クロキントセットメキシルを含む) + TX、シプロスルファミド + TX、ジクロルミド + TX、フェンクロラゾール (フェンクロラゾール - エチルを含む) + TX、フェンクロリム + TX、フルキシフェニム + TX、フリラゾール + TX、イソキサジフェン (イソキサジフェン - エチルを含む) + TX、メフェンピル (メフェンピル - ジエチルを含む) + TX、メトカミフェン + TX 及びオキサベトリニル + TX などの毒性緩和剤。

【0277】

有効成分の後ろの角括弧における参照番号、例えば [3878 - 19 - 1] は、ケミカルアブストラクツ登録番号を意味する。上記の混合の相手は公知である。有効成分が、“The Pesticide Manual” [The Pesticide Manual - A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C. D. S. Tomlin; 英国作物保護協議会 (The British Crop Protection Council)] に含まれている場合、それらは、特定の化合物について上記で丸括弧内に示される項目番号でその中に記載されており ; 例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号 (1) で記載されている。「[CCN]」が上記で特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names” に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, (著作権) 1995 - 2004] ; 例えば、「アセトプロール」という化合物は、インターネットアドレス : <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> に記載されている。

【0278】

上記の有効成分のほとんどは、上記でいわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO

一般名」又は別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され；その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクト名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」若しくは「開発コード」が使用されるか、又はそれらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。

【0279】

有効成分に続く括弧中の商品名は、市販されている製品又はこの有効成分を含む製品を示す。

【0280】

表1～5及び表Pで定義されている化合物から選択される式(I)の化合物と、上記の有効成分との有効成分混合物は、表1～5及び表Pで定義されている化合物の1つから選択される化合物並びに上記の有効成分を好ましくは100:1～1:6000、特に50:1～1:50の混合比、より特に20:1～1:20、さらにより特に10:1～1:10、非常に特に5:1及び1:5の比率で(2:1～1:2の比率が特に好ましく、4:1～2:1の比率が同様に好ましい)、とりわけ1:1、又は5:1、又は5:2、又は5:3、又は5:4、又は4:1、又は4:2、又は4:3、又は3:1、又は3:2、又は2:1、又は1:5、又は2:5、又は3:5、又は4:5、又は1:4、又は2:4、又は3:4、又は1:3、又は2:3、又は1:2、又は1:600、又は1:300、又は1:150、又は1:35、又は2:35、又は4:35、又は1:75、又は2:75、又は4:75、又は1:6000、又は1:3000、又は1:1500、又は1:350、又は2:350、又は4:350、又は1:750、又は2:750、又は4:750の比率で含む。それらの混合比は、重量基準である。

【0281】

上記の混合物は、有害生物を防除する方法に使用され得、この方法は、上記の混合物を含む組成物を有害生物又はその環境に施用する工程を含むが、手術又は治療による人又は動物の身体の治療の方法及び人又は動物の身体で実施される診断方法を除く。

【0282】

表1～5及び表Pで定義されている化合物から選択される式(I)の化合物と、上記の1つ又は複数の有効成分とを含む混合物は、例えば、単一のレディミックス形態では、「タンクミックス」など、単一の有効成分の別個の製剤から構成される組み合わせられたスプレー混合物として且つ逐次、すなわち数時間又は数日間などのかなり短い期間で次々に施用される場合、単一の有効成分の併用で施用され得る。式(I)の化合物並びに上記の有効成分を施用する順序は、本発明を行うのに重要でない。

【0283】

本発明に係る組成物は、安定剤、例えば非エポキシ化又はエポキシ化植物油(例えば、エポキシ化ヤシ油、ナタネ油又は大豆油)、消泡剤、例えばシリコーン油、防腐剤、粘性調節剤、結合剤及び/又は粘着付与剤、肥料又は特定の効果を得るための他の有効成分、例えば殺菌剤、殺真菌剤、殺線虫剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤又は除草剤などのさらなる固体又は液体助剤も含み得る。

【0284】

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

【0285】

この組成物のための施用方法、すなわち噴霧、霧化、散布、はけ塗り、粉衣、拡散又は注ぎかけ(これらは、一般的な状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである)など、上記のタイプの有害生物を防除する方法及び上記のタイプの有害生物を防除

10

20

30

40

50

するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、 $0.1 \sim 1000 \text{ ppm}$ 、好ましくは $0.1 \sim 500 \text{ ppm}$ の有効成分である。1ヘクタール当たりの施用量は、一般に、1ヘクタール当たり $1 \sim 2000 \text{ g}$ の有効成分、特に $10 \sim 1000 \text{ g/ha}$ 、好ましくは $10 \sim 600 \text{ g/ha}$ である。

【0286】

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

10

【0287】

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

20

【0288】

種子という用語は、真正種子、種子片、吸枝、トウモロコシ粒、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽などを含むが、これらに限定されないあらゆる種類の種子及び植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態では、真正種子を意味する。

【0289】

本発明は、式Iの化合物で被覆若しくは処理されるか又はそれを含有する種子も含む。「で被覆又は処理されるか及び／又はそれを含有する」という用語は、一般に、有効成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が（再度）植え付けられるとき、有効成分を吸収し得る。一実施形態では、本発明は、式Iの化合物が付着された植物繁殖材料を提供する。さらに、これにより、式Iの化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が提供される。

30

【0290】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬及び種子ベレッティングなど、当技術分野で公知のすべての好適な種子処理技術を含む。式（I）の化合物の種子処理適用は、種まきの前又は種まき／種子の植え付けの際に噴霧又は種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

40

【0291】

本発明の化合物は、低施用量での効力がより高いこと及び／又は異なる有害生物防除によって他の類似の化合物と区別可能であり、これは、必要に応じて、より低い濃度、例えば 10 ppm 、 5 ppm 、 2 ppm 、 1 ppm 若しくは 0.2 ppm ；又は 300 、 200 若しくは 100 mg のAI/ m^2 などのより低い施用量を用いる実験手法を用いて、当業者により検証が可能である。より高い効力は、高い安全性プロファイル（地上及び地下の非標的生物（魚類、鳥類及びハチ類など）に対して、向上した物理化学的特性又は高い生分解性）によって観察可能である。

【0292】

本発明の各態様及び実施形態では、「本質的になる」及びその変化形は、「含む」及び

50

その変化形の好ましい実施形態であり、「からなる」及びその変化形は、「から本質的になる」及びその変化形の好ましい実施形態である。

【0293】

本出願の開示は、本明細書に開示される実施形態のあらゆる組み合わせを提供する。

【0294】

式 I の化合物に関する本明細書における開示は、各式 I - 1、I - 2、I - 3、I - 4、I - 1 a、I - 2 a、I - 3 a、I - 4 a、I - 5 a、II - 1、II - 2、II - 3、II - 4、II - 5、V - 1、V - 2、V - 3、V - 4、V - 5、VI - 1、VI - 2、VI - 3、VI - 4、VI - 5、VII - 1、VII - 2、VII - 3、VII - 4、VII - 5、XII - 1、XII - 2、XII - 3、XII - 4、XII - 5、XIV - 1、XIV - 2、XIV - 3、XIV - 4、XIV - 5、XV - 1、XV - 2、XV - 3又はXV - 4の化合物並びに表 1 ~ 5 及び P の化合物に関しても等しく適用されることに留意すべきである。

10

【実施例】

【0295】

以下の実施例は、本発明をさらに例示するが、本発明を限定するものではない。

【0296】

本発明の化合物は、低施用量で効力が高いことによって公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例で概述される実験手法を用い、必要に応じて例えば 60 ppm、20 ppm又は2 ppmといった低施用量を用いて当業者によって検証され得る。

20

【0297】

本明細書を通して、温度は、摂氏度 () で記載され、及び「mp .」は、融点を意味する。LC / MS は、液体クロマトグラフィ質量分光測定を意味し、装置及び方法の説明は、以下のとおりである。

【0298】

^1H NMR 及び ^{19}F NMR 計測値は、Bruker 400 MHz 分光計で記録し、化学シフトは、TMS (^1H) 又は CFCl_3 (^{19}F) 標準を基準として ppm で記載されている。スペクトルは、記載のとおり重溶媒中で計測した。以下の LCMS 方法の 1 つを用いて化合物を特徴付けした。各化合物について得た特徴的な LCMS 値は、保持時間 (「Rt」、分単位で記録) 及び実測分子イオン ($\text{M} + \text{H}$)⁺ 又は ($\text{M} - \text{H}$)⁻ であった。

30

【0299】

LC - MS 及び GC - MS 法 :

方法 1 :

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性 : 陽極及び陰極性スイッチ)、キャピラリ : 0 . 8 ~ 3 . 00 kV、コーン範囲 : 25、ソース温度 : 120 ~ 150、脱溶剤温度 : 500 ~ 600、コーンガス流 : 50 L / h、脱溶剤ガス流 : 1000 L / h、質量範囲 : 110 ~ 850 Da) 及び Waters 製 Acquity UPLC : Quaternary solvent manage、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード - アレイ検出器を備える Waters 製の質量分光計 (SQD2 又は QDA シングル四重極質量分光計) で記録した。カラム : Acquity 製 UPLC HSS T3 C18、1 . 8 μm 、30 $\times$ 2 . 1 mm、温度 : 40、DAD 波長範囲 (nm) : 200 ~ 400、溶剤勾配 : A = 水 + 5 % アセトニトリル + 0 . 1 % HCOOH 、B = アセトニトリル + 0 . 05 % HCOOH ; 勾配 : 0 分、10 % B ; 0 . ~ 0 . 2 分 10 % から 50 % B ; 0 . 2 ~ 0 . 6 分、50 % から 100 % B ; 0 . 6 ~ 1 . 3 分 100 % B ; 1 . 3 ~ 1 . 4 分、100 % から 10 % B ; 1 . 4 ~ 1 . 6 分、10 % B ; 流量 (ml / min) 0 . 6。

40

【0300】

方法 2 :

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性 : 陽イオン又は陰イオン、MS2 Scan、キャピラリ : 4 . 00 kV、フラグメンタ : 100 V、脱溶剤温度 : 350、

50

ガス流：11 L/min、ネブライザガス：45 psi、質量範囲：110～1000 Da) 及び Agilent 製の 1200 Series HPLC：クォータナリーポンプ、被加熱カラムコンパートメント及び VWD 検出器を備える Agilent Technologies 製の質量分光計 (6410 トリプル四重極型質量分析計) で記録した。カラム：KINETEX EVO C18、2.6 µm、50×4.6 mm、温度：40、検出器 VWD 波長：254 nm、溶剤勾配：A = 水 + 5% アセトニトリル + 0.1% HCl(O)OH、B = アセトニトリル + 0.1% HCl(O)OH：勾配：0 分間 10% B、90% A；0.9～1.8 分間 100% B；1.8～2.2 分間 100～10% B；2.2～2.5 分間 10% B；流量 (mL/min) 1.8。

【0301】

10

方法 3：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン又は陰イオン、MS2 Scan、キャピラリ：3.5 kV、フラグメンタ：110 V、脱溶剤温度：325、ガス流：13 L/min、ネブライザガス：55 psi、質量範囲：110～850 Da) 及び Agilent 製の 1290 Series HPLC：クォータナリーポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器を備える Agilent Technologies 製質量分光計 (MSD-IQ 質量分光計) で記録した。カラム：AGILENT POROSHELL 120 EC-C18、1.9 µm、50×2.1 mm、温度：40、DAD 波長範囲 (nm)：190～400、溶剤勾配：A = 水 + 5% アセトニトリル + 0.1% HCl(O)OH、B = アセトニトリル + 0.1% HCl(O)OH：勾配：0～0.5 分間 10% B、90% A；1.2～1.5 分間 95% B、05% A；1.8～2.5 分間 10% B、90% A；流量 (mL/min) 0.8。

20

【0302】

方法 4：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン及び陰イオン)、キャピラリ：0.8～3.0 kV、コーン：5～30 V、ソース温度：120～150、脱溶剤温度：350～600、コーンガス流：50～150 L/h、脱溶剤ガス流：650～1000 L/h、質量範囲：110～950 Da 及び Waters Corporation 製の Acquity UPLC：バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント、ダイオード-アレイ検出器及び ELS-D を備える Waters Corporation 製の質量分光計 (SQD、SQD II 又は QDA シングル四重極型質量分光計) で記録した。カラム：Waters 製 UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60、DAD 波長範囲 (nm)：210～400、ランタイム：1.5 分間；溶剤：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCl(O)OH、B = アセトニトリル + 0.05% HCl(O)OH；流量 (mL/min) 0.85、勾配：0.2 分間 10% B で定組成、次いで 1.0 分間で 10～100% B、0.2 分間 100% B で定組成、0.05 分間で 100～10% B、0.05 分間 10% B で定組成。

30

【0303】

方法 5：

スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン又は陰イオン、キャピラリ：3.0 kV、コーン：30 V、抽出器：3.00 V、ソース温度：150、脱溶剤温度：400、コーンガス流：60 L/hr、脱溶剤ガス流：700 L/hr、質量範囲：140～800 Da) 及び Waters Corporation 製の ACQUITY UPLC (溶剤デガッサ、バイナリポンプ、被加熱カラムコンパートメント及びダイオード-アレイ検出器を有する) を備える Waters Corporation 製の ACQUITY 質量分光計 (QDa 又は SQD II シングル四重極型質量分光計) で記録した。カラム：Waters 製の UPLC HSS T3、1.8 µm、30×2.1 mm、温度：60、DAD 波長範囲 (nm)：210～400、溶剤勾配：A = 水/メタノール 9：1 + 0.1% ギ酸、B = アセトニトリル + 0.1% ギ酸、勾配：3.0 分間で 0～100% B；流量 (mL/min) 0.75。

