

(19)日本国特許庁(JP)

(12)特許公報(B2)

(11)特許番号
特許第7549601号
(P7549601)

(45)発行日 令和6年9月11日(2024.9.11)

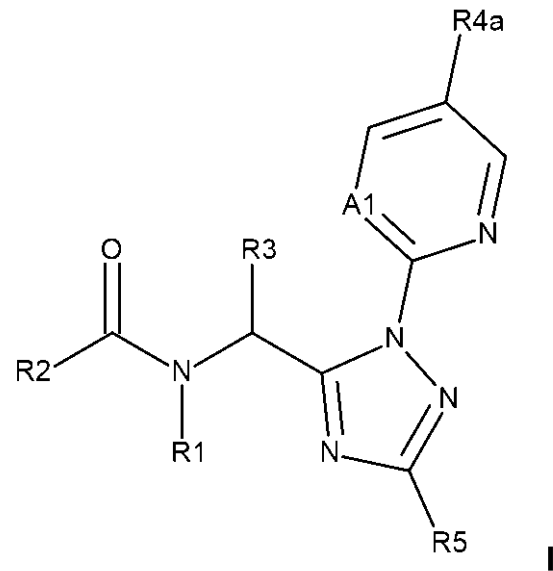
(24)登録日 令和6年9月3日(2024.9.3)

(51)国際特許分類		F I	
C 0 7 D 401/04 (2006.01)		C 0 7 D 401/04	C S P
C 0 7 D 403/04 (2006.01)		C 0 7 D 403/04	
A 6 1 K 31/4439(2006.01)		A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/506(2006.01)		A 6 1 K 31/506	
A 6 1 P 33/14 (2006.01)		A 6 1 P 33/14	
請求項の数 11 (全167頁) 最終頁に続く			
(21)出願番号	特願2021-556833(P2021-556833)	(73)特許権者	520222106
(86)(22)出願日	令和2年3月19日(2020.3.19)		シンジェンタ クロップ プロテクション
(65)公表番号	特表2022-525966(P2022-525966		アクチェンゲゼルシャフト
	A)		スイス 4 0 5 8 パーゼル ローゼンタ
(43)公表日	令和4年5月20日(2022.5.20)		ールシュトラーセ 6 7
(86)国際出願番号	PCT/EP2020/057547	(74)代理人	100094569
(87)国際公開番号	WO2020/188014		弁理士 田中 伸一郎
(87)国際公開日	令和2年9月24日(2020.9.24)	(74)代理人	100103610
審査請求日	令和5年3月16日(2023.3.16)		弁理士 吉 田 和彦
(31)優先権主張番号	19163938.4	(74)代理人	100109070
(32)優先日	平成31年3月20日(2019.3.20)		弁理士 須田 洋之
(33)優先権主張国・地域又は機関	欧州特許庁(EP)	(74)代理人	100119013
			弁理士 山崎 一夫
		(74)代理人	100123777
			弁理士 市川 さつき
		最終頁に続く	

(54)【発明の名称】 殺有害生物活性アゾールアミド化合物

(57)【特許請求の範囲】
【請求項1】
式 I

【化 1】



(式中、

R_1 は、H、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、アミノカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ニトロアルキル、トリメチルシラン $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル $C_1 \sim C_2$ アルキル -、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル $C_1 \sim C_2$ アルキル - (ここで、前記 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基は、1又は2個のハロゲン原子で置換されている)、オキセタン - 3 - イル - CH_2 -、ベンジル又はハロゲン若しくは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルであり；

R_2 は、M - 1 ~ M - 1.2

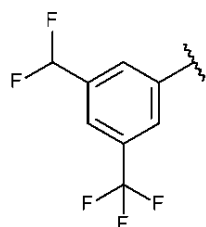
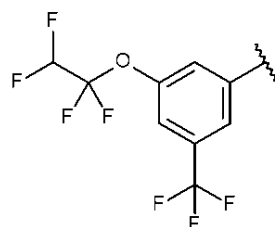
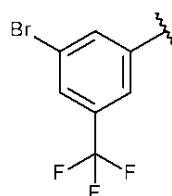
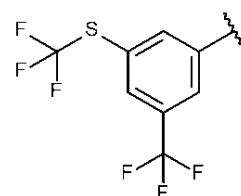
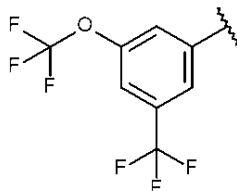
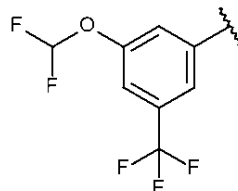
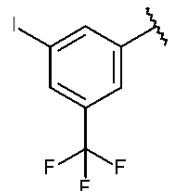
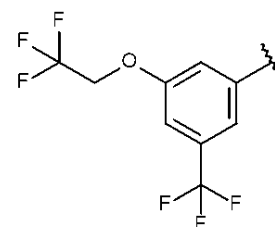
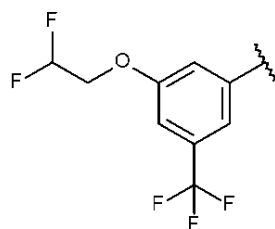
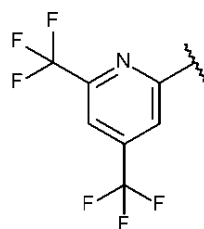
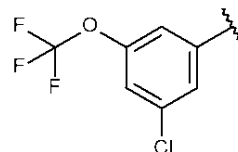
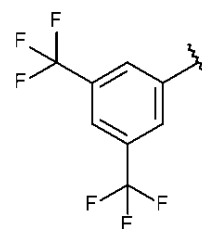
10

20

30

40

50

**M-1****M-2****M-3****M-4****M-5****M-6****M-7****M-8****M-9****M-10****M-11****M-12**

の 1 つであり；

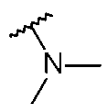
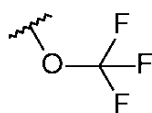
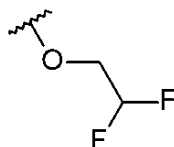
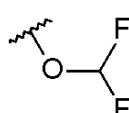
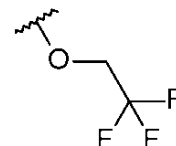
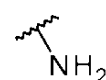
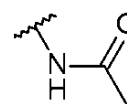
R₃は、C₁～C₃アルキル又はC₁～C₃ハロアルキルであり；

A₁は、C R_{4b}又はNであり；

R_{4b}は、水素又はハロゲンであり；

R_{4a}は、シアノ又はC₁～C₃ハロアルコキシであり；

R₅は、シアノ又はJ - 1～J - 11

**J-1****J-2****J-3****J-4****J-5****J-6****J-7****J-8****J-9****J-10****J-11**

から選択される)

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】

R₃は、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R_1 は、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル又は $CH_2CH_2CH_2$ - である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_{4a} は、シアノ又は $C_1 \sim C_3$ フルオロアルコキシである、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

A_1 は、Nである、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

A_1 は、CH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 7】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物と、1 種以上の助剤及び希釈剤と、任意に 1 種以上の他の有効成分とを含む組成物。

【請求項 8】

(i) 昆虫、ダニ類、線虫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、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 7 に記載の組成物を適用するステップを含む方法；又は

(ii) 昆虫、ダニ類、線虫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 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 7 に記載の組成物で処理するステップを含む方法；又は

20

(iii) 寄生虫の防除を、それを必要としている非ヒト動物内又は上で行う方法であって、有効量の、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 7 に記載の組成物を投与するステップを含む方法。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 7 に記載の組成物を含むか、又はそれで処理されているか、又はそれに付着されている、植物繁殖材料。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 7 に記載の組成物を含むか、又はそれで処理されているか、又はそれに付着されている、種子。

30

【請求項 11】

必要としている動物内又は上において寄生虫を防除するための医薬の製造のための、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物又は請求項 7 に記載の組成物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、殺有害生物的又は殺ダニ的に有効である、特に殺虫的に有効なアゾール - アミド化合物、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、特に昆虫又はダニ目 (Acarina) の代表的なもの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。

40

【背景技術】

【0002】

国際公開第 2017192385 号は、動物 (哺乳類及び非哺乳類動物など) において外寄生生物を防除するために用いられる特定のヘテロアリアル - 1, 2, 4 - トリアゾール及びヘテロアリアル - テトラゾール化合物を記載している。