40

50

【 0 3 0 4 】

配合例

【 0 3 0 5 】

【 表 9 】

水和剤	a)	b)	c)	
有効成分	25 %	50 %	75 %	
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	—	
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	—	5 %	
ナトリウムジイソブチルナフタレンスルホネート	—	6 %	10 %	10
フェノールポリエチレングリコールエーテル(7 - 8 mol のエチレンオキシド)	—	2 %	—	
高分散ケイ酸	5 %	10 %	10 %	
カオリン	62 %	27 %	—	

【 0 3 0 6 】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、水で希釈して所望の濃度の懸濁液を得ることができる水和剤を得る。

【 0 3 0 7 】

【 表 1 0 】

乾燥種子処理に係る粉末	a)	b)	c)	
有効成分	25 %	50 %	75 %	
軽油	5 %	5 %	5 %	
高分散ケイ酸	5 %	5 %	—	
カオリン	65 %	40 %	—	
タルカム	—	—	20 %	

20

【 0 3 0 8 】

複合物を補助剤と十分に混合し、混合物を好適なミルで十分に粉砕して、種子処理に直接用いることが可能である粉末を得る。

30

【 0 3 0 9 】

乳化性濃縮物

有効成分 1 0 %

オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4 ~ 5 m o l のエチレンオキシド) 3 %

ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 3 %

ヒマシ油ポリグリコールエーテル(3 5 m o l のエチレンオキシド) 4 %

シクロヘキサノン 3 0 %

キシレン混合物 5 0 %

【 0 3 1 0 】

植物の保護に使用可能である、いずれかの必要とされる希釈度のエマルジョンは、水で希釈することによりこの濃縮物から入手することができる。

40

【 0 3 1 1 】

【表 1 1】

粉剤	a)	b)	c)
有効成分	5 %	6 %	4 %
タルカム	95 %	-	-
カオリン	-	94 %	-
無機充填材	-	-	96 %

【0 3 1 2】

10

直ちに使用可能な粉剤は、複合物をキャリアと混合し、この混合物を好適なミル内で粉碎することにより得られる。このような粉末は、種子の乾燥粉衣にも用いられ得る。

【0 3 1 3】

押出し顆粒

有効成分 1 5 %

リグノスルホン酸ナトリウム 2 %

カルボキシメチルセルロース 1 %

カオリン 8 2 %

【0 3 1 4】

複合物を補助剤と混合及び粉碎し、この混合物を水で湿らせる。混合物を押し出し、次いで空気流中で乾燥させる。 20

【0 3 1 5】

被覆顆粒

有効成分 8 %

ポリエチレングリコール (m o l . w t . 2 0 0) 3 %

カオリン 8 9 %

【0 3 1 6】

ミキサ内において、微細に粉碎した複合物を、ポリエチレングリコールで湿らせたカオリンに均一に適用する。粉塵を発生させないコーティングされた顆粒がこれにより得られる。 30

【0 3 1 7】

懸濁液濃縮物

有効成分 4 0 %

プロピレングリコール 1 0 %

ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル (1 5 m o l のエチレンオキシド) 6 %

リグノスルホン酸ナトリウム 1 0 %

カルボキシメチルセルロース 1 %

シリコン油 (7 5 % 水中のエマルジョンの形態) 1 %

水 3 2 %

40

【0 3 1 8】

微細に粉碎した複合物を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、水で希釈することにより、いずれかの所望の希釈度の懸濁液を得ることができる。このような希釈を用いて、生存している植物並びに植物繁殖材料を、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生に対して処理及び保護することが可能である。

【0 3 1 9】

種子処理用フロアブル濃縮物

有効成分 4 0 %

プロピレングリコール 5 %

コポリマーブタノール P O / E O 2 %

50

トリスチレンフェノール + 10 ~ 20 モル E O 2 %
 1, 2 - ベンズイソチアゾリン - 3 - オン (20 % 水溶液の形態) 0 . 5 %
 モノアゾ顔料カルシウム塩 5 %
 シリコン油 (75 % 水中エマルジョンの形態) 0 . 2 %
 水 45 . 3 %

【 0 3 2 0 】

微細に粉碎した複合物を補助剤と完全に混合して懸濁液濃縮物を得、これから、水で希釈することにより、いずれかの所望の希釈度の懸濁液を得ることができる。このような希釈を用いて、生存している植物並びに植物繁殖材料を、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生に対して処理及び保護することが可能である。

10

【 0 3 2 1 】

緩効性カプセル懸濁液

28部の複合物を2部の芳香族溶剤及び7部のトルエンジイソシアネート/ポリメチレン-ポリフェニルイソシアネート混合物(8:1)と混合する。この混合物を、1.2部のポリビニルアルコール、0.05部の脱泡剤及び51.6部の水の混合物中において、所望の粒径が達成されるまで乳化する。このエマルジョンに5.3部の水中の2.8部の1,6-ジアミノヘキサンの混合物を添加する。混合物を重合反応が完了するまで攪拌する。得られるカプセル懸濁液を、0.25部の増粘剤及び3部の分散剤を添加することにより安定化させる。カプセル懸濁液配合物は、28%の有効成分を含有する。中型カプセルの直径は、8~15ミクロンである。得られる配合物を、この目的に好適である装置で水性懸濁液として種子に適用する。

20

【 0 3 2 2 】

配合タイプとしては、エマルジョン濃縮物(E C)、懸濁液濃縮物(S C)、サスポエマルジョン(S E)、カプセル懸濁液(C S)、水分散性顆粒(W G)、乳化性顆粒(E G)、エマルジョン、油中水型(E O)、エマルジョン、水中油型(E W)、マイクロエマルジョン(M E)、油分散体(O D)、油混和性フロアブル(O F)、油混和性液体(O L)、可溶性濃縮物(S L)、超低体積懸濁液(S U)、超低体積液体(U L)、工業用濃縮物(T K)、分散性濃縮物(D C)、水和剤(W P)、可溶性顆粒(S G)又はいずれかの技術的に好ましい配合物が挙げられる。

30

【 0 3 2 3 】

略語

C D C l₃ 重水素化クロロホルム
 D M F ジメチルホルムアミド
 D M S O ジメチルスルホキシド
 D M S O - d₆ 重水素化ジメチルスルホキシド
 E t O A c 酢酸エチル
 H C l 塩酸
 h r 時間/時間
 i P r イソプロピル
 L C M S 液体クロマトグラフィ質量分光測定
 r h 相対湿度
 r t 室温
 R t 保持時間
 T B M E メチル t e r t - ブチルエーテル又は t e r t - ブチルメチルエーテル
 T H F テトラヒドロフラン

40

【 0 3 2 4 】

調製例:

「 M p 」は、融点()を意味する。フリーラジカルは、メチル基を表す。

【 0 3 2 5 】

¹H NMR 及び ¹⁹F NMR 計測値は、B r u k e r 400 M H z 分光計で記録し、

50

化学シフトは、TMS (^1H) 又は CFCl_3 (^{19}F) 標準を基準として ppm で記載されている。スペクトルは、記載のとおり重溶媒中で計測した。

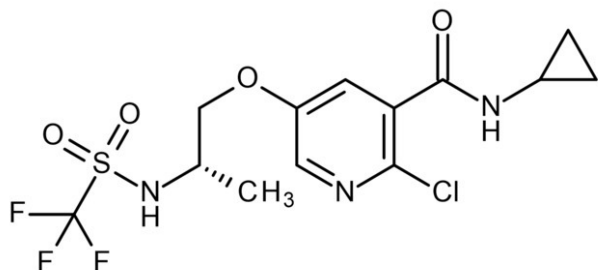
【0326】

以下の LCMS 方法の 1 つを用いて化合物を特徴付けした。各化合物について得た特徴的な LCMS 値は、保持時間 (「Rt」、分単位で記録) 及び実測分子イオン ($\text{M} + \text{H}^+$ 又は ($\text{M} - \text{H}$) であった。

【0327】

実施例 P 1 : 2 - クロロ - N - シクロプロピル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 3 - カルボキサミド (化合物 P - 1、表 P) の調製

【化 5 8】



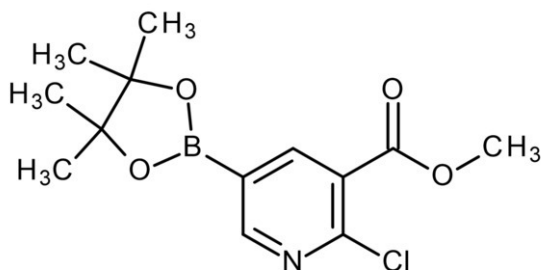
10

20

(化合物 P - 1、表 P)

ステップ A : メチル 2 - クロロ - 5 - (4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン - 2 - イル) ピリジン - 3 - カルボキシレートの調製

【化 5 9】



30

メチル 5 - ブロモ - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレート (15.0 g、59.9 mmol)、ビス (ピナコラト) (23.0 g、89.8 mmol、1.50 当量) 及び炭酸カリウム (20.8 g、209 mmol、3.50 当量) の無水 2 - メチルテトラヒドロフラン (900 mL) 中の溶液をアルゴンで 20 分間脱気した。次いで、1,1'-ビス (ジフェニルホスフィノ) フェロセンジクロロパラジウム (II) (2.21 g、2.99 mmol、0.050 当量) を添加し、反応混合物を 60 で一晩撹拌した。室温に冷却した後、反応混合物を水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して粗メチル 2 - クロロ - 5 - (4, 4, 5, 5 - テトラメチル - 1, 3, 2 - ジオキサボロラン - 2 - イル) ピリジン - 3 - カルボキシレートを得、これをそのまま次のステップで用いた。

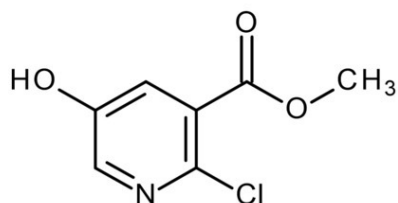
40

【0328】

ステップ B : メチル 2 - クロロ - 5 - ヒドロキシ - ピリジン - 3 - カルボキシレートの調製

50

【化 6 0】

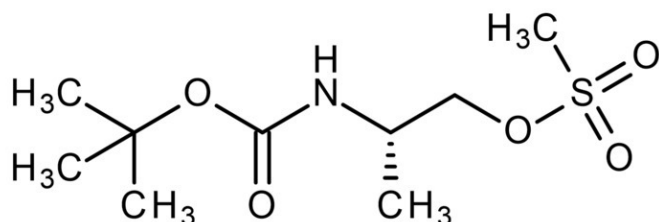


粗メチル 2 - クロロ - 5 - (4 , 4 , 5 , 5 - テトラメチル - 1 , 3 , 2 - ジオキサボ
 ロラン - 2 - イル) ピリジン - 3 - カルボキシレート (39 . 0 g 、 131 mmol) の 10
 エタノール (655 mL) 中の溶液に室温で過酸化水素 (水中に 30 % 、 44 . 6 mL 、
 393 mmol 、 3 . 00 当量) を添加した。反応混合物を室温で一晩撹拌した。次いで
 、これを酢酸エチルで希釈し、Quantofix 片を用いて過酸化物が存在しなくなる
 までメタ重亜硫酸ナトリウム飽和水溶液で失活させた。水に希釈した後、2 つの層を分離
 し、水性層をさらなる量の酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウム
 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。カラムクロマトグラフィによる粗生成物の 1 回
 目の精製及び逆相カラムクロマトグラフィによる 2 回目の精製でメチル 2 - クロロ - 5 -
 ヒドロキシ - ピリジン - 3 - カルボキシレートを得た。LC - MS (方法 1) : 保持時間
 0 . 36 分間、 m/z 187 . 9 [$M + H^+$] ; 1H NMR (400 MHz , DMSO
 - d_6) δ ppm : 9 . 22 - 12 . 17 (m , 1 H) 8 . 10 (d , 1 H) 7 . 58 20
 (d , 1 H) 3 . 86 (s , 3 H)

【 0 3 2 9 】

ステップ C : [(2 S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロピル] メタ
 ンスルホン酸の調製

【化 6 1】

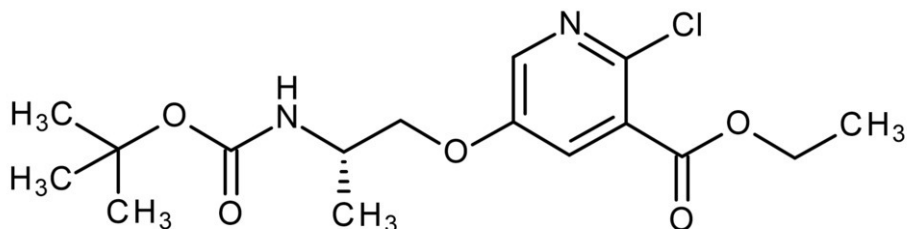


tert - ブチル N - [(1 S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチル] カルバメー
 ト (5 . 00 g 、 28 . 5 mmol) のテトラヒドロフラン (100 mL) 中の溶液に 0
 でトリエチルアミン (5 . 97 mL 、 42 . 8 mmol 、 1 . 50 当量) 、続いてメタ
 ンスルホンクロリド (2 . 49 mL 、 31 . 4 mmol 、 1 . 10 当量) を添加した。
 反応混合物を室温で 2 . 5 時間撹拌した。次いで、これを酢酸エチルで希釈し、重炭酸ナ
 トリウム飽和溶液で失活させた。水性層をさらなる量の酢酸エチルで抽出した。組み合わ
 せた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して粗 [(2 S) - 2 - 40
 (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロピル] メタンスルホン酸を得、これをその
 まま次のステップで用いた。 1H NMR (400 MHz , $CDCl_3$) δ ppm : 4 .
 58 - 4 . 74 (m , 1 H) 4 . 22 (br s , 1 H) 4 . 12 - 4 . 19 (m , 1 H)
) 3 . 98 (br s , 1 H) 3 . 04 (s , 3 H) 1 . 45 (s , 9 H) 1 . 24 (d
 , 3 H)

【 0 3 3 0 】

ステップ D : メチル 5 - [(2 S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロ
 ボキシ] - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレートの調製

【化 6 2】

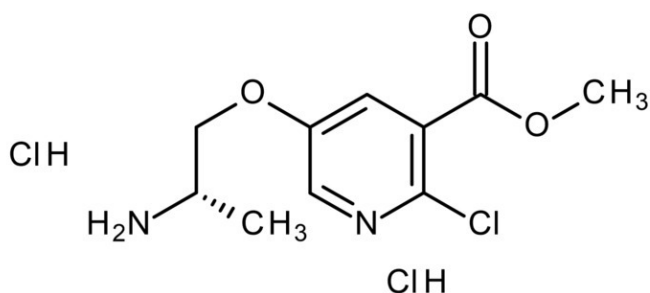


メチル 2 - クロロ - 5 - ヒドロキシ - ピリジン - 3 - カルボキシレート (1 . 7 0 g 、 9 . 1 0 m m o l) 及び [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロピル] メタンスルホン酸 (2 . 5 0 g 、 1 0 . 0 m m o l 、 1 . 1 0 当量) の N , N - ジメチルホルムアミド (3 4 m L) 中の溶液に室温で炭酸セシウム (3 . 5 0 g 、 1 8 . 0 m m o l 、 2 . 0 0 当量) を添加した。反応混合物を 6 0 ° で一晩撹拌した。室温に冷却した後、反応混合物を水で希釈し、エチルで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。カラムクロマトグラフィによる粗生成物の精製でメチル 5 - [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレートを得た。LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 4 5 分間、 m/z 288 . 9 [$M + H^+ - tBu$] ; 1H NMR (400 MHz , $CDCl_3$) δ ppm : 8 . 21 (d , 1 H) 7 . 70 (d , 1 H) 4 . 69 (br s , 1 H) 4 . 05 - 4 . 14 (m , 1 H) 3 . 99 - 4 . 03 (m , 2 H) 3 . 95 (s , 3 H) 1 . 45 (s , 9 H) 1 . 30 (d , 3 H)

【 0 3 3 1 】

ステップ E : メチル 5 - [(2 S) - 2 - アミノプロポキシ] - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレート二塩化水素化物の調製

【化 6 3】

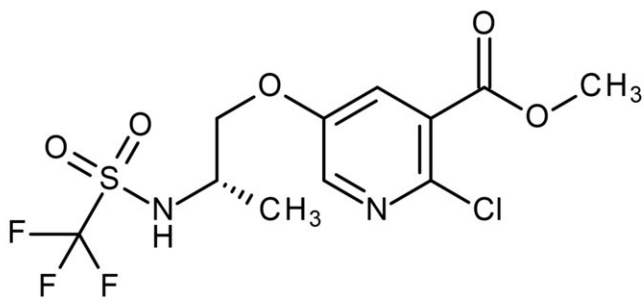


メチル 5 - [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレート (2 . 0 0 g 、 5 . 8 0 m m o l) の 1 , 4 - ジオキサン (8 m L) 中の溶液に 0 ° で塩化水素 (1 , 4 - ジオキサン中に 4 M 、 2 2 m L) を滴下した。反応混合物を室温で一晩撹拌した。次いで、これを減圧下で濃縮して、粗メチル 5 - [(2 S) - 2 - アミノプロポキシ] - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレート二塩化水素化物を得、これをそのまま次のステップで用いた。LC - MS (方法 1) : 保持時間 0 . 3 2 分間、 m/z 244 . 8 [$M + H^+$] ; 1H NMR (400 MHz , $DMSO-d_6$) δ ppm : 8 . 37 (d , 1 H) 8 . 27 - 8 . 34 (m , 2 H) 7 . 89 (d , 1 H) 4 . 30 (m , 1 H) 4 . 15 (m , 1 H) 3 . 89 (s , 3 H) 3 . 75 (br s , 1 H) 1 . 29 (d , 3 H)

【 0 3 3 2 】

ステップ F : メチル 2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 3 - カルボキシレートの調製

【化 6 4】



10

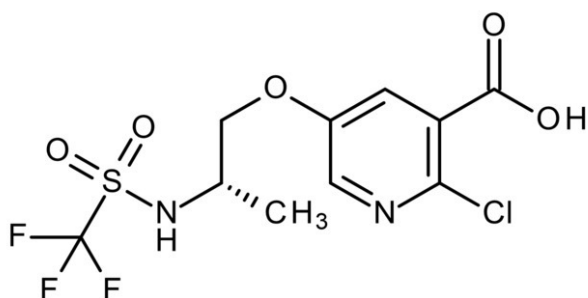
粗メチル 5 - [(2 S) - 2 - アミノプロポキシ] - 2 - クロロ - ピリジン - 3 - カルボキシレート二塩化水素化物 (1 . 5 0 g 、 4 . 7 0 m m o l) のジクロロメタン (3 0 m L) 中の溶液に 0 でトリエチルアミン (4 . 0 0 m L 、 2 8 . 0 m m o l 、 6 . 0 0 当量) 、続いてトリフルオロメタンスルホン酸無水物 (1 . 0 0 m L 、 5 . 0 0 m m o l 、 1 . 0 5 当量) を添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、これを減圧下で濃縮した。カラムクロマトグラフィによる粗生成物の精製でメチル 2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 3 - カルボキシレートを得た。LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 1 3 分間、 m/z 377 . 3 [$M + H^+$] ; 1H NMR (400 MHz , $CDCl_3$) δ ppm : 8 . 2 1 (d , 1 H) 7 . 6 9 (d , 1 H) 5 . 5 9 (b r s , 1 H) 4 . 0 8 - 4 . 2 6 (m , 2 H) 4 . 0 1 - 4 . 0 7 (m , 1 H) 3 . 9 6 - 3 . 9 9 (s , 3 H) 1 . 4 9 (d , 3 H) ; ^{19}F NMR (377 MHz , $CDCl_3$) δ ppm : - 7 7 . 7 2 (s , CF_3)

20

【 0 3 3 3 】

ステップ G : 2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 3 - カルボン酸の調製

【化 6 5】



30

メチル 2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 3 - カルボキシレート (0 . 9 0 0 g 、 2 . 3 9 m m o l) のテトラヒドロフラン (1 8 m L) 及びメタノール (3 m L) 中の溶液に室温で水酸化リチウム (0 . 1 7 1 g 、 7 . 1 7 m m o l 、 3 . 0 0 当量) の水 (6 m L) 中の溶液を添加した。反応混合物を室温で 2 時間攪拌した。次いで、これを水で希釈し、次いでクエン酸溶液で酸性化し、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。得られたガムの n - ペンタンによる洗浄で 2 - クロロ - 5 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 3 - カルボン酸を得た。LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 3 1 分間、 m/z 362 . 8 [$M + H^+$] ; 1H NMR (400 MHz , $DMSO-d_6$) δ ppm : 1 3 . 9 6 - 1 4 . 6 2 (m , 1 H) 9 . 9 7 - 1 0 . 2 7 (m , 1 H) 8 . 6 8 (d , 1 H) 8 . 2 0 (d , 1 H) 4 . 5 8 (m , 1 H) 4 . 3 9 - 4 . 4 8 (m , 1 H) 4 . 2 5 - 4 . 3 6 (m , 1 H) 1 . 6 7 (d , 3 H) ; ^{19}F NMR (377 MHz , $DMSO-d_6$)

40

50

) δ ppm: -77.68 (s, CF₃)

【0334】

ステップH: 2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド(化合物P-1、表P)の調製

シクロプロパンアミン(0.0463 mL、0.662 mmol、1.20当量)、トリエチルアミン(0.386 mL、2.76 mmol、5.00当量)及び1-プロパンホスホン酸無水物(酢酸エチル中に50質量%、0.975 mL、1.65 mmol、3.00当量)の酢酸エチル(3 mL)中の溶液を室温で2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボン酸(0.200 g、0.551 mmol)の溶液に添加した。反応混合物を室温で一晩攪拌した。次いで、これを水で希釈し、酢酸エチルで抽出した。組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。カラムクロマトグラフィによる粗生成物の精製で2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミドを得た。

10

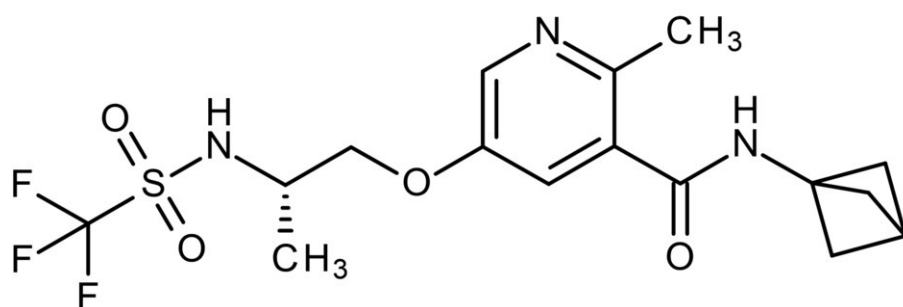
LC-MS(方法1): 保持時間1.03分間、 m/z 402.3 [M+H⁺]; ¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.09(d, 1H) 7.57(d, 1H) 6.82(br s, 1H) 6.20(br d, 1H) 4.04-4.15(m, 2H) 3.90-4.05(m, 1H) 2.94(m, 1H) 1.46(d, 3H) 0.87-1.02(m, 2H) 0.64-0.77(m, 2H); ¹⁹F NMR(377 MHz, CDCl₃) δ ppm: -77.74(s, CF₃)

20

【0335】

実施例P2: N-(1-ビスクロ[1.1.1]ペントニル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド(化合物P-5、表P)の調製

【化66】



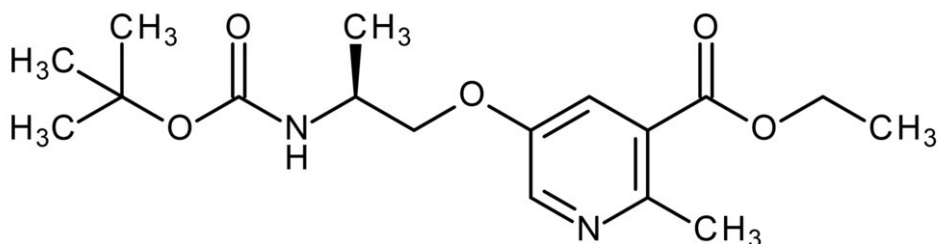
30

(化合物P-5、表P)

ステップA: エチル5-[(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)プロポキシ]-2-メチル-ピリジン-3-カルボキシレートの調製

【化67】

40



エチル5-ヒドロキシ-2-メチル-ピリジン-3-カルボキシレート(11.5 g、63.5 mmol、1.00当量)及び[(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニ

50

ルアミノ)プロピル]メタンスルホン酸(3.35 g、14.0 mmol、2.2当量)のアセトニトリル(173 mL、15 mL/g)中の溶液に炭酸セシウム(57.57 g、298.4 mmol、4.70当量)を添加した。反応混合物を60 で16時間撹拌した。

【0336】

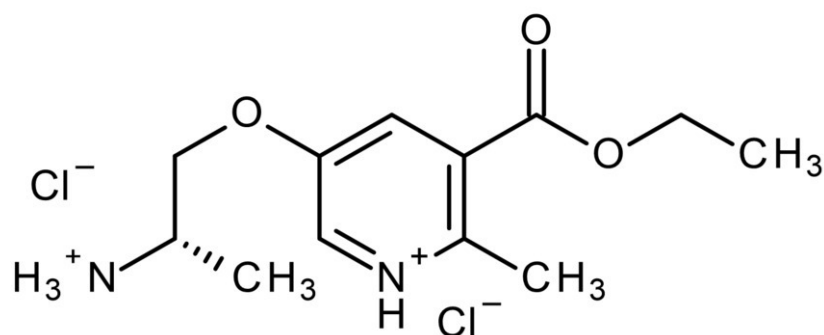
反応混合物を水で失活させ、EtOAcで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(シクロヘキサン/EtOAc)により精製して、エチル5-[(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)プロポキシ]-2-メチル-ピリジン-3-カルボキシレートを得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.26 - 1.37 (m, 3H) 1.41 - 1.49 (m, 12H) 2.77 (s, 3H) 4.01 (d, $J = 4.13$ Hz, 2H) 4.06 - 4.16 (m, 1H) 4.40 (d, $J = 7.13$ Hz, 2H) 4.61 - 4.88 (m, 1H) 7.73 (d, $J = 2.88$ Hz, 1H) 8.34 (d, $J = 3.00$ Hz, 1H)