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】

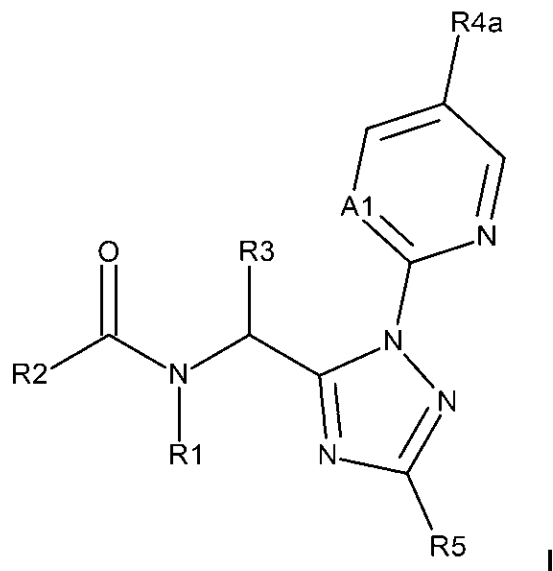
【0003】

ここで、新規の殺有害生物活性アゾールアミド化合物が見出された。

50

【 0 0 0 4 】

従って、本発明は、第 1 の態様において、式 I
【化 1】



(式中、

R₁は、H、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆シアノアルキル、アミノカルボニルC₁～C₆アルキル、ヒドロキシカルボニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ニトロアルキル、トリメチルシランC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₂～C₆アルケニル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₂～C₆アルキニル、C₂～C₆ハロアルキニル、C₃～C₄シクロアルキルC₁～C₂アルキル -、C₃～C₄シクロアルキルC₁～C₂アルキル - (ここで、C₃～C₄シクロアルキル基は、1又は2個のハロゲン原子で置換されている)、オキセタン - 3 - イル - CH₂ -、ベンジル又はハロゲン若しくはC₁～C₆ハロアルキルで置換されたベンジルであり；

R₂は、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン並びにそれぞれ1～3個の置換基で置換されているフェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンから選択されるが、ただし、これらの置換基は、C = Xが結合されている炭素に隣接するいずれの炭素上にもなく、及び各置換基は、C₁～C₃アルキル、C₁～C₃ハロアルキル、C₁～C₃ハロアルキルチオ、C₁～C₃アルコキシ、C₁～C₃ハロアルコキシ、ハロ、SF₅、CN、CONH₂及びC(S)NH₂から独立して選択され；

R₃は、C₁～C₃アルキル又はC₁～C₃ハロアルキルであり；

A₁は、CR_{4b}又はNであり；

R_{4b}は、水素又はハロゲンであり；

R_{4a}は、シアノ又はC₁～C₃ハロアルコキシであり；

R₅は、ハロゲン、アミノ、(C₁～C₃アルキル)アミノ、ジ(C₁～C₃アルキル)アミノ、ヒドロキシ、シアノ、C₃～C₄ハロシクロアルキル、C₂～C₆ハロアルケニル、C₁～C₄ハロアルキルスルファニル、C₁～C₄ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄ハロアルキルスルホニル、C₁～C₄アルキルスルファニル、C₁～C₄アルキルスルフィニル、C₁～C₄アルキルスルホニル、(C₁～C₃アルキル)スルホニルアミノ、(C₁～C₃アルキル)スルホニル(C₁～C₃アルキル)アミノ、(C₁～C₃アルキル)NH C(O)、(C₁～C₃アルキル)₂NC(O)、(C₃～C₆シクロアルキル)NH C(O)、(C₃～C₆シクロアルキル)(C₁～C₃アルキル)NC(O)、(C₁～C₃アルキル)C(O)(C₁～C₃アルキル)N、(C₁～C₃アルキル)C(O)NH、ジフェニルメタンイミン又はC₁～C₃ハロアルコキシである)

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。

【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C₁~C₄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C₁~C₄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、カリウム塩又はマグネシウム塩、又はアンモニア又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 - 又はジメチルプロピルアミン、又はモノ - 、ジ - 又はトリヒドロキシ - 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。

10

【0006】

それぞれの場合において、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。

20

【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. Albin 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】

本明細書において用いられる場合、「C₁~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基を指し、例えば基であるメチル、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1つである。

30

40

【0010】

本明細書において用いられる場合、「C₁~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基を指し(上記のとおり)、ここで、これらの基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 - ブロモエチル、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

50

、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 - ブロモプロピル、3 - ブロモプロピル、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 - (ブロモメチル) - 2 - ブロモエチル、4 - フルオロブチル、4 - クロロブチル、4 - ブ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個のフッ素原子を有する $C_1 \sim C_2$ アルキル基を指し、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つであろう。

10

【0011】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、酸素原子を介して結合している、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 - メチルプロポキシ又は1, 1 - ジメチルエトキシ基のいずれか1つである。本明細書において用いられる場合、「ハロ $C_1 \sim C_n$ アルコキシ」という用語は、アルキル基上の1個以上の水素原子が、同一の又は異なるハロゲン原子によって置換された $C_1 \sim C_n$ アルコキシ基（例としては、トリフルオロメトキシ、2 - フルオロエトキシ、3 - フルオロプロポキシ、3, 3, 3 - トリフルオロプロポキシ、4 - クロロブトキシが挙げられる）を指す。

20

【0012】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ シアノアルキル」という用語は、1～n個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和 $C_1 \sim C_n$ アルキル基（上記のとおり）を指し、ここで、これらの基中の水素原子の1個がシアノ基によって置換されており、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。

【0013】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル」という用語は、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン及びシクロヘキサンなどの3～n員シクロアルキル基を指す。

30

【0014】

本明細書において用いられる場合、「 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキル基を有する3又はn員シクロアルキル基を指し、このアルキル基は、分子の残部に結合している。例えば、 $C_3 \sim C_n$ シクロアルキル $C_1 \sim C_n$ アルキル基は、置換されており、置換基は、シクロアルキル基又はアルキル基上にあり得る。

【0015】

本明細書において用いられる場合、「アミノカルボニル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキル基を指し、ここで、基中の水素原子の1個は、 $CONH_2$ 基によって置換されている。

40

【0016】

本明細書において用いられる場合、「ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、基中の水素原子の1個が $COOH$ 基によって置換されているアルキル基を指す。

【0017】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ニトロアルキル」という用語は、アルキル基を指し、ここで、基中の水素原子の1個は、 NO_2 基によって置換されている。

【0018】

本明細書において用いられる場合、「 $C_1 \sim C_n$ ハロアルキルチオ」という用語は、硫黄原子を介して結合している $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル部分を指す。

50

【 0 0 1 9 】

本明細書において用いられる場合、「トリメチルシラン $C_1 \sim C_n$ アルキル」という用語は、アルキル基を指し、ここで、基中の水素原子の1個は、 $-Si(CH_3)_3$ 基によって置換されている。

【 0 0 2 0 】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ アルケニル」という用語は、 $2 \sim n$ 個の炭素原子及び1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。

【 0 0 2 1 】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ ハロアルケニル」という用語は、同一であるか又は異なり得る1個以上のハロゲン原子で置換されている $C_2 \sim C_n$ アルケニル部分を指す。

10

【 0 0 2 2 】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ アルキニル」という用語は、 $2 \sim n$ 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。

【 0 0 2 3 】

本明細書において用いられる場合、「 $C_2 \sim C_n$ ハロアルキニル」という用語は、同一であるか又は異なり得る1個以上のハロゲン原子で置換されている $C_2 \sim C_n$ アルキニル部分を指す。

20

【 0 0 2 4 】

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、対応して、ハロアルキルなどの他の意味と組み合わされたハロゲンにも適用される。

【 0 0 2 5 】

R_2 及び R_4 に係るピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジン基（無置換又は置換されたもの）は、それぞれの環における炭素原子を介して化合物の残部にそれぞれ結合している。

【 0 0 2 6 】

本明細書において用いられる場合、「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。

30

【 0 0 2 7 】

本明細書において用いられる場合、例えば、J - 1、M - 1及びL - 1における波線は、化合物の残部に対する接続/結合点を表す。

【 0 0 2 8 】

本明細書において用いられる場合、「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）の保管において見られる昆虫、ダニ類、線虫及び軟体動物；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。