【0337】

ステップB: [(1S)-2-(5-エトキシカルボニル-6-メチル-ピリジン-1-イウム-3-イル)オキシ-1-メチル-エチル]アンモニウムジクロリドの調製

【化68】



エチル5-[(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)プロポキシ]-2-メチル-ピリジン-3-カルボキシレート(10.5 g、31.0 mmol、1.00当量)のEtOAc(5 mL/g)中の氷冷した溶液にEtOAc(52.5 mL、210 mmol、6.77当量)中の塩酸(4 mol/L)を滴下した。反応混合物をrtで16時間撹拌した。次いで、反応混合物を減圧下で濃縮して、[(1S)-2-(5-エトキシカルボニル-6-メチル-ピリジン-1-イウム-3-イル)オキシ-1-メチル-エチル]アンモニウムジクロリドをオフホワイトの固体として得た。

^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1.29 - 1.38 (m, 6H) 2.76 (s, 3H) 4.24 (br d, $J = 7.13$ Hz, 2H) 4.32 - 4.42 (m, 3H) 8.07 (d, $J = 2.88$ Hz, 1H) 8.46 (br s, 3H) 8.58 (d, $J = 2.88$ Hz, 1H)

【0338】

ステップC: エチル2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキシレートの調製

10

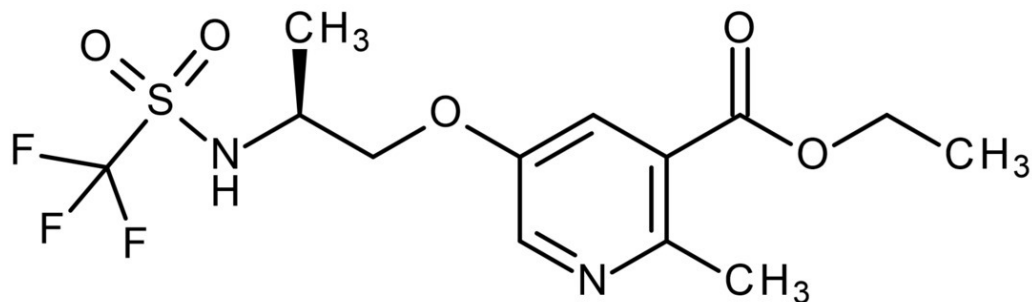
20

30

40

50

【化 6 9】



10

〔(1S)-2-(5-エトキシカルボニル-6-メチル-ピリジン-1-イウム-3-イル)オキシ-1-メチル-エチル〕アンモニウムジクロリド(8.5g、27mmol、1.00当量)及びトリエチルアミン(23mL、160mmol、6.00当量)のアセトニトリル(170mL、20mL/g)中の氷冷した溶液にトリフルオロメチルスルホニルトリフルオロメタンスルホネート(5.5mL、33mmol、1.20当量)を添加した。反応混合物をrtに戻し、16時間撹拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ(シクロヘキサン/EtOAc)により精製して、エチル2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキシレートを得た。

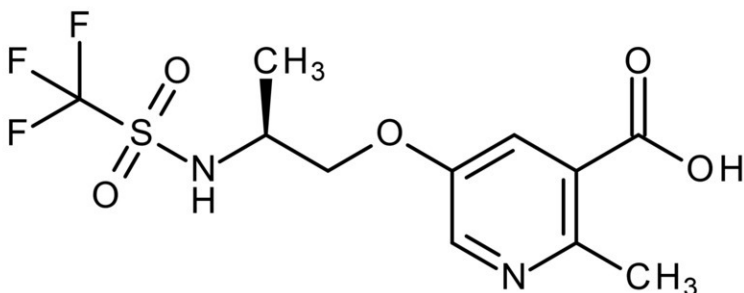
20

^1H NMR (400MHz, CDCl_3) δ ppm: 1.41 - 1.52 (m, 6H) 2.78 (s, 3H) 3.99 - 4.08 (m, 1H) 4.09 - 4.20 (m, 2H) 4.41 (q, $J = 7.13$ Hz, 2H) 6.54 (br d, $J = 7.00$ Hz, 1H) 7.71 (d, $J = 3.00$ Hz, 1H) 8.35 (d, $J = 3.00$ Hz, 1H)

【0339】

ステップD: 2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボン酸の調製

【化 7 0】



30

エチル2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキシレート(3.8g、10mmol、1.00当量)のエタノール(51mL、5mL/mmol)中の溶液に H_2O (51mL、100mmol、10当量)中の水酸化ナトリウム(1mol/L)を添加した。反応混合物をrtで2時間撹拌した。水及びクエン酸を添加し、反応混合物をEtOAcで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。得られた固体をペンタンで洗浄し、ろ出して2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボン酸を得た。

40

^1H NMR (400MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 1.27 (d, $J = 6.75$ Hz, 3H) 2.64 (s, 3H) 3.81 - 3.93 (m, 1H) 3.98 (dd, $J = 9.94, 7.69$ Hz, 1H) 4.12 (dd, $J = 10.07, 4.19$ Hz, 1H) 7.70 (d, $J = 2.88$ Hz, 1H) 8.33 (d, $J = 2.88$ Hz, 1H)

50

) 9.63 (br d, $J = 8.13$ Hz, 1H) 12.60 - 14.19 (m, 1H)
【0340】

ステップ E: N - (1 - ビシクロ[1.1.1]ペンタニル) - 2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド (化合物 P - 5、表 P) の調製

2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボン酸 (0.014 g、0.040 mmol、1.00 当量)、
ビシクロ[1.1.1]ペンタン - 1 - アミン (0.007 g、0.060 mmol、1.50 当量)、N - エチル - N - イソプロピル - プロパン - 2 - アミン (0.042 mL、0.240 mmol、6.00 当量) を N, N - ジメチルアセタミド (0.90 mL) 中に溶解し、混合物を 5 分間アルゴン流でパージした。反応混合物を 60 に 3 時間かけて加熱した。混合物を冷却し、減圧下で濃縮し、粗残渣をジメチルアセタミド/メタノール (3:1) 中に溶解し、逆相分取 HPLC で精製して N - (1 - ビシクロ[1.1.1]ペンタニル) - 2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミドを得た。

10

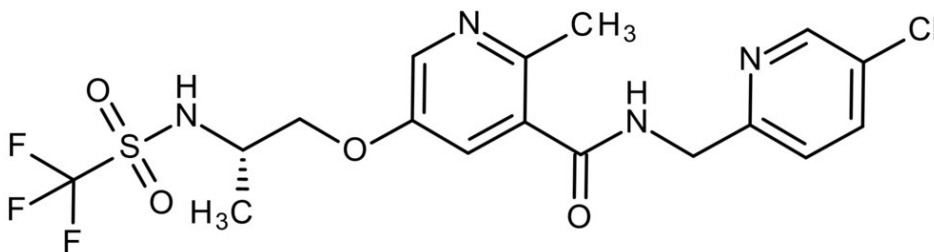
LC - MS (方法 5): 保持時間 1.22 分間、 m/z 408.4 [M + H]

【0341】

実施例 P 3: N - [(5 - クロロ - 2 - ピリジル)メチル] - 2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド (化合物 P - 28、表) の調製

20

【化 71】



30

(化合物 P - 28、表)

ステップ A: N - [(5 - クロロ - 2 - ピリジル)メチル] - 2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミド (化合物 P - 28、表 P) の調製

2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボン酸 (0.014 g、0.040 mmol、1.00 当量)、
(5 - クロロ - 2 - ピリジル)メタンアミン (0.0086 g、0.060 mmol、1.50 当量)、N - エチル - N - イソプロピル - プロパン - 2 - アミン (0.0415 mL、0.240 mmol、6.00 当量) を N, N - ジメチルアセタミド (0.90 mL) 中に溶解し、混合物を 5 分間アルゴン流でパージした。反応混合物を 60 に 3 時間かけて加熱した。混合物を冷却し、減圧下で濃縮し、粗残渣をジメチルアセタミド/メタノール (3:1) 中に溶解し、逆相分取 HPLC で精製して、N - [(5 - クロロ - 2 - ピリジル)メチル] - 2 - メチル - 5 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 3 - カルボキサミドを得た。

40

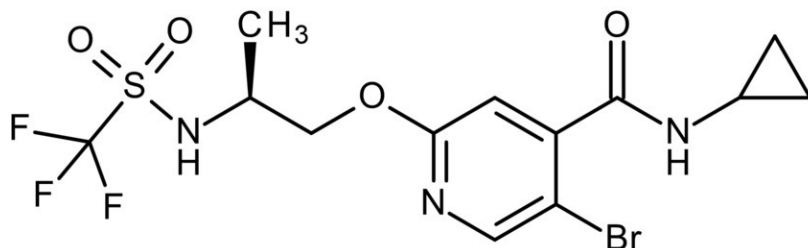
LC - MS (方法 5): 保持時間 1.21 分間、 m/z 467.4 [M + H]

【0342】

実施例 P 4: 5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P - 83、表 P) の調製

50

【化 7 2】

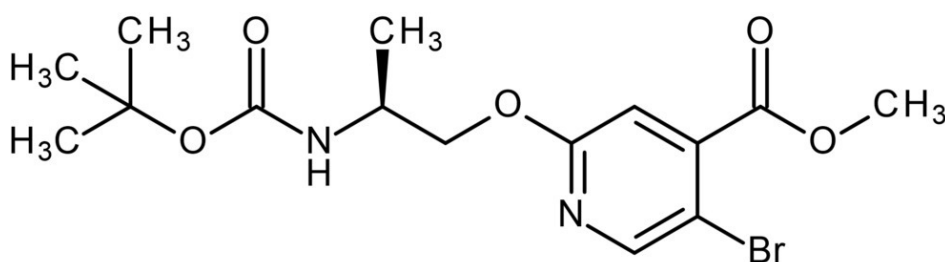


10

(化合物 P - 83、表 P)

ステップ A：メチル 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレートの調製

【化 7 3】



20

メチル 5 - ブロモ - 2 - ヒドロキシ - ピリジン - 4 - カルボキシレート (10 . 8 g、46 . 5 mmol、1 . 00 当量) 及び [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロピル] メタンスルホン酸 (17 . 7 g、69 . 8 mmol、1 . 50 当量) のジメチルホルムアミド (582 mL、12 , 5 mL / mmol) 中の溶液に炭酸カリウム (19 . 5 g、140 mmol、3 . 00 当量) を添加した。反応混合物を 60 で 16 時間撹拌した。次いで、反応混合物を r t に冷却し、水で希釈し、E t O A c で抽出した。組み合わせた有機層を水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。反応混合物を減圧下で濃縮し、粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c) により精製して、メチル 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレートを明るい黄色味があった粘性の液体として得た。

30

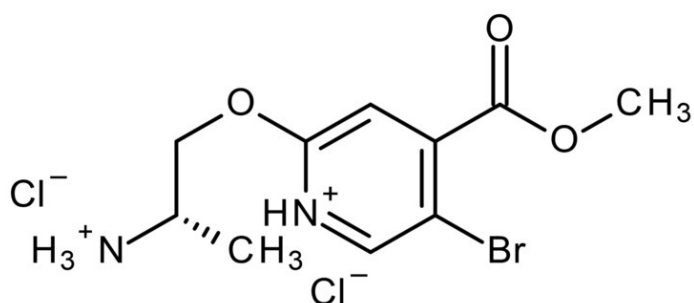
¹H NMR (400 MHz , C D C l₃) δ ppm 1 . 19 - 1 . 28 (m , 3 H) 1 . 43 (s , 9 H) 3 . 94 (s , 3 H) 3 . 99 - 4 . 17 (m , 1 H) 4 . 25 (d , 2 H) 4 . 73 (b r s , 1 H) 7 . 11 (s , 1 H) 8 . 32 (s , 1 H) 。

【 0 3 4 3 】

ステップ B：[(1 S) - 2 - (5 - ブロモ - 4 - メトキシカルボニル - ピリジン - 1 - イウム - 2 - イル) オキシ - 1 - メチル - エチル] アンモニウム ; ジクロリドの調製

40

【化 7 4】



50

メチル 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (t e r t - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレート (9 . 9 g 、 2 5 m m o l 、 1 . 0 0 当量) の E t O A c (4 1 m L 4 . 1 m L / g) 中の氷冷した溶液に E t O A c (1 1 0 m L 、 4 4 0 m m o l 、 1 7 当量) 中の塩酸 (4 m o l / L) を添加した。反応混合物を r t で 1 6 時間撹拌した。次いで、反応混合物を減圧下で濃縮し、残渣を t e r t - ブチルメチルエーテルで洗浄し、ろ過し、減圧下で乾燥させて、[(1 S) - 2 - (5 - ブロモ - 4 - メトキシカルボニル - ピリジン - 1 - イウム - 2 - イル) オキシ - 1 - メチル - エチル] アンモニウム ; ジクロリドを白色の固体として得た。

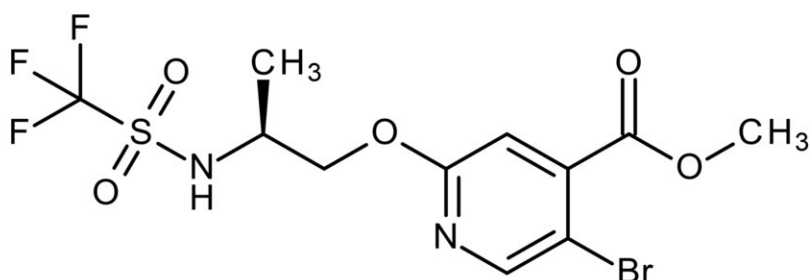
^1H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) δ p p m 1 . 2 8 (d , 3 H) 3 . 5 9 (m , 1 H) 3 . 9 0 (s , 3 H) 4 . 3 1 (m , 1 H) 4 . 3 9 - 4 . 4 7 (m , 1 H) 7 . 2 1 (s , 1 H) 8 . 0 5 - 8 . 4 3 (m , 3 H) 8 . 4 9 (s , 1 H) 。

10

【 0 3 4 4 】

ステップ C : メチル 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレートの調製

【 化 7 5 】



20

[(1 S) - 2 - (5 - ブロモ - 4 - メトキシカルボニル - ピリジン - 1 - イウム - 2 - イル) オキシ - 1 - メチル - エチル] アンモニウム ; ジクロリド (4 g 、 1 1 . 0 5 m m o l 、 1 . 0 0 当量) のアセトニトリル (8 0 m L 、 2 0 m L / g) 中の氷冷した溶液にトリエチルアミン (9 . 2 9 m L 、 6 6 . 2 9 m m o l 、 6 . 0 0 当量) 、続いてトリフルオロメチルスルホニルトリフルオロメタンスルホネート (2 . 2 3 0 m L 、 1 3 . 2 7 m m o l 、 1 . 2 0 当量) を添加した。反応混合物をゆっくりと r t とし、1 6 時間撹拌した。水及びクエン酸を添加し、反応混合物を E t O A c で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。反応混合物を減圧下で濃縮し、粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c) により精製して、メチル 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレートをわずかに黄色味があった粘性の液体として得た。

30

^1H NMR (4 0 0 M H z , C D C l 3) δ p p m 1 . 3 9 (d , 3 H) 3 . 9 6 (s , 3 H) 4 . 0 1 - 4 . 1 5 (m , 1 H) 4 . 2 8 - 4 . 4 3 (m , 2 H) 5 . 9 6 (b r d , 1 H) 7 . 1 3 (s , 1 H) 8 . 3 2 (s , 1 H) 。

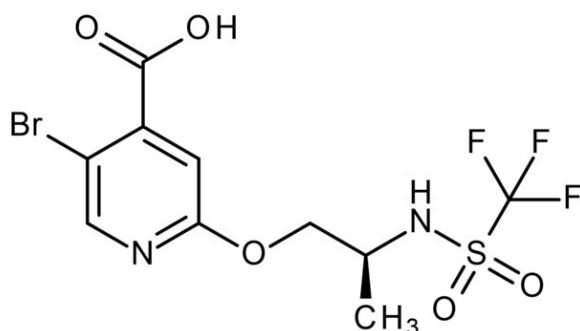
【 0 3 4 5 】

40

ステップ D : 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボン酸の調製

50

【化 7 6】



10

メチル 5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレート (2 . 5 g 、 5 . 9 m m o l 、 1 . 0 0 当量) のテトラヒドロフラン (5 0 m L) 中の溶液に水酸化リチウム水和物 (0 . 7 5 0 g 、 1 8 m m o l 、 3 . 0 0 当量) を添加した。反応混合物を r t で 2 時間撹拌した。反応混合物を減圧下で濃縮し、水及びクエン酸を添加し、反応混合物を E t O A c で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。得られた固体をペンタンで洗浄し、ろ出して、5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボン酸を得た。 ^1H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) δ p p m : 1 . 2 4 (d , 3 H) 3 . 8 1 - 3 . 9 5 (m , 1 H) 4 . 1 4 (m , 1 H) 4 . 3 2 (m , 1 H) 7 . 0 6 (s , 1 H) 8 . 4 2 (s , 1 H) 9 . 6 1 (m , 1 H) 1 3 . 7 1 - 1 4 . 6 3 (m , 1 H) 。

20

【 0 3 4 6 】

ステップ E : 5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P - 8 3 、表 P) の調製

5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボン酸 (0 . 2 0 0 g 、 0 . 4 9 m m o l 、 1 . 0 0 当量) 、シクロプロパンアミン (0 . 0 3 4 g 、 0 . 5 9 m m o l 、 1 . 2 0 当量) 及び N , N - ジエチルエタンアミン (0 . 2 5 0 g 、 2 . 4 5 6 0 m m o l 、 5 . 0 0 当量) の E t O A c (2 . 4 5 m L 、 5 m L / m m o l) 中の溶液に E t O A c (0 . 8 6 8 m L 、 1 . 4 7 m m o l 、 3 . 0 0 当量) 中の 1 - プロパンホスホン酸無水物 (5 0 質量 %) を添加した。反応混合物を r t で 1 6 時間撹拌した。反応混合物を水で希釈し、クエン酸溶液で酸性化し、E t O A c で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c) により精製した。得られた固体をペンタンで洗浄し、ろ出して、5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミドを白色の固体として得た。

30

^1H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) δ p p m : 0 . 4 7 - 0 . 6 0 (m , 2 H) 0 . 6 5 - 0 . 7 8 (m , 2 H) 1 . 2 4 (d , 3 H) 2 . 7 1 - 2 . 9 0 (m , 1 H) 3 . 8 8 (b r s , 1 H) 4 . 1 3 (m , 1 H) 4 . 2 8 (m , 1 H) 6 . 8 1 (s , 1 H) 8 . 3 4 (s , 1 H) 8 . 6 4 (d , 1 H) 9 . 6 1 (b r s , 1 H)

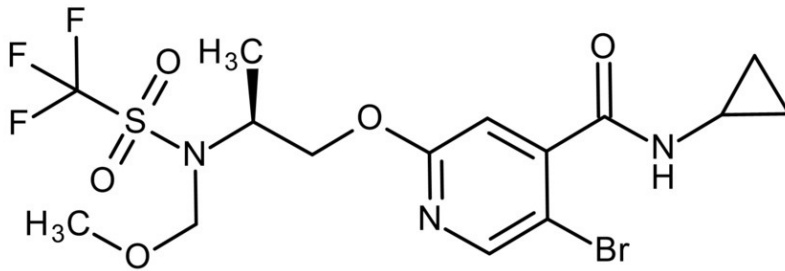
40

【 0 3 4 7 】

実施例 P 5 : 5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - [メトキシメチル (トリフルオロメチルスルホニル) アミノ] プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P - 8 1 、表 P) の調製

50

【化 7 7】

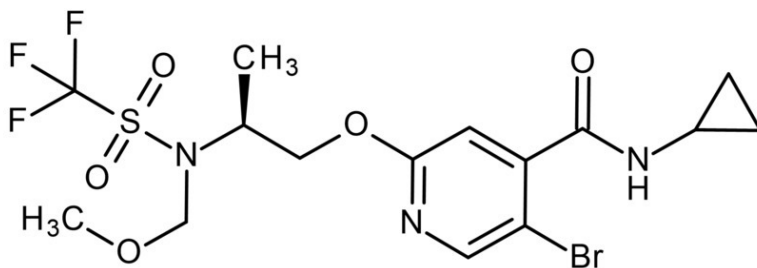


10

(化合物 P - 8 1、表 P)

ステップ A : 5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - [メトキシメチル (トリフルオロメチルスルホニル) アミノ] プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミドの調製

【化 7 8】



20

5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド (1 0 0 m g、0 , 2 2 4 1 m m o l、1 . 0 0 当量) 及びトリエチルアミン (0 . 0 9 4 m L、0 . 6 7 m m o l、3 . 0 0 当量) のアセトニトリル (2 m L、2 0 m L / g) 中の氷 - 塩凍結混合物溶液にクロロ (メトキシ) メタン (0 . 0 2 0 m L、0 . 2 6 8 m m o l、1 . 2 0 当量) を添加した。反応混合物を同じ氷 - 塩凍結混合物中で 3 時間撹拌した。反応混合物を水で希釈し、クエン酸溶液で酸性化し、E t O A c で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c) により精製して、5 - ブロモ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - [メトキシメチル (トリフルオロメチルスルホニル) アミノ] プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミドをガム状の塊として得た。

30

¹H NMR (4 0 0 M H z , C D C l ₃) δ p p m 0 . 6 0 - 0 . 7 8 (m , 2 H) 0 . 8 3 - 0 . 9 7 (m , 2 H) 1 . 4 2 (b r d , 3 H) 2 . 9 0 (m , 1 H) 3 . 4 0 (s , 3 H) 4 . 2 8 - 4 . 5 7 (m , 3 H) 4 . 8 5 (b r s , 2 H) 6 . 1 0 (b r s , 1 H) 6 . 8 9 (s , 1 H) 8 . 2 5 (s , 1 H) 。

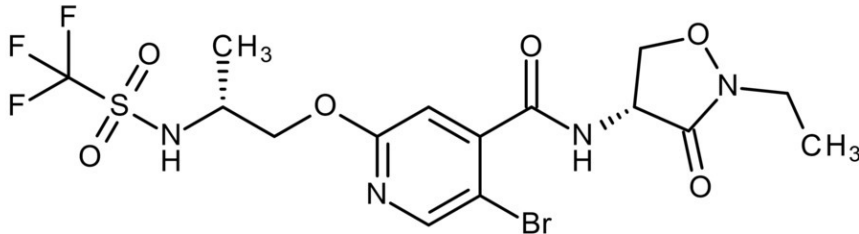
【 0 3 4 8 】

実施例 P 6 : 5 - ブロモ - N - [(4 R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4 - イル] - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P - 8 4、表 P) の調製

40

50

【化 7 9】

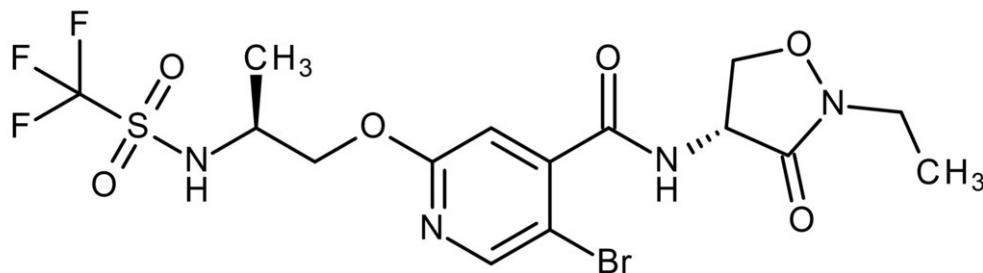


(化合物 P - 8 4、表 P)

10

ステップ A : 5 - ブロモ - N - [(4 R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4 - イル] - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミドの調製

【化 8 0】



20

5 - ブロモ - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボン酸 (0 . 2 0 0 g、0 . 4 9 m m o l、1 . 0 0 当量)、[(4 R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4 - イル] 塩化アンモニウム (0 . 0 9 8 g、0 . 5 8 9 m m o l、1 . 2 0 当量) 及び N , N - ジエチルエタンアミン (0 . 2 5 0 g、2 . 4 5 6 m m o l、5 . 0 0 当量) の E t O A c (2 . 4 5 m L、5 m L / m m o l) 中の溶液に E t O A c (0 . 8 6 8 m L、1 . 4 7 m m o l、3 . 0 0 当量) 中の 1 - プロパンホスホン酸無水物 (5 0 質量 %) を添加した。反応混合物を r t で 1 6 時間撹拌した。反応混合物を水で希釈し、クエン酸溶液で酸性化し、E t O A c で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、Na₂SO₄で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン / E t O A c) により精製した。得られた固体をペンタンで洗浄し、ろ出して、5 - ブロモ - N - [(4 R) - 2 - エチル - 3 - オキソ - イソキサゾリジン - 4 - イル] - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミドを白色の固体として得た。

30

¹H NMR (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) δ p p m : 1 . 1 5 (t , 3 H) 1 . 2 5 (d , 3 H) 3 . 5 4 (m , 2 H) 3 . 8 3 - 3 . 9 8 (m , 1 H) 4 . 0 8 (t , 1 H) 4 . 1 5 (m , 1 H) 4 . 3 1 (m , 1 H) 4 . 6 3 (t , 1 H) 4 . 9 8 (m , 1 H) 6 . 8 6 (s , 1 H) 8 . 3 9 (s , 1 H) 9 . 3 0 (d , 1 H) 9 . 6 3 (b r d , 1 H) 。

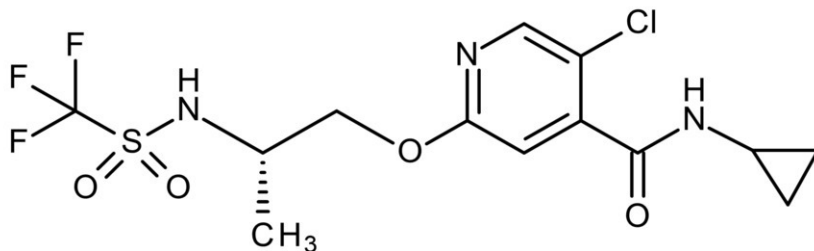
40

【 0 3 4 9】

実施例 P 7 : 5 - クロロ - N - シクロプロピル - 2 - [(2 S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキサミド (化合物 P - 8 7、表 P) の調製

50

【化 8 1】

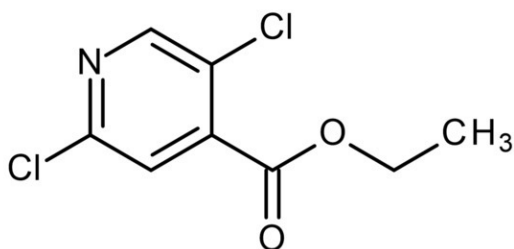


10

(化合物 P - 87、表 P)