【 0 0 2 9 】

本明細書において用いられる場合、「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。

40

【 0 0 3 0 】

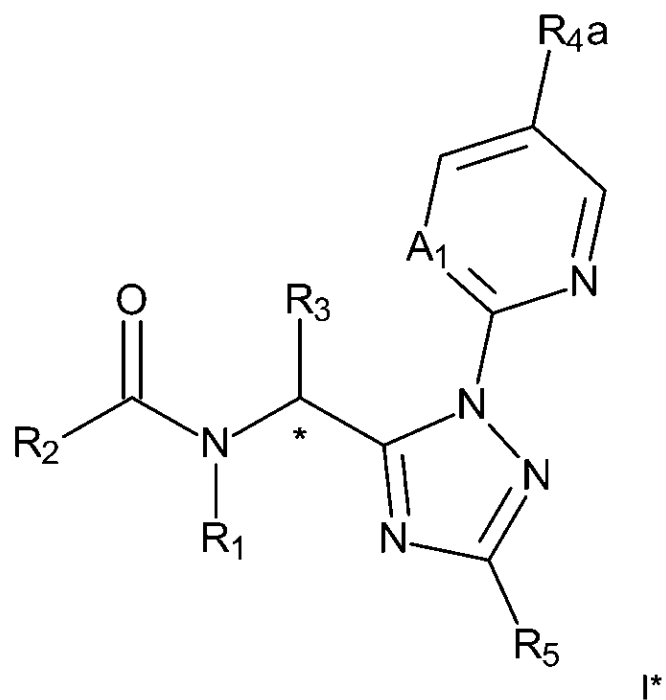
有効量は、公知の技術の使用により及び類似する状況下で得られる結果を観察することにより、当業者によって容易に判定される。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、適用される植物の種類又は植物に由来する産物の種類；防除される有害生物及びそのライフサイクル；適用される特定の化合物；適用の種類；並びに他の関連する状況を含む多数の要因が考慮される。

【 0 0 3 1 】

当業者が理解するであろうとおり、式Iの化合物は、以下の構造：

50

【化 2】



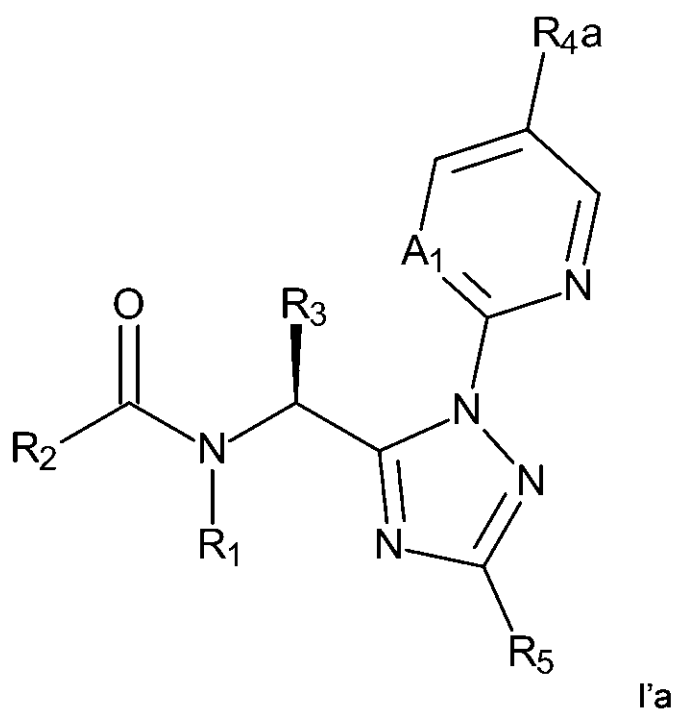
(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 は、第1の態様において定義されているとおりである)

においてアスタリスクで示すステレオジェン中心を含む。

【0032】

本発明は、ラセミ化合物及び個々の鏡像異性体の両方を想定している。好ましい立体化学を有する化合物を以下に示す。

【化 3】



【0033】

特に好ましい本発明の化合物は、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 が、第1の態様に

において定義されているとおりである式 I' a の化合物並びに式 (I' a) の化合物の立体異性体、鏡像異性体、互変異性体及び N - オキシド及びその農芸化学的に許容可能な塩である。

【 0 0 3 4 】

本明細書において用いられる場合、「任意に置換されていてもよい」という用語は、参照されている基が無置換であるか又は指定の置換基で置換されていることを意味し、例えば、「 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルは、1又は2個のハロゲン原子で任意に置換されていてもよい」とは、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル、1個のハロゲン原子で置換された $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル及び2個のハロゲン原子で置換された $C_3 \sim C_4$ シクロアルキルを意味する。

【 0 0 3 5 】

本発明に係る実施形態は、以下に記載されるとおり提供される。

【 0 0 3 6 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、 R_1 は、

A . 水素、メチル、エチル、n - プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル若しくは HCH_2CH_2- ; 又は

B . 水素、メチル若しくはシクロプロピルメチル ; 又は

C . 水素 ; 又は

D . メチル ; 又は

E . シクロプロピルメチル

である。

【 0 0 3 7 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、 R_2 は、

A . フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン若しくはそれぞれ1～3個の置換基で置換されているフェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンであって、ただし、これらの置換基は、 $C=X$ が結合されている炭素に隣接するいずれの炭素上にもなく、及び各置換基は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ及びハロゲンから独立して選択される、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジン ; 又は

B . M - 1 ~ M - 1 2

10

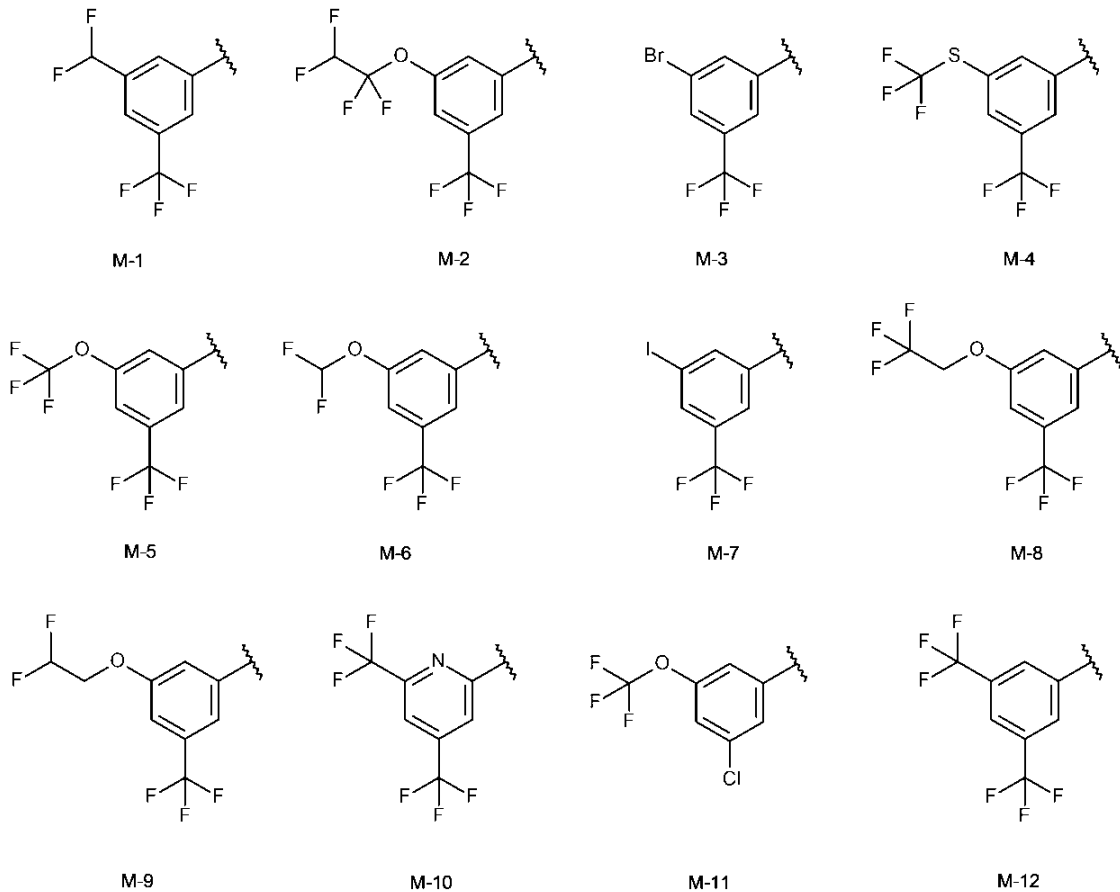
20

30

40

50

【化 4】



10

20

の 1 つ、

C . M - 3、M - 4、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9、M - 11 若しくは M - 12 の 1 つ；又は

D . M - 3、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9 若しくは M - 12 の 1 つ；又は

E . M - 6、M - 9 若しくは M - 12 の 1 つ

である。

【 0 0 3 8】

本発明の各態様に係る一実施形態において、 R_3 は、

A . $C_1 \sim C_3$ アルキル若しくは $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル；又は