ステップ A : エチル 2, 5 - ジクロロピリジン - 4 - カルボキシレートの調製

【化 8 2】



20

2, 5 - ジクロロピリジン - 4 - カルボン酸 (3.70 g、18.3 mmol、1.00 当量) の EtOAc (91.5 mL) 中の溶液に二塩化オキサリル (1.93 mL、22.0 mmol、1.20 当量) を添加し、次いで 1 滴の N, N - ジメチルホルムアミドを添加した。反応混合物を r t で 2 時間攪拌した。エタノール (17.8 g、21.8 mL、366 mmol) を添加し、反応混合物を r t で 30 分間攪拌した。粗混合物を減圧中で濃縮し、EtOAc で希釈し、NaHCO₃ の飽和溶液で処理した。所望の材料を EtOAc で抽出し、組み合わせた有機層を水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカートリッジ (シクロヘキサン / EtOAc) で精製して、エチル 2, 5 - ジクロロピリジン - 4 - カルボキシレートを無色の油として得た。

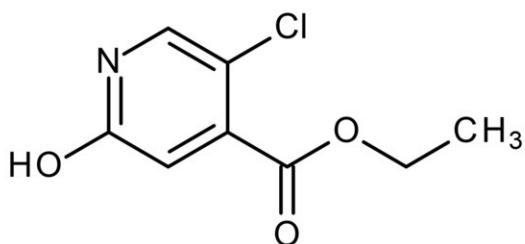
30

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm : 8.37 - 8.54 (m, 1 H) 7.69 (s, 1 H) 4.45 (q, J = 7.02 Hz, 2 H) 1.43 (t, J = 7.27 Hz, 3 H)

【0350】

ステップ B : エチル 5 - クロロ - 2 - ヒドロキシ - ピリジン - 4 - カルボキシレートの調製

【化 8 3】



40

エチル 2, 5 - ジクロロピリジン - 4 - カルボキシレート (1.0 g、4.5 mmol) の酢酸 (13 mL、220 mmol、48 当量) 中の溶液に酢酸ナトリウム (1.9 g、23 mmol、5.0 当量) を添加した。反応混合物にマイクロ波を 170 で 8 時間

50

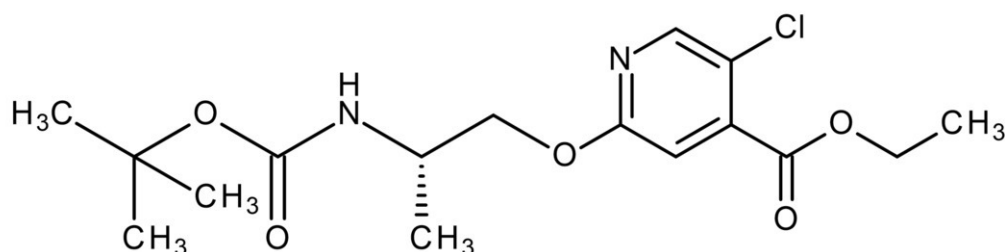
照射した。反応混合物を氷に注ぎ入れ、EtOAcで抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 で乾燥させ、ろ過し、減圧中で濃縮して、エチル 5 - クロロ - 2 - ヒドロキシ - ピリジン - 4 - カルボキシレートを手色として得た。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 7.54 (s, 1H) 6.95 (s, 1H) 4.37 - 4.49 (m, 2H) 1.41 (t, $J = 7.27$ Hz, 3H)

【0351】

ステップC: エチル 2 - [(2S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] - 5 - クロロ - ピリジン - 4 - カルボキシレートの調製

【化84】



10

エチル 5 - クロロ - 2 - ヒドロキシ - ピリジン - 4 - カルボキシレート (0.770 g、3.82 mmol、1.00 当量) 及び炭酸セシウム (2.62 g、7.64 mmol、2.00 当量) の DMF (15.3 mL) 中の溶液に [(2S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロピル] メタンスルホン酸 (1.35 g、5.35 mmol、1.40 当量) を添加した。反応混合物を 60 で 6.5 時間、次いで rt で 16 時間撹拌した。粗混合物を EtOAc で希釈し、 NaHCO_3 の飽和溶液で処理した。所望の材料を EtOAc で抽出し、組み合わせた有機層を水、塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカートリッジ (シクロヘキサン / EtOAc) で精製して、エチル 2 - [(2S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] - 5 - クロロ - ピリジン - 4 - カルボキシレートを無色の油として得た。

20

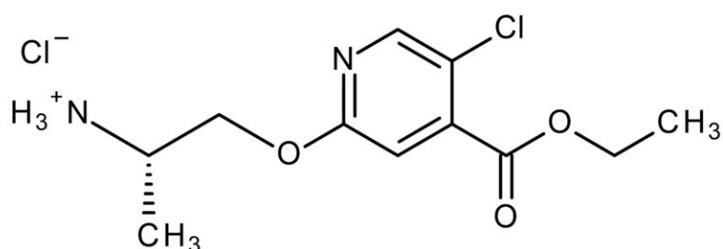
^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.20 (s, 1H) 7.12 (s, 1H) 4.71 (br s, 1H) 4.42 (q, $J = 7.27$ Hz, 2H) 4.27 (d, $J = 4.72$ Hz, 2H) 4.08 (br s, 1H) 1.45 (s, 9H) 1.41 (t, $J = 7.27$ Hz, 3H) 1.25 (d, $J = 6.90$ Hz, 3H)

30

【0352】

ステップD: [(1S) - 2 - [(5 - クロロ - 4 - エトキシカルボニル - 2 - ピリジル) オキシ] - 1 - メチル - エチル] 塩化アンモニウムの調製

【化85】



40

エチル 2 - [(2S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] - 5 - クロロ - ピリジン - 4 - カルボキシレート (0.40 g、1.10 mmol、1.0 当量) のジオキサン (0.45 mL) 中の氷冷した溶液にジオキサン (2.8 mL、11.0 mmol、10.0 当量) 中の塩化水素溶液 4.0 M を滴下した。反応混合物を rt で 16 時間撹拌した。反応混合物を減圧下で濃縮して、[(1S) - 2 - [(5 - クロロ

50

- 4 - エトキシカルボニル - 2 - ピリジル) オキシ] - 1 - メチル - エチル] 塩化アンモニウムを白色の固体として得た。

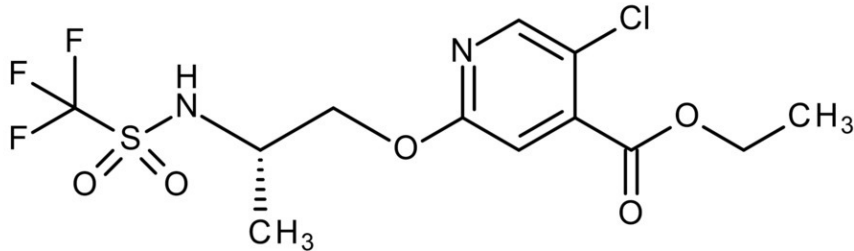
^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 8.40 (s, 1H) 8.23 (br s, 3H) 7.22 (s, 1H) 4.43 (dd, $J = 11.26, 4.36$ Hz, 1H) 4.37 (q, $J = 6.90$ Hz, 2H) 4.31 (dd, $J = 11.26, 6.90$ Hz, 1H) 3.61 (td, $J = 6.81, 4.18$ Hz, 1H) 1.33 (t, $J = 7.08$ Hz, 3H) 1.28 (d, $J = 6.54$ Hz, 3H)

【0353】

ステップE: エチル 5 - クロロ - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレートの調製

10

【化86】



20

[(1S) - 2 - [(5 - クロロ - 4 - エトキシカルボニル - 2 - ピリジル) オキシ] - 1 - メチル - エチル] 塩化アンモニウム (0.31 g、1.10 mmol、1.0 当量) のテトラヒドロフラン (5.3 mL) 中の氷冷した溶液にトリエチルアミン (0.37 g、0.51 mL、3.70 mmol、3.50 当量) を添加し、次いでトリフルオロメタンスルホン酸無水物 (0.33 g、0.19 mL、1.20 mmol、1.10 当量) をゆっくりと添加した。反応混合物を 0 で 1 時間攪拌した。反応混合物を氷 / 水に注ぎ入れ、EtOAc で抽出した。組み合わせた有機層を NaHCO₃ の飽和溶液、塩水で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカートリッジ (シクロヘキサン / EtOAc) で精製して、エチル 5 - クロロ - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレート黄色の樹脂として得た。

30

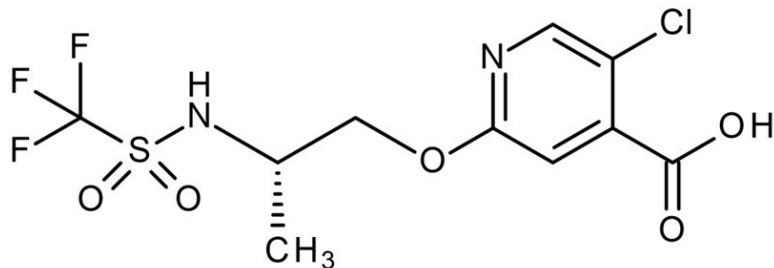
^1H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.20 (s, 1H) 7.15 (s, 1H) 5.75 (br d, $J = 8.36$ Hz, 1H) 4.43 (q, $J = 7.15$ Hz, 2H) 4.37 (t, $J = 4.72$ Hz, 2H) 4.04 - 4.12 (m, 1H) 1.40 - 1.44 (m, 6H)

【0354】

ステップF: 5 - クロロ - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボン酸の調製

【化87】

40



エチル 5 - クロロ - 2 - [(2S) - 2 - (トリフルオロメチルスルホニルアミノ) プロポキシ] ピリジン - 4 - カルボキシレート (0.040 g、0.10 mmol、1.0

50

0 当量) のテトラヒドロフラン (0.31 mL) 及び水 (0.31 mL) 中の溶液に水酸化リチウム-水和物 (0.007 g、0.15 mmol、1.50 当量) を添加した。反応混合物を rt で 6.5 時間撹拌した。反応混合物を水 / NaOH 0.5 M で希釈し、tert-ブチル-メチルエーテルで抽出した。水性層を HCl 2 M で pH 3 まで酸性化し、EtOAc で抽出した。有機層を NH₄Cl の飽和溶液で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮して、5-クロロ-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボン酸を白色の固体として得た。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.26 (s, 1H) 7.32 (s, 1H) 5.75 (br d, J = 8.36 Hz, 1H) 4.34 - 4.45 (m, 2H) 4.03 - 4.11 (m, 1H) 1.43 (d, J = 6.90 Hz, 3H) 10

【0355】

ステップ G: 5-クロロ-N-シクロプロピル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド (化合物 P-87、表 P) の調製

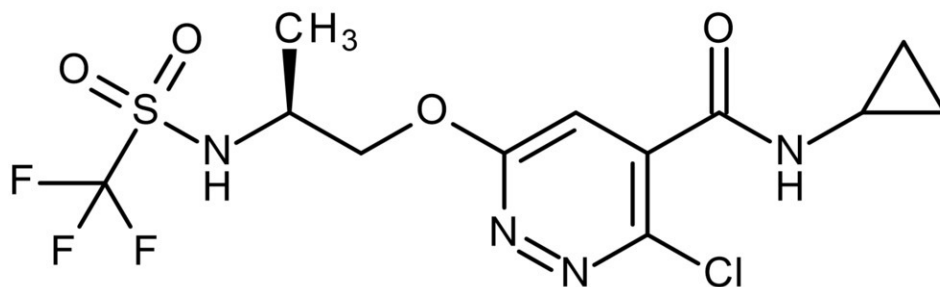
5-クロロ-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボン酸 (0.035 g、0.096 mmol、1.00 当量)、シクロプロパンアミン (0.007 g、0.0088 mL、0.13 mmol、1.30 当量) 及び N,N-ジイソプロピルエチルアミン (0.031 g、0.042 mL、0.24 mmol、2.50 当量) の N,N-ジメチルホルムアミド (0.096 mL) 中の溶液に HATU (0.042 g、0.11 mmol、1.10 当量) を添加した。反応混合物を rt で 3 時間撹拌した。反応混合物を水で希釈し、EtOAc で抽出した。組み合わせた有機層を塩水で洗浄し、Na₂SO₄ で乾燥させ、ろ過し、減圧下で濃縮した。粗残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (シクロヘキサン / EtOAc) により精製した。得られた固体をペンタンで洗浄し、ろ出して、5-クロロ-N-シクロプロピル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミドを白色の固体として得た。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 8.14 (s, 1H) 7.06 (s, 1H) 6.34 (br s, 1H) 5.92 (br d, J = 8.36 Hz, 1H) 4.36 - 4.41 (m, 1H) 4.31 - 4.36 (m, 1H) 4.03 - 4.12 (m, 1H) 2.93 (tq, J = 7.08, 3.63 Hz, 1H) 1.40 (d, J = 6.90 Hz, 3H) 0.89 - 0.95 (m, 2H) 0.65 - 0.70 (m, 2H) 30

【0356】

実施例 P8: 3-クロロ-N-シクロプロピル-6-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリダジン-4-カルボキサミド (化合物 P-88、表 P) の調製

【化 88】



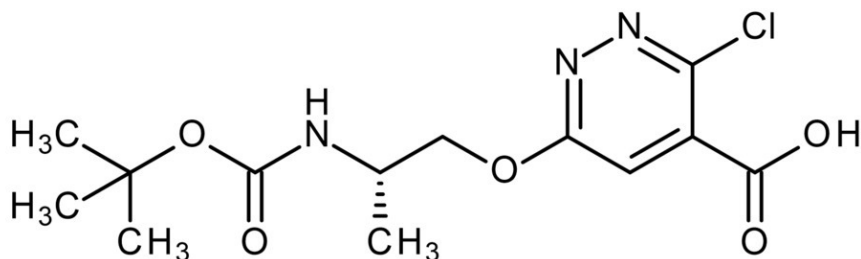
40

(化合物 P-88、表 P)