B . メチル

である。

【 0 0 3 9】

本発明の各態様に係る一実施形態において、 A_1 は、

A . N；又は

B . C - R_{4b} （ここで、 R_{4b} は、水素若しくはハロゲン（Cl、F、Br 及び I など）であり；好ましくは水素である）

である。

【 0 0 4 0】

本発明の各態様に係る一実施形態において、 R_{4a} は、

A . シアノ若しくは $C_1 \sim C_3$ フルオロアルコキシ；又は

B . シアノ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ若しくは 2, 2 - ジフルオロエトキシ

である。

【 0 0 4 1】

30

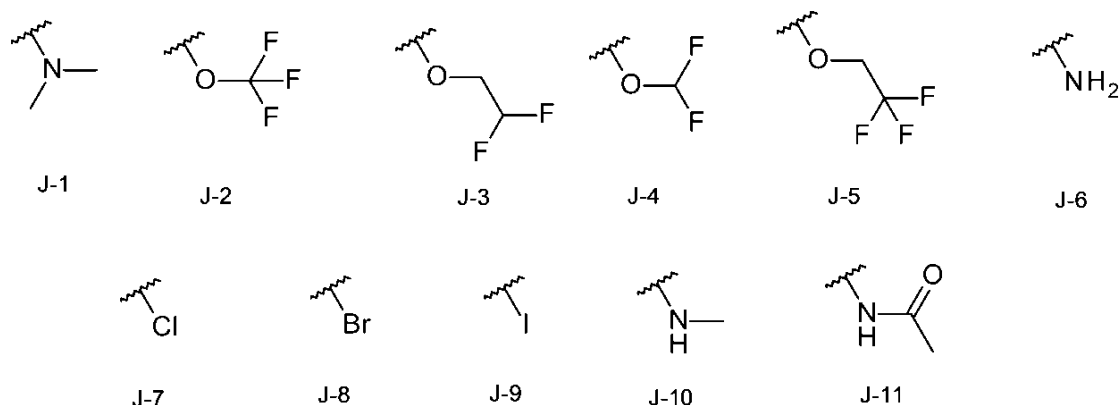
40

50

本発明の各態様に係る一実施形態において、 R_5 は、

A. J - 1 ~ J - 11

【化5】



10

から選択されるか、

B. J - 2、J - 3、J - 4、J - 5、J - 7、J - 8 及び J - 9 から選択されるか；又は

C. J - 2 若しくは J - 8 である。

【0042】

20

さらなる態様において、 R_5 は、例えば、2 - ピリジニル及び2 - ピリミジニルといったピリジニル及びピリミジニルなどの6員ヘテロアリールを含む。

【0043】

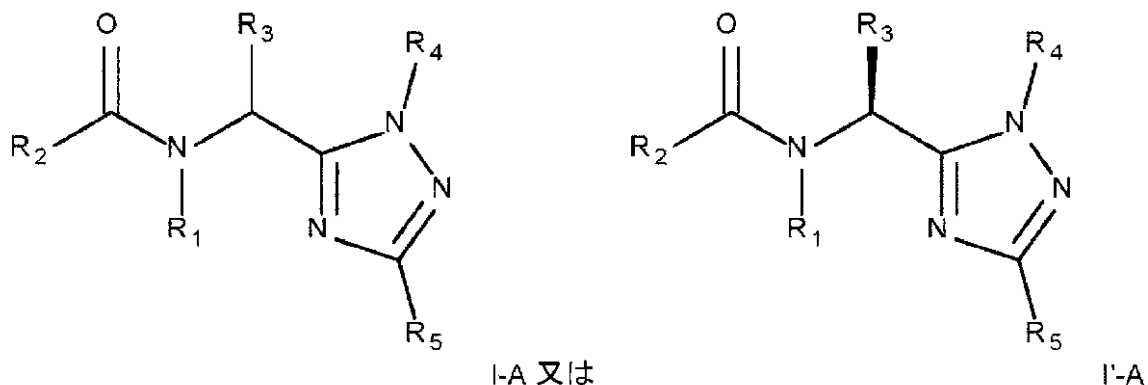
従って、本発明は、すべての組み合わせ/各順列において、上記に定義されているとおり、置換基 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 を有する式 I の化合物を利用可能にする。従って、例えば、 A_1 が実施形態 A（すなわち、 A_1 は、N である）であり； R_1 が実施形態 B（すなわち水素、メチル、シクロプロピルメチル）であり； R_2 が実施形態 C（すなわち M - 3、M - 4、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9、M - 11 又は M - 12 の1つ）であり； R_3 が実施形態 B（すなわちメチル）であり； R_{4a} が実施形態 B（すなわちシアノ、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ又は2, 2 - ジフルオロエトキシ）であり；及び R_5 が実施形態 A（すなわち J - 1 ~ J - 11 から選択される）である式 I の化合物が利用可能にされる。

30

【0044】

一実施形態において、式 I の化合物は、

【化6】



40

として表され得、式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_5 は、第1の態様において定義されているとおりであり、及び R_4 は、第1の態様において定義されている A_1 及び置換基 R_{4a} を含有する6員環式基である。

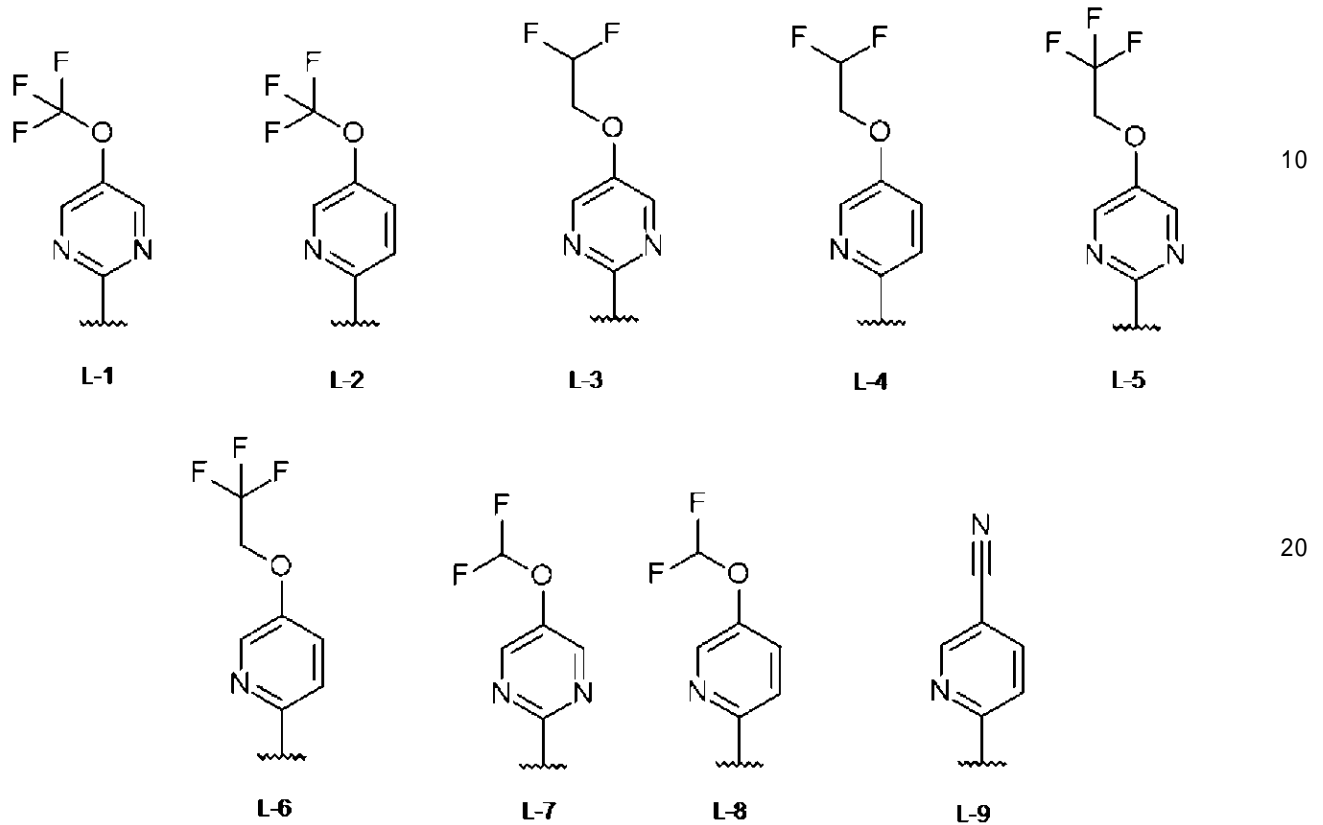
50

【 0 0 4 5 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、 R_4 (A_1 及び置換基 R_{4a} を含有する環式基)は、

A . L - 1 ~ L - 9

【 化 7 】



から選択されるか、

B . L - 1、L - 2、L - 7、L - 8 及び L - 9 から選択されるか；又は

C . L - 1 若しくは L - 9 である。

【 0 0 4 6 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル又は HCH_2-CCH_2- を有し； R_2 として M - 1 ~ M - 12 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1 ~ L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 1 ~ J - 11 の 1 つを有する。

【 0 0 4 7 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として M - 1 ~ M - 12 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1 ~ L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 1 ~ J - 11 の 1 つを有する。

【 0 0 4 8 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素を有し； R_2 として M - 1 ~ M - 12 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1 ~ L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 1 ~ J - 11 の 1 つを有する。

【 0 0 4 9 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として M - 3、M - 4、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9、M - 11 又は M - 12 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1 ~ L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 1 ~ J - 11 の 1 つを有する。

【 0 0 5 0 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として M - 3、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9 又は M - 1 2 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1 ~ L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 1 ~ J - 1 1 の 1 つを有する。

【 0 0 5 1 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として M - 3、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9 又は M - 1 2 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1、L - 2、L - 7、L - 8 及び L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 1 ~ J - 1 1 の 1 つを有する。

10

【 0 0 5 2 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として M - 3、M - 5、M - 6、M - 8、M - 9 又は M - 1 2 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1、L - 2、L - 7、L - 8 及び L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 2、J - 3、J - 4、J - 5、J - 7、J - 8 及び J - 9 の 1 つを有する。

【 0 0 5 3 】

本発明の各態様に係る一実施形態において、式 I の化合物は、 R_1 として水素、メチル又はシクロプロピルメチルを有し； R_2 として M - 6、M - 9 又は M - 1 2 の 1 つを有し； R_3 としてメチルを有し； R_4 として L - 1 又は L - 9 の 1 つを有し；及び R_5 として J - 2 又は J - 8 の 1 つを有する。

20

【 0 0 5 4 】

第 2 の態様では、本発明は、第 1 の態様において定義されている式 I の化合物と、1 種以上の助剤及び希釈剤と、任意に 1 種以上の他の有効成分とを含む組成物を利用可能にする。

【 0 0 5 5 】

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利用可能にし、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 の態様において定義されている化合物又は第 2 の態様において定義されている組成物を適用するステップを含む。

30

【 0 0 5 6 】

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を保護する方法を利用可能にし、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 の態様において定義されている式 I の化合物又は第 2 の態様において定義されている組成物で処理するステップを含む。

【 0 0 5 7 】

第 5 の態様では、本発明は、第 1 の態様において定義されている式 I の化合物又は第 2 の態様において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、又はそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料を利用可能にする。

40

【 0 0 5 8 】

さらなる態様において、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 の態様の化合物を投与するステップ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ステップ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ステップを含む方法をさらに提供する。

【 0 0 5 9 】

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

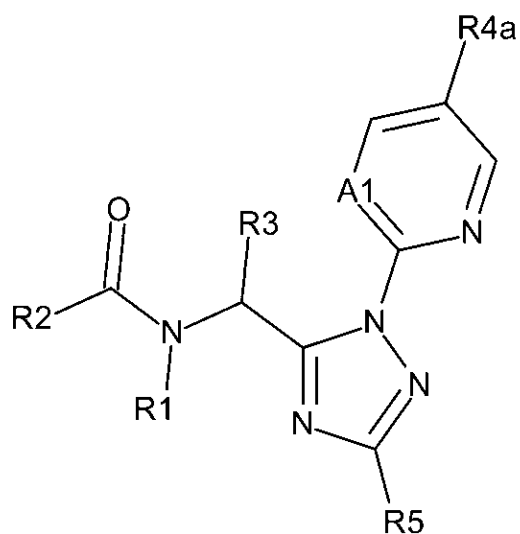
50

具体的には、式 I 及び I' a の化合物及び中間体は、従って、スキーム及び実施例において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ていない。

【 0 0 6 0 】

式 I

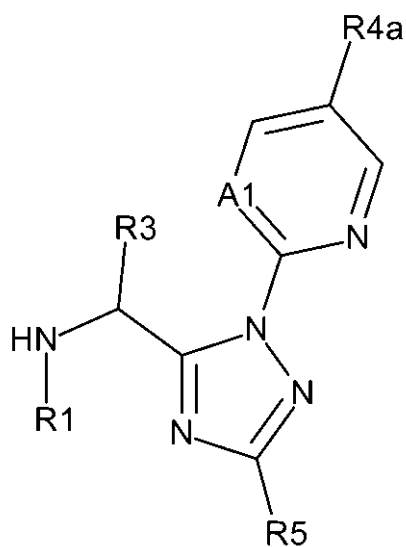
【 化 8 】



(I)

の化合物は、式 I I

【 化 9 】



(II)

(式中、R₁、R₃、R_{4a}、Q₁、Q₂及びA₁は、式 I に記載されているとおりである)
 のアミンと、式 (I I I)

10

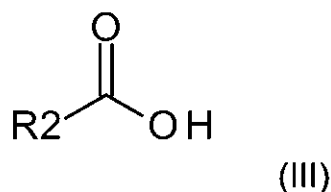
20

30

40

50

【化 1 0】

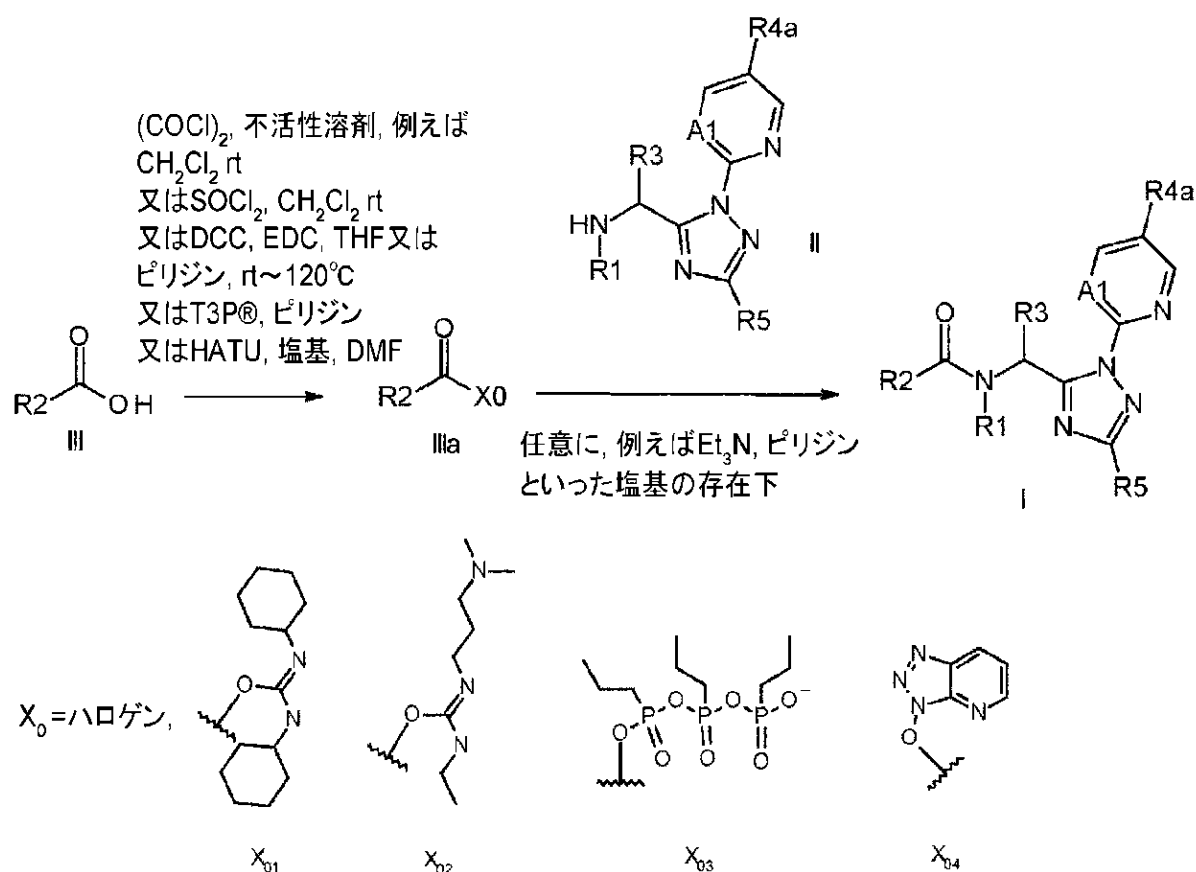


(式中、 R_2 は、式 I において上記で記載されているとおりである)