ステップ A: 6-[(2S)-2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)プロポキシ]-3-クロロ-ピリダジン-4-カルボン酸の調製

50

【化 8 9】



10

tert - ブチル N - [(1 S) - 2 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチル] カルバメート (2 . 2 0 0 g 、 1 2 . 5 6 m m o l 、 1 当量) 及び 3 , 6 - ジクロロピリダジン - 4 - カルボン酸 (2 . 6 6 g 、 1 3 . 8 1 m m o l 、 1 . 1 当量) の D M S O (3 5 m L) 中の溶液に 0 で水酸化ベンジルトリメチルアンモニウム (1 4 . 8 7 m L 、 3 7 . 7 m m o l 、 4 0 質量 % 、 3 当量) の水溶液を滴下した。次いで、得られた混合物を r t に温め、2 時間撹拌した。次いで、混合物を水で希釈し、H C l_{aq} (2 M) で中性の p H に酸性化し、E t O A c で抽出した。次いで、水性相を H C l_{aq} (2 M) で p H 5 にさらに酸性化し、E t O A c で数回抽出した。組み合わせた有機相を水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮した。所望の生成物が得られ、これを次のステップでさらに精製することなく用いた。

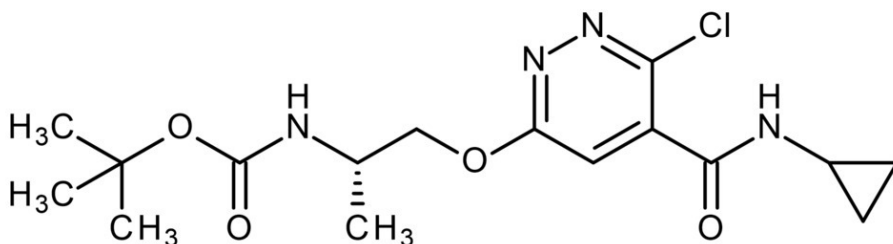
20

¹ H N M R (4 0 0 M H z , D M S O - d 6) δ p p m 1 . 1 2 (d , J = 6 . 9 0 H z , 3 H) 1 . 3 6 (s , 9 H) 3 . 1 1 - 3 . 3 4 (m , 1 H) 3 . 8 6 - 3 . 9 7 (m , 1 H) 4 . 2 3 - 4 . 3 3 (m , 1 H) 4 . 3 4 - 4 . 4 5 (m , 1 H) 7 . 5 2 - 7 . 5 9 (m , 1 H) 1 3 . 3 9 - 1 5 . 2 5 (m , 1 H)

【 0 3 5 7 】

ステップ B : tert - ブチル N - [(1 S) - 2 - [6 - クロロ - 5 - (シクロプロピルカルバモイル) ピリダジン - 3 - イル] オキシ - 1 - メチル - エチル] カルバメート

【化 9 0】



30

6 - [(2 S) - 2 - (tert - ブトキシカルボニルアミノ) プロポキシ] - 3 - クロロ - ピリダジン - 4 - カルボン酸 (0 . 2 0 g 、 0 . 4 8 m m o l 、 1 . 0 0 当量) 、 シクロプロパンアミン (0 . 0 3 3 g 、 0 . 0 4 0 m L 、 0 . 5 8 m m o l 、 1 . 2 0 当量) 及びトリエチルアミン (0 . 1 4 7 g 、 0 . 2 0 3 m L 、 1 . 4 5 m m o l 、 3 . 0 当量) のアセトニトリル (4 . 8 2 m L) 中の溶液に 1 - プロパンホスホン酸無水物の E t O A c (0 . 9 6 5 m m o l 、 2 . 0 当量) 中の 1 . 7 M 溶液を添加し、反応を r t で 1 5 分間撹拌した。次いで、混合物を E t O A c で希釈し、N a H C O₃ 飽和水溶液で処理した。水性層を E t O A c で数回抽出し、組み合わせた有機層を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮した。所望の化合物が得られ、これを次のステップでさらに精製することなく用いた。

40

¹ H N M R D M S O - d 6) δ p p m 0 . 5 3 (b r d d , J = 3 . 8 1 , 2 . 3 6 H z , 2 H) 0 . 7 3 (d d , J = 7 . 0 8 , 2 . 0 0 H z , 2 H) 1 . 1 2 (d , J = 6 . 9 0 H z , 3 H) 1 . 3 8 (s , 9 H) 2 . 8 1 (t d , J = 7 . 3 6 , 3 . 8 1 H z , 1 H) 3 . 9 1 (d t , J = 1 3 . 9 0 , 6 . 6 8 H z , 1 H) 4 . 1 9 - 4

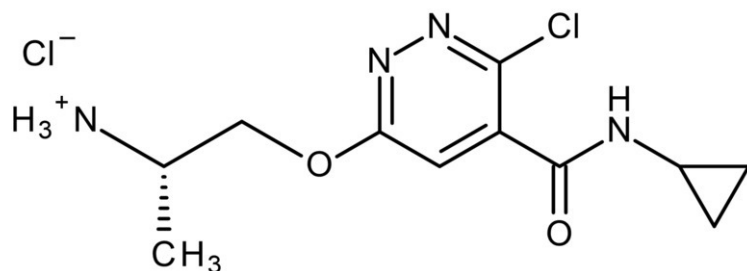
50

. 40 (m, 3H) 6.92 (br d, $J = 7.99$ Hz, 1H) 7.39 (s, 1H)
) 8.79 (d, $J = 4.00$ Hz, 1H)

【0358】

ステップC: [(1S)-2-[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)ピリダジン-3-イル]オキシ-1-メチル-エチル]塩化アンモニウムの調製

【化91】



10

Tert-ブチルN-[(1S)-2-[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)ピリダジン-3-イル]オキシ-1-メチル-エチル]カルバメート(0.21g、0.57mmol、1.0当量)をHClのMeOH(4ml、5.00mmol)中の1.25M溶液中に溶解した。混合物をrtで30分間、次いで65で1時間攪拌した。得られた混合物をロータリー蒸発器を用いて濃縮して標題の化合物を得、これを次の

20

ステップでさらに精製することなく用いた。
 ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6) δ ppm 0.48-0.58 (m, 2H) 0.67-0.82 (m, 2H) 1.26-1.34 (m, 3H) 2.82 (td, $J = 7.36, 3.81$ Hz, 1H) 2.98-3.10 (m, 1H) 4.45-4.64 (m, 2H) 7.37 (s, 1H) 8.36 (br s, 3H) 8.91 (br d, $J = 2.54$ Hz, 1H)。

【0359】

ステップD: シクロプロピル3-クロロ-6-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリダジン-4-カルボキシレート(化合物P-88、表P)の調製

30

[(1S)-2-[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)ピリダジン-3-イル]オキシ-1-メチル-エチル]塩化アンモニウム(0.20g、0.65mmol、1当量)のアセトニトリル(6.5mL)中の溶液にトリエチルアミン(0.367ml、2.60mmol、4当量)を-40で添加し、トリフルオロメタンスルホン酸無水物(0.11ml、0.65mmol、1.0当量)を滴下した。得られた混合物を攪拌し、30分間でrtに温めた。次いで、混合物をEtOAcで希釈し、NaHCO₃飽和水溶液で処理し、水性層をEtOAcで数回抽出した。組み合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥させ、減圧中で濃縮した。シリカゲルにおけるカラムクロマトグラフィ(溶離液: 混合物EtOAc/シクロヘキサン)による精製で標題の化合物を無色の油として得た。

40

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6) δ ppm 0.52-0.58 (m, 2H) 0.70-0.76 (m, 2H) 1.28 (d, $J = 6.90$ Hz, 3H) 2.81 (td, $J = 7.36, 3.81$ Hz, 1H) 3.93-4.00 (m, 1H) 4.32 (dd, $J = 11.26, 7.63$ Hz, 1H) 4.50 (dd, $J = 11.26, 4.36$ Hz, 1H) 7.38 (s, 1H) 8.82 (d, $J = 4.36$ Hz, 1H) 9.65 (br s, 1H)。

^{19}F NMR (377MHz, DMSO- d_6) δ ppm -77.79 (s, 3F)。

【0360】

合成した式(I)の化合物のさらなる例を表Pに示す。

【0361】

50

【表 1 2 - 1】

表 P:式 I の化合物の物理的データ

項目	IUPAC 名	RT (min)	[M+H] (実測値)	方法	MP ° C
P-1	2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.03	402.3	1	110-112
P-2	2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.05	427.3	1	175-177
P-3	2-クロロ-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.10	444.2	1	118-120
P-4	2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(ジクロロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	0.81	418.03	4	
P-5	N-(1-ビシクロ[1.1.1]ペンタニル)-2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.12	428.1	1	
P-6	tert-ブチル N-[(1S)-2-[[6-クロロ-5-[(1-シアノシクロプロピル)カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-N-(トリフルオロメチルスルホニル)カルバメート	1.68	527.0	3	
P-7	2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[(2S)-2-[メチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.56	441.0	3	
P-8	2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-5-[(2S)-2-[シアノメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.40	466.1	2	168 - 170
P-9	[[[(1S)-2-[[6-クロロ-5-[(1-シアノシクロプロピル)カルバモイル]-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-N-(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]メチル 2-メチルプロパノエート	1.64	527.1	3	
P-10	2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(ジフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	0.98	384.1	1	
P-11	N-tert-ブチル-2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.59	418.0	3	152 - 154
P-12	N-アセチル-2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カル	1.12	488.1	1	

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 2】

	ボキサミド				
P-13	[[[(1S)-2-[[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-[トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]メチル 2-メチルプロパノエート	1.27	502.1	1	
P-14	メチル N-[(1S)-2-[[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-N-(トリフルオロメチルスルホニル)カルバメート	1.07	416.2 [(M+H)]+43]	1	
P-15	2-クロロ-5-[(2S)-2-(シアノメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロボキシ]-N-シクロプロピル-ピリジン-3-カルボキサミド	1.54	441.0	3	
P-16	2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-(メチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.56	416	3	
P-17	2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)エトキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	0.99	388.2	1	151 - 153
P-18	2-クロロ-N-(5-シアノ-3-フルオロ-2-ピリジル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.29	482.37	5	
P-19	2-クロロ-N-(5-クロロ-3-フルオロ-2-ピリジル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.41	491.34	5	
P-20	2-クロロ-N-(5-クロロ-3-メチル-2-ピリジル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.45	487.37	5	
P-21	2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]-N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)ピリジン-3-カルボキサミド	1.46	492.36	5	
P-22	2-クロロ-N-(4-シアノ-2-フルオロ-フェニル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.48	481.37	5	
P-23	2-クロロ-N-(2,4-ジフルオロフェニル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.5	474.37	5	
P-24	2-クロロ-N-(2-フルオロ-4-メチルスルホニル-フェニル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.33	534.38	5	
P-25	2-クロロ-N-(4-クロロ-2-フルオロ-フェニル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.64	490.34	5	
P-26	N-(1-ビスシクロ[1.1.1]ペンタニル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)	1.22	408.42	5	

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 3】

	プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド				
P-27	N-[1-[2-(5-シアノ-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.2	539.48	5	
P-28	N-[(5-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.21	467.39	5	
P-29	N-[(2E)-2-メトキシイミノ-1,1-ジメチル-エチル]-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.22	441.47	5	
P-30	2-メチル-N-[3-オキソ-2-(2,2-トリフルオロエチル)イソキサゾリジン-4-イル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.19	509.41	5	
P-31	N-(1-シクロプロピルエチル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.21	410.47	5	
P-32	N-[(3-クロロ-2-ピリジル)メチル]-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.19	467.42	5	
P-33	N-(2,4-ジフルオロフェニル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.34	454.39	5	
P-34	N-イソプロピル-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.06	384.43	5	
P-35	N-[1-(4-フルオロフェニル)-2-オキソ-ピロリジン-3-イル]-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.24	519.5	5	
P-36	N-エチル-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	0.95	370.43	5	
P-37	N-(3,3-ジフルオロシクロブチル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.17	432.41	5	
P-38	2-メチル-N-[1-(5-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-3-イル)エチル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.05	452.43	5	
P-39	N-(2,2-ジフルオロエチル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.03	406.41	5	
P-40	N-シクロプロピル-N,2-ジメチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.11	396.42	5	

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 4】

P-41	N-(シクロプロピルメチル)-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.12	412.43	5	
P-42	tert-ブチル N-[(1S)-2-[[6-クロロ-5-(シクロプロピルカルバモイル)-3-ピリジル]オキシ]-1-メチル-エチル]-N-(トリフルオロメチルスルホニル)カルバメート	1.68	502.0	3	
P-43	5-[(2S)-2-[アセチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]-2-クロロ-N-シクロプロピル-ピリジン-3-カルボキサミド	1.04	444.2	1	
P-44	N-ベンジル-2-クロロ-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.42	452.43	5	
P-45	2-クロロ-N-(1-シクロプロピルエチル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.4	430.4	5	
P-46	2-クロロ-N-[(1-シアノシクロプロピル)メチル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.18	441.36	5	
P-47	2-クロロ-N-(1-シアノシクロプロピル)-N-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.29	441.39	5	
P-48	2-クロロ-N-(1-シアノシクロブチル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.27	441.4	5	
P-49	2-クロロ-N-[(4S)-2-エチル-3-オキソ-イソキサゾリジン-4-イル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.17	475.41	5	178 - 180
P-50	2-クロロ-N-エチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.15	390.36	5	
P-51	2-クロロ-N-(3-メチルテトラヒドロフラン-3-イル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.2	446.43	5	
P-52	2-クロロ-N-プロプ-2-イニル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.15	400.37	5	
P-53	2-クロロ-N-[2-(シクロプロピルメチルアミノ)-2-オキソ-エチル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.18	473.42	5	
P-54	2-クロロ-N-[3-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチル)イソキサゾリジン-4-イル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.32	529.33	5	72 - 76