のカルボン酸誘導体との反応により調製可能である。化学をスキーム 1 においてより詳細に説明する。

スキーム 1 :

【化 1 1】



【0061】

スキーム 1 において、式 I I I の化合物 (ここで、 R_2 は、式 I において定義されているとおりである) は、当業者に公知であると共に、例えば Tetrahedron, 61 (46), 10827-10852, 2005 に記載されている方法により、式 I I I a の化合物に活性化される。例えば、 X_0 がハロゲンである化合物は、例えば、塩化オキサリル又は塩化チオニルによる、触媒量の DMF の存在下における、2 塩化メチレン又は THF などの不活性溶剤中、20 ~ 100、好ましくは 25 の温度での式 I I I の化合物の処理によって形成される。式 I I の化合物 (ここで、 R_1 、 R_3 、 R_5 、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記で定義されているとおりである) による、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 I I I a の処理で式 I の化合物がもたらされる。代わりに、式 I の化合物は、活性化種 I I I a (ここで、 X_0 は、それぞれ X_{01} 及び X_{02} である) がもたらされる、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 (E D C) による、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における、50 ~ 180 の温度での式 I I I の化合物の処理によって調製可能である。加えて、式 I I I の酸は、例えば、Synthesis 2013, 45, 1569 及び Journal Prakt. Chemie 1998, 340, 581 に記載されているとおり、ホスホン酸無水プロパン (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ァート (H A T U) などのカップリング試薬を伴う反応により活性化されて、式 I I I a の化合物 (ここで、X₀ は、X₀₃ 及び X₀₄ である) をもたらしこともできる。その後における式 I I のアミンとの反応が式 I の化合物を提供する。

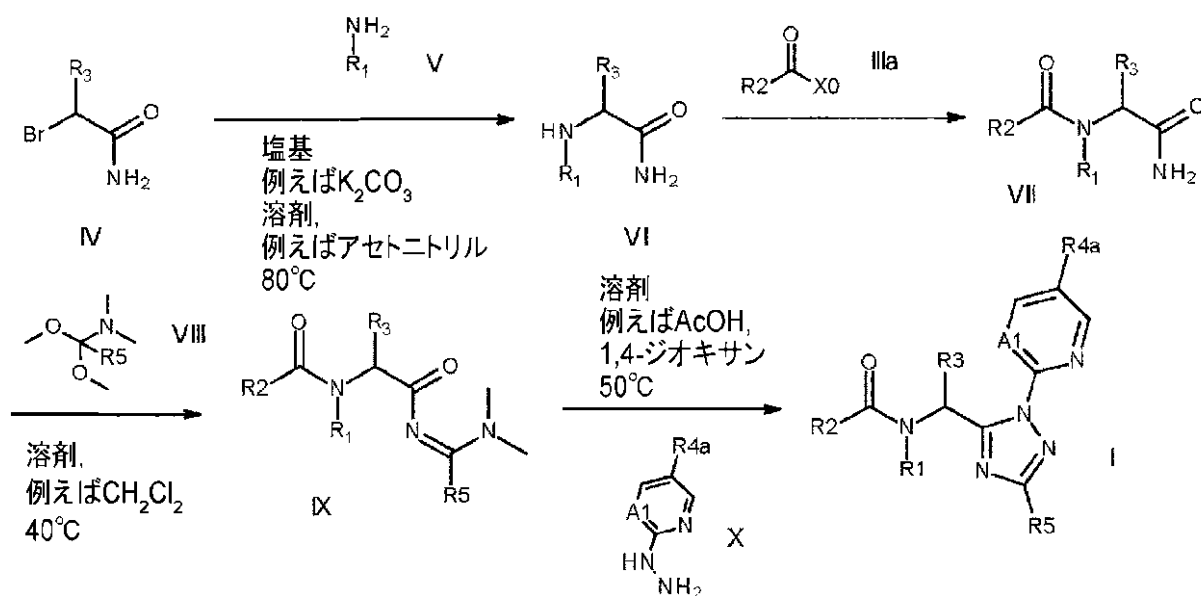
10

【 0 0 6 2 】

式 I の化合物の調製プロセスは、一般に公知であるか、又は当業者によって容易に調製可能である。このような合成の典型的な例をスキーム 2 に示す。

スキーム 2 :

【 化 1 2 】



20

30

【 0 0 6 3 】

例えば、式 I の化合物 (ここで、R₁、R₂、R₃、R_{4a}、R₅ 及び A₁ は、式 I に定義されているとおりである) は、例えば、酢酸及び 1,4 - ジオキサンの混合物を含み得る好適な溶剤中、通常、室温 ~ 120、好ましくは 40 ~ 反応混合物の沸点の温度、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 I X の化合物 (ここで、R₁、R₂、R₃ 及び R₅ は、式 I に定義されているとおりである) と、式 X の化合物 (ここで、R_{4a} 及び A₁ は、式 I に定義されているとおりである) との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750 において以前に記載されている。

40

【 0 0 6 4 】

式 I X の化合物 (ここで、R₁、R₂、R₃ 及び R₅ は、式 I について定義されているとおりである) は、例えば、ジクロロメタンを含み得る好適な溶剤中、通常、室温 ~ 150、好ましくは 40 ~ 反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式 V I I の化合物 (ここで、R₁、R₂ 及び R₃ は、式 I について上記のように定義される) と、式 V I I I の化合物 (ここで、R₅ は、式 I について上記のように定義される) との反応によって調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750 及び米国特許出願公開第 2016296501 号明細書の 29 ページにおいて以前に記載されている。

50

【 0 0 6 5 】

式 V I I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I について定義されているとおりである）は、例えば、ピリジン、DMF、アセトニトリル、 CH_2Cl_2 又は THF を含む得る好適な不活性溶剤中、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、通常、室温～150 の温度での加熱を伴う、式 V I の化合物（ここで、 R_1 及び R_3 は、式 I について定義されているとおりである）と、式 I I I a の化合物（ここで、 R_2 及び X_0 は、スキーム 1 において上記で定義されているとおりである）との反応により調製され得る（スキーム 1 を参照されたい）。

【 0 0 6 6 】

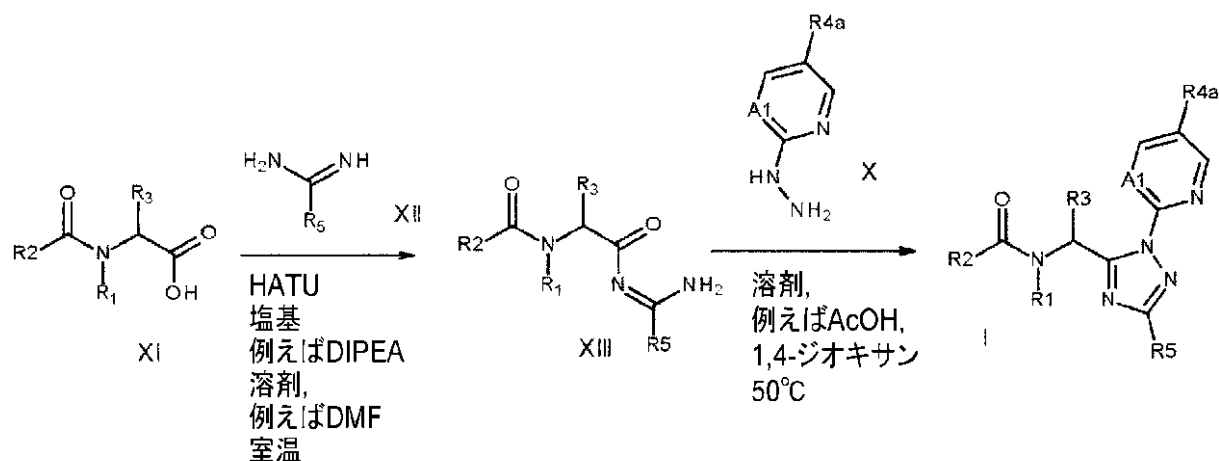
式 V I の化合物（ここで、 R_1 及び R_3 は、式 I について定義されているとおりである）は、例えば、アセトニトリル又はジオキサンを含む得る好適な溶剤中、ナトリウム、カリウム又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくはカリウム）などの好適な塩基の存在下における、通常、室温～150、好ましくは40～反応混合物の沸点の温度での加熱を伴う、任意にマイクロ波加熱条件下における、式 I V の化合物（ここで、 R_3 は、式 I において定義されているとおりである）と、式 V の化合物（ここで、 R_1 は、式 I において定義されているとおりである）との反応により調製され得る。

【 0 0 6 7 】

式 I a の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである）のさらに他の調製プロセスがスキーム 3 に概述される。

スキーム 3 .

【 化 1 3 】



【 0 0 6 8 】

式 I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_5 は、式 I について定義されているとおりである）は、例えば、酢酸を含む得る好適な溶剤中、通常、室温～120 の温度、好ましくは40～反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 X I I I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_5 は、式 I に定義されているとおりである）と、式 X の化合物（ここで、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I に定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、J . O r g . C h e m . 2 0 1 1 , 7 6 , 1 1 7 7 において以前に記載されている。

【 0 0 6 9 】

式 X I I I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_5 は、式 I に定義されているとおりである）は、例えば、HATUを含む得るカップリング剤の存在下、例えばDMFを含む得る好適な溶剤中、通常、室温～150 の温度、好ましくは20～反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 X I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I に定義されているとおりである）と、式 X I I の化合物（ここで、 R_5 は、上記に定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、J . O r g . C h e m . 2 0 1 1 , 7 6 , 1 1 7 7

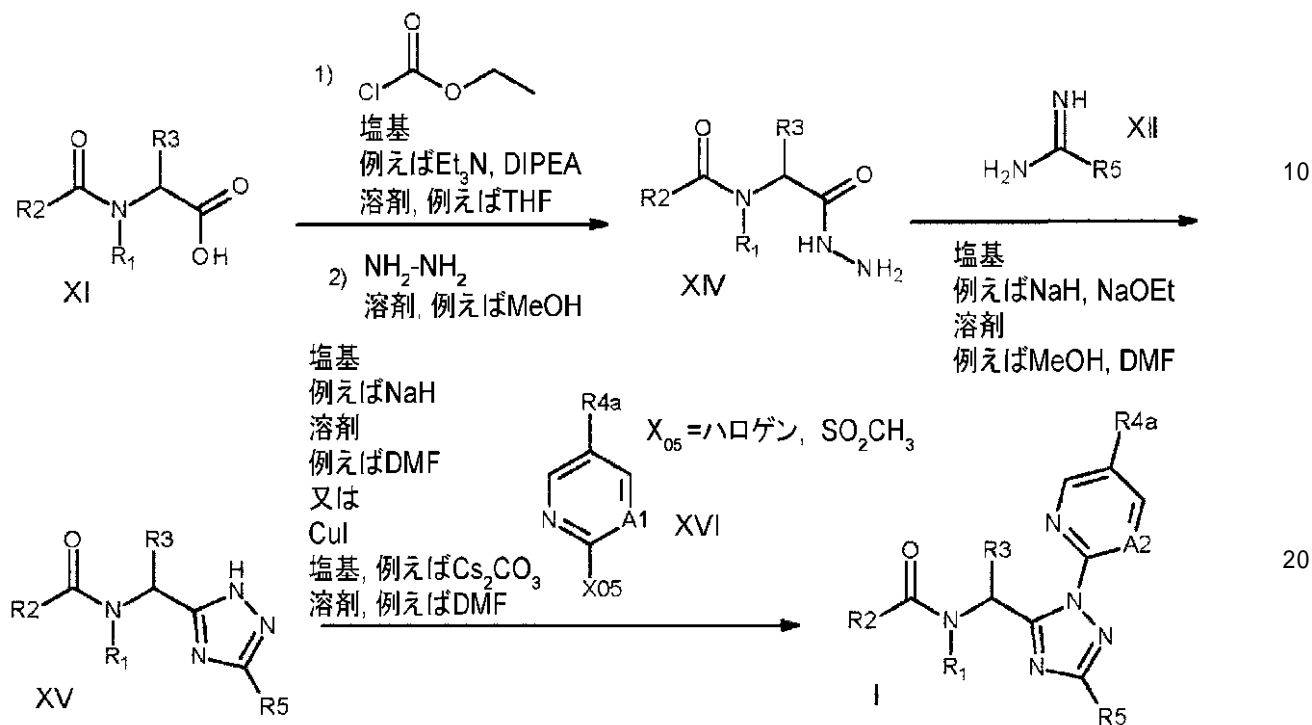
において以前に記載されている。

【0070】

式 I の化合物は、スキーム 4 に示されているプロセスによっても調製され得る。

スキーム 4 .

【化 1 4】



【0071】

例えば、式 I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりである）は、任意に、例えば CuI といった銅触媒の存在下、DMF 又は NMP などの好適な溶剤中及び水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温 ~ 200 の温度、好ましくは 20 ~ 反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 XV の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_5 は、式 I について上記に定義されているとおりである）と、式 XVI の化合物（ここで、 R_{4a} 、 A_1 は、式 I に定義されているとおりであり、及び X_{05} は、例えば、塩素、臭素、ヨウ素又はメチルスルホンなどの脱離基を表す）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Chem. Asian J. 2014, 9, 166 において以前に記載されている。

【0072】

式 XV の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_5 は、式 I について上記に定義されているとおりである）は、例えば、水素化ナトリウム又は NaOEt といった塩基の存在下、例えば DMF といった好適な溶剤中、通常、室温 ~ 150 の温度での加熱下における、式 XIV の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I について上記に定義されているとおりである）と、式 XII の化合物（ここで、 R_5 は、式 I について上記のように定義される）との反応により調製され得る（国際公開第 2017/191115 号の 32 ~ 33 ページ、Inorganica Chim. Acta 2010, 363, 2163 又は Angew. Int. Ed. 2017, 129, 9311 と同様）。

【0073】

式 XIV の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I について上記に定義されているとおりである）は、例えば、トリメチルアミン又は DIPEA といった塩基の存在下、例えばメタノール又はエタノールといった好適な溶剤中、通常、室温 ~ 150 の温度での

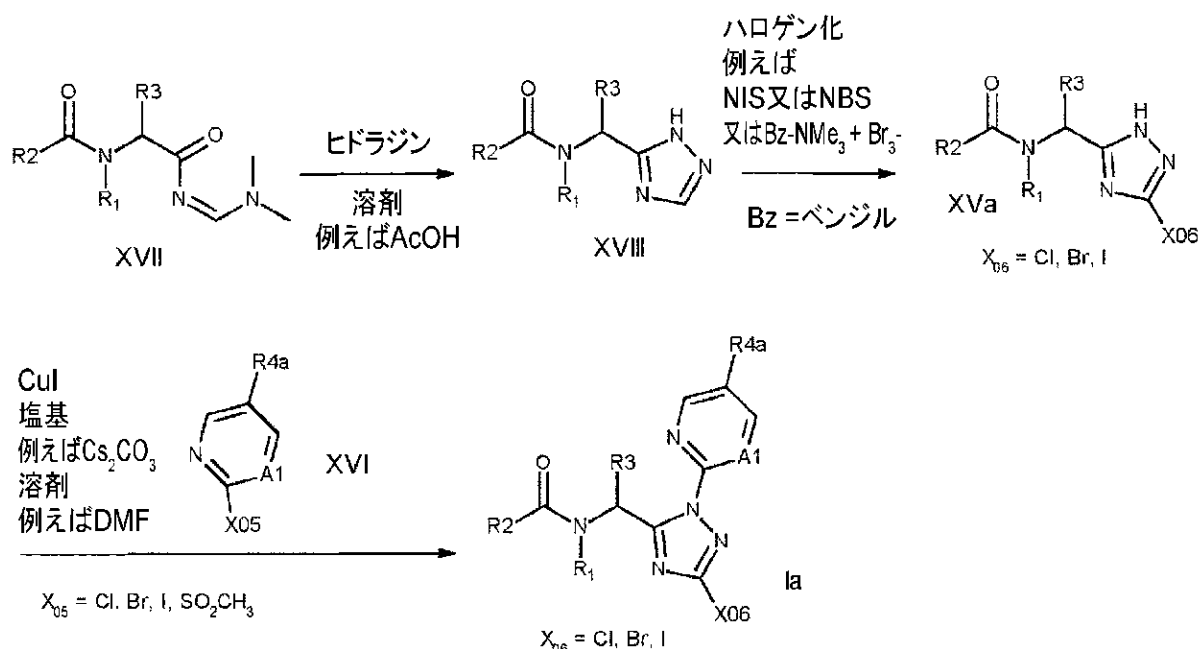
加熱下における、エチルクロロホルメート及びヒドラジンによる処理による式 X I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I について上記に定義されているとおりである）の反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、米国特許出願公開第 2 0 1 1 2 7 5 8 0 1 号明細書、第 6 8 欄において以前に記載されている。

【 0 0 7 4 】

式 I a の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）は、スキーム 5 に示されているプロセスによって調製され得る。

スキーム 5 .