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 5】

P-55	2-クロロ-N-(2,2-ジフルオロエチル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.2	426.35	5	
P-56	2-クロロ-N-フェニル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.45	438.4	5	
P-57	2-クロロ-N-(1-シアノ-1-メチル-エチル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.23	429.4	5	175 - 178
P-58	2-クロロ-N-シクロプロピル-N-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.32	416.37	5	
P-59	2-クロロ-N-(2,2-ジフルオロエチル)-N-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.32	440.38	5	
P-60	2-クロロ-N-(4-フルオロ-2-メチル-フェニル)-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.49	470.43	5	146 - 150
P-61	N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]-2-メチル-ピリジン-3-カルボキサミド	0.98	426.3	1	
P-62	N-シクロプロピル-2-メチル-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	0.98	382.3	1	
P-63	2-クロロ-5-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)ピリジン-3-カルボキサミド	1.06	488.0	1	
P-64	2-クロロ-N-シクロプロピル-5-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.10	446.1	1	
P-65	2-クロロ-N-[(4R)-2-エチル-3-オキソ-イソキサゾリジン-4-イル]-5-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-3-カルボキサミド	1.05	475.3	1	115 - 118
P-66	N-(1-ビシクロ[1.1.1]ペンタニル)-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.45	408.16	5	
P-67	N-(1-シアノシクロプロピル)-N,5-ジメチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.31	421.16	5	
P-68	N-(4-エチルチアゾール-5-イル)-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.37	453.14	5	
P-69	N-(1,3-ジヒドロイソベンゾフラン-5-イル)メチル-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カル	1.36	474.19	5	

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 6】

	ボキサミド				
P-70	5-メチル-N-[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]-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.3	507.15	5	
P-71	N-[2-(2-フルオロフェノキシ)エチル]-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.51	480.17	5	
P-72	N-(5-メトキシ-1,1-ジメチルペンタ-2-イニル)-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.47	466.22	5	
P-73	N-(1-シクロプロピルエチル)-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.44	410.17	5	
P-74	N-[1-(2-エチルチアゾール-4-イル)エチル]-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.49	481.17	5	
P-75	N-(3-シアノ-2-フルオロフェニル)-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.49	461.13	5	
P-76	5-メチル-N-[1-(3-ピリジル)エチル]-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	0.93	447.17	5	
P-77	N-ベンジル-5-メチル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.47	432.16	5	
P-78	N-[(4R)-2-エチル-3-オキソ-イソキサゾリジン-4-イル]-2-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロボキシ]-5-メチル-ピリジン-4-カルボキサミド	1.59	499	3	
P-79	N-(1-シアノシクロプロピル)-2-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロボキシ]-5-メチル-ピリジン-4-カルボキサミド	1.03	451.6	1	
P-80	5-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.59	424.1	3	120 - 124
P-81	5-ブromo-N-シクロプロピル-2-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.15	490.0	1	
P-82	5-ブromo-N-(1-シアノシクロプロピル)-2-[(2S)-2-[メトキシメチル(トリフルオロメチルスルホニル)アミノ]プロボキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.09	515.0	1	
P-83	5-ブromo-N-シクロプロピル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロボキシ]	1.11	446.2	1	138 - 141

10

20

30

40

50

【表 1 2 - 7】

	ピリジン-4-カルボキサミド				
P-84	5-ブromo-N-[(4R)-2-エチル-3-オキソ-イソキサゾリジン-4-イル]-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.09	519.0	1	
P-85	5-ブromo-N-(2,2,2-トリフルオロエチル)-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.13	488.1	1	125 - 128
P-86	5-ブromo-N-(1-シアノシクロプロピル)-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	1.10	471.2	1	137 - 140
P-87	5-クロロ-N-シクロプロピル-2-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリジン-4-カルボキサミド	0.91	402	4	122 - 126
P-88	3-クロロ-N-シクロプロピル-6-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリダジン-4-カルボキサミド	0.81	402.99	4	
P-89	N-(1-ビスクロ[1.1.1]ペンタニル)-3-クロロ-6-[(2S)-2-(トリフルオロメチルスルホニルアミノ)プロポキシ]ピリダジン-4-カルボキサミド	0.92	429	4	

10

20

【0362】

生物学的実施例：

以下の実施例によって本発明を例示する。本発明の特定の化合物は、低施用量で効力が高いことによって公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例に概述されている実験手法を用い、必要に応じて例えば 50 ppm、24 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm 又は 0.2 ppm といったより少ない施用量を用いて、当業者によって検証可能である。

30

【0363】

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

綿の葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片にコナジラミの成虫を外寄生させた。インキュベーションの 6 日後にサンプルを死亡率について確認した。

【0364】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした：P-1、P-2、P-3、P-6、P-7、P-8、P-9、P-12、P-13、P-14、P-15、P-17、P-20、P-23、P-28、P-31、P-43、P-46、P-47、P-52、P-54、P-56、P-57、P-58、P-63、P-64、P-70、P-82、P-86。

40

【0365】

実施例 B2：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (ニカメイチュウ) に対する活性

人工餌料の入った 24 ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後

50

、プレートに、L2 幼虫を外寄生させた（ウェル当たり 6 ～ 8 匹）。サンプルを、未処理のサンプルと比較して、外寄生の 6 日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害のカテゴリの少なくとも 1 つが未処理のサンプルよりも高い場合、テストサンプルによるニカメイガ（*Chilo suppressalis*）の防除がもたらされている。

【0366】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の防除をもたらした：P - 2、P - 63。

【0367】

実施例 B3：ジアブロチカバルテアタ（*Diabrotica balteata*）（コーンルートワーム） 10

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートに L2 幼虫を外寄生させた（ウェル当たり 6 ～ 10 匹）。外寄生の 4 日後、未処理のサンプルと比較してサンプルを死亡率及び成長阻害について評価した。

【0368】

以下の化合物は、2つのカテゴリ（死亡率又は成長阻害）の少なくとも一方において、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の効果をもたらした：P - 1、P - 2、P - 7、P - 21、P - 22、P - 64、P - 84。

20

【0369】

実施例 B4：ユースキスツスヘロス（*Euschistus heros*）（ネオトロピカルブラウンスティンクバグ（*Neotropical Brown Stink Bug*））

24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のダイズの葉に、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉に N2 若虫を外寄生させた。サンプルを、外寄生の 5 日後、未処理のサンプルと比較して死亡率及び成長阻害について評価した。

【0370】

以下の化合物は、2つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の効果をもたらした：P - 1、P - 2、P - 3、P - 6、P - 8、P - 12、P - 14、P - 15、P - 16、P - 42、P - 43、P - 50、P - 58、P - 61、P - 63、P - 64、P - 66、P - 71。

30

【0371】

実施例 B5：ミカンキイロアザミウマ（*Frankliniella occidentalis*）（ミカンキイロアザミウマ）：摂食 / 接触活性

ヒマワリの葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のハナアザミウマ属（*Frankliniella*）個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の 7 日後に死亡率について評価した。

40

【0372】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で少なくとも 80 % の死亡率をもたらした：P - 1、P - 2、P - 3、P - 6、P - 7、P - 9、P - 30、P - 35、P - 42、P - 43、P - 47、P - 48、P - 62、P - 64。

【0373】

実施例 B6：モモアカアブラムシ（*Myzus persicae*）（モモアカアブラムシ）：摂食 / 接触活性

ヒマワリの葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。外寄生の 6 日後、サンプルを死亡

50

率について評価した。

【0374】

以下の化合物は、200ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P-1、P-2、P-3、P-4、P-5、P-6、P-8、P-9、P-11、P-12、P-13、P-14、P-15、P-16、P-17、P-26、P-32、P-34、P-36、P-40、P-42、P-43、P-45、P-46、P-47、P-48、P-49、P-50、P-52、P-53、P-54、P-55、P-57、P-58、P-59、P-64、P-67、P-68、P-69、P-70、P-72、P-73、P-75、P-76、P-78、P-83、P-87。

【0375】

実施例B7：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)。浸透移行活性

様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させたエンドウ実生の根を、10,000のDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液に直接入れた。サンプルを、実生をテスト溶液に入れてから6日後に死亡率について評価した。

【0376】

以下の化合物は、24ppmのテスト量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P-1、P-2、P-5、P-6、P-7、P-8、P-10、P-13、P-14、P-15、P-16、P-26、P-28、P-43、P-48、P-54、P-57、P-58、P-64、P-83。

【0377】

実施例B8：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ)：浸透移行活性

10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト化合物をピペットにより24ウェルマイクロタイタープレートに適用し、スクロース溶液と混合した。プレートを延ばしたParafilmで閉じた。24個の孔が開いたプラスチック製のステンシルをプレート上に置き、外寄生させたエンドウマメの実生をParafilm上に直接置いた。外寄生させたプレートをゲル吸取り紙及び他のプラスチック製のステンシルで閉じ、次いで上下を逆さまにした。サンプルを外寄生の5日後に死亡率について評価した。

【0378】

以下の化合物は、12ppmのテスト量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P-1、P-2、P-3、P-4、P-5、P-6、P-7、P-8、P-9、P-10、P-11、P-12、P-13、P-14、P-15、P-16、P-17、P-19、P-20、P-23、P-26、P-42、P-43、P-45、P-47、P-48、P-50、P-54、P-55、P-57、P-58、P-60、P-63、P-64、P-81、P-83、P-87。

【0379】

実施例B9：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ)

人工餌料の入った24ウェルマイクロタイタープレートを、ピペットにより、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、コナガの卵をピペットでプラスチック製のステンシルを介してゲル吸取り紙上に採り、プレートをこれで閉じた。外寄生の8日後、サンプルを未処理のサンプルと比較して死亡率及び成長阻害について評価した。

【0380】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2種のカテゴリ(死亡率又は成長阻害)の少なくとも一方において少なくとも80%の効果をもたらした：P-1、P-5、P-23、P-25、P-27、P-38、P-41、P-60

【0381】

実施例B10：エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ)

綿の葉片を24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上に置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に5匹のL1幼虫を外寄生させた。サンプルを、未処理のサンプルと比較して、外寄生の3日後に死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害について評価した。テストサンプルによるエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除は、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害の少なくとも1つのカテゴリが未処理のサンプルよりも高い場合にもたらされている。

【0382】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の防除をもたらした：P - 2、P - 60、P - 65

10

【0383】

実施例B11：ナミハダニ (*Tetranychus urticae*) (ナミハダニ) : 摂食 / 接触活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のインゲンの葉片に、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のダニ個体群を外寄生させた。外寄生の8日後、サンプルを混合種個体群 (移動可能段階) の死亡率について評価した。

【0384】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率をもたらした：P - 1、P - 3、P - 4、P - 5、P - 6、P - 8、P - 10、P - 11、P - 12、P - 13、P - 14、P - 15、P - 16、P - 18、P - 20、P - 21、P - 22、P - 23、P - 24、P - 25、P - 26、P - 31、P - 32、P - 33、P - 37、P - 39、P - 42、P - 43、P - 44、P - 45、P - 48、P - 49、P - 51、P - 52、P - 56、P - 57、P - 60、P - 63、P - 64、P - 65、P - 77、P - 78、P - 79、P - 80、P - 82、P - 87。

20

【0385】

実施例B12：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ) 摂食 / 接触活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上にナスの葉片を置き、10,000 ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。外寄生の6日後にサンプルを死亡率について評価した。

30

【0386】

以下の化合物は、200 ppmの施用量で少なくとも80%の成長阻害をもたらした：P 89。

40

50

【 国際調査報告 】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2023/062656

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D213/82 C07D237/24 A01N43/40
ADD.

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

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
C07D A01N

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 2021/153720 A1 (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO [JP]) 5 August 2021 (2021-08-05) cited in the application claim 1 -----	1-14

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

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

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

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

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

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

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

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

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

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

19 July 2023

Date of mailing of the international search report

26/07/2023

Name and mailing address of the ISA/
European Patent Office, P.B. 5618 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Johnson, Claire

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2023/062656

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2021153720 A1	05-08-2021	AU 2021214350 A1	01-09-2022
		BR 112022015176 A2	11-10-2022
		CN 115052856 A	13-09-2022
		EP 4098650 A1	07-12-2022
		IL 295328 A	01-10-2022
		JP 7308989 B2	14-07-2023
		JP WO2021153720 A1	05-08-2021
		KR 20220135236 A	06-10-2022
		TW 202144323 A	01-12-2021
		US 2023110603 A1	13-04-2023
		WO 2021153720 A1	05-08-2021

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

テーマコード (参考)

A 0 1 N	43/40	(2006.01)	A 0 1 N	43/40	1 0 1 E
A 0 1 N	43/80	(2006.01)	A 0 1 N	43/80	1 0 1
A 0 1 N	43/58	(2006.01)	A 0 1 N	43/58	A
A 0 1 P	7/02	(2006.01)	A 0 1 P	7/02	
A 0 1 P	7/04	(2006.01)	A 0 1 P	7/04	

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

(74)代理人 100212509

弁理士 太田 知子

(72)発明者 ヒューター オットマー フランツ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

(72)発明者 ジャンゲナ アンドレ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

(72)発明者 モナコ マッティア リカルド

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラッセ

F ターム (参考) 4H011 AC01 AC04 BB09 BB10 DA02 DA15 DA16