【 化 1 5 】



【 0 0 7 5 】

従って、式 I a の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンを表す）は、任意に、例えば Cu I といった銅触媒の存在下、好ましくは DMF 又は NMP などの好適な溶剤中及び水素化ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温 ~ 2 0 0 の温度、好ましくは 2 0 ~ 反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 X V a の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 は、式 I について上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）と、式 X V I の化合物（ここで、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりであり、及び X_{05} は、例えば、塩素、臭素若しくはヨウ素といった脱離基又は SO₂CH₃を表す）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Chem. Asian J. 2 0 1 4 , 9 , 1 6 6 において以前に記載されている。

【 0 0 7 6 】

式 X V a の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I について上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである）は、例えば、CH₂Cl₂といった好適な溶剤中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム又は水酸化リチウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温 ~ 1 5 0 の温度、好ましくは 2 0 ~ 反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、例えばベンジルトリメチルアンモニウムトリブロミド、N - ヨードスクシンイミドなどのハロゲン化剤による式 X V I I I の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式 I について上

記に定義されているとおりである)のハロゲン化により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、米国特許出願公開第2014206700号明細書の37~38ページにおいて以前に記載されている。

【0077】

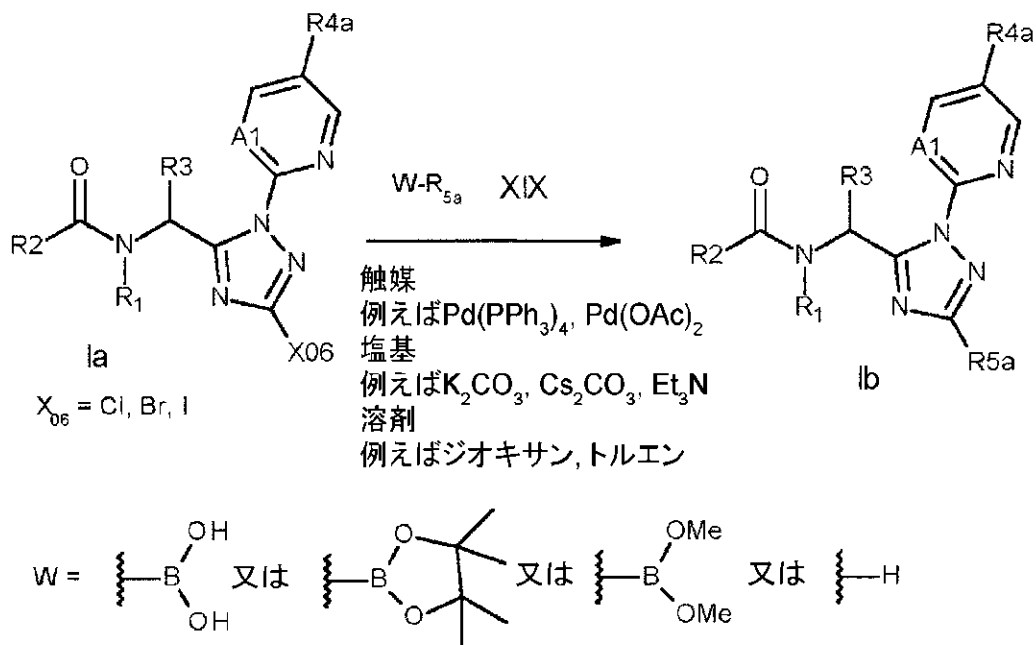
式XVIIの化合物(ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式Iについて上記に定義されているとおりである)は、例えば、酢酸、酢酸と1,4-ジオキサンとの混合物又は酢酸とトルエンとの混合物といった好適な溶剤中、通常、室温~120の温度、好ましくは40~反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式XVIIの化合物(ここで、 R_1 、 R_2 及び R_3 は、式Iについて上記に定義されているとおりである)とヒドラジンとの反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、J. Heterocyclic Chem. 2008, 45, 887及びBioorg. Med. Chem. Lett. 2015, 25, 5121において以前に記載されている。

【0078】

式Ibの化合物(ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iについて上記に定義されているとおりであり、及び R_{5a} は、ジフェニルメタンイミン、 C_3 ~ C_4 ハロシクロアルキル、 C_2 ~ C_6 アルケニル又は C_2 ~ C_6 ハロアルケニルである)は、スキーム6に示されているプロセスによって調製され得る。

スキーム6.

【化16】



【0079】

従って、式Ibの化合物(ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iについて上記に定義されているとおりであり、及び R_{5a} は、ジフェニルメタンイミン、 C_3 ~ C_4 ハロシクロアルキル、 C_2 ~ C_6 アルケニル又は C_2 ~ C_6 ハロアルケニルである)は、スキーム6に示されているとおり、式Iaの化合物(ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iについて上記に定義されているとおりであり、及び X_{06} は、塩素、臭素又はヨウ素などのハロゲンである)と、式XIXの化合物(ここで、 R_{5a} は、上記で記載されており、及びWは、ボロン酸又はボロン酸エステル又は水素である)との反応により調製され得る。これらの種の反応は、例えば、 $\text{Pd(PPh}_3)_4$ といったパラジウム触媒の存在下、ジオキサン又はトルエンなどの好適な溶剤中、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下において実施される。このような

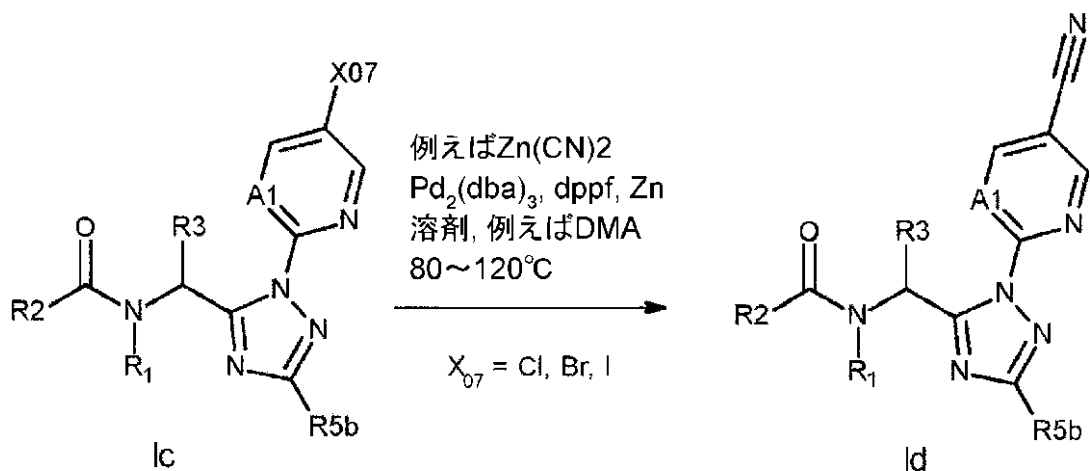
プロセスは、例えば、J. Med. Chem., 2014, 57, 3687-3706、Org. Lett. 2017, 19, 6594 及び Chemical Science 2016, 7, 6407 において同様に以前に記載されている。

【0080】

式 I d の各化合物を調製するためのさらなる方法がスキーム 7 に概述される。

スキーム 7 .

【化 17】



(スキーム2に従って調製, R5bはハロゲンではない)

【0081】

従って、式 I d の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりであり、及び R_{5b} は、式 I において定義されているとおりであるが、ハロゲンを除く（すなわちアミノ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル）アミノ、ヒドロキシ、シアノ、 $\text{C}_3 \sim \text{C}_4$ ハロシクロアルキル、 $\text{C}_2 \sim \text{C}_6$ ハロアルケニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルファニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルスルホニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルファニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルフィニル、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキルスルホニル、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル）スルホニルアミノ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル）スルホニル $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル）アミノ、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル） $\text{NHC}(\text{O})$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル） $_2\text{NC}(\text{O})$ 、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_6)$ シクロアルキル） $\text{NHC}(\text{O})$ 、 $(\text{C}_3 \sim \text{C}_6)$ シクロアルキル） $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル） $\text{NC}(\text{O})$ 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル） $\text{C}(\text{O})$ $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル） N 、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_3)$ アルキル） $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ 、ジフェニルメタンイミン又は $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルコキシ）は、例えば、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ といったパラジウム触媒の存在下、DMA 又は DMF などの好適な溶剤中、通常、 $80 \sim 120$ の温度、好ましくは 120 ~ 反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 I c の化合物と $\text{Zn}(\text{CN})_2$ との反応により入手され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron Lett. 2000, 41, 3271 及び Chem. Soc. Rev. 2011, 40, 5049 において以前に記載されている。

【0082】

式 I の化合物（ここで、 R_{4a} は、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ ハロアルコキシである）は、スキーム 8 に概述されているようにも調製され得る。

スキーム 8 :

10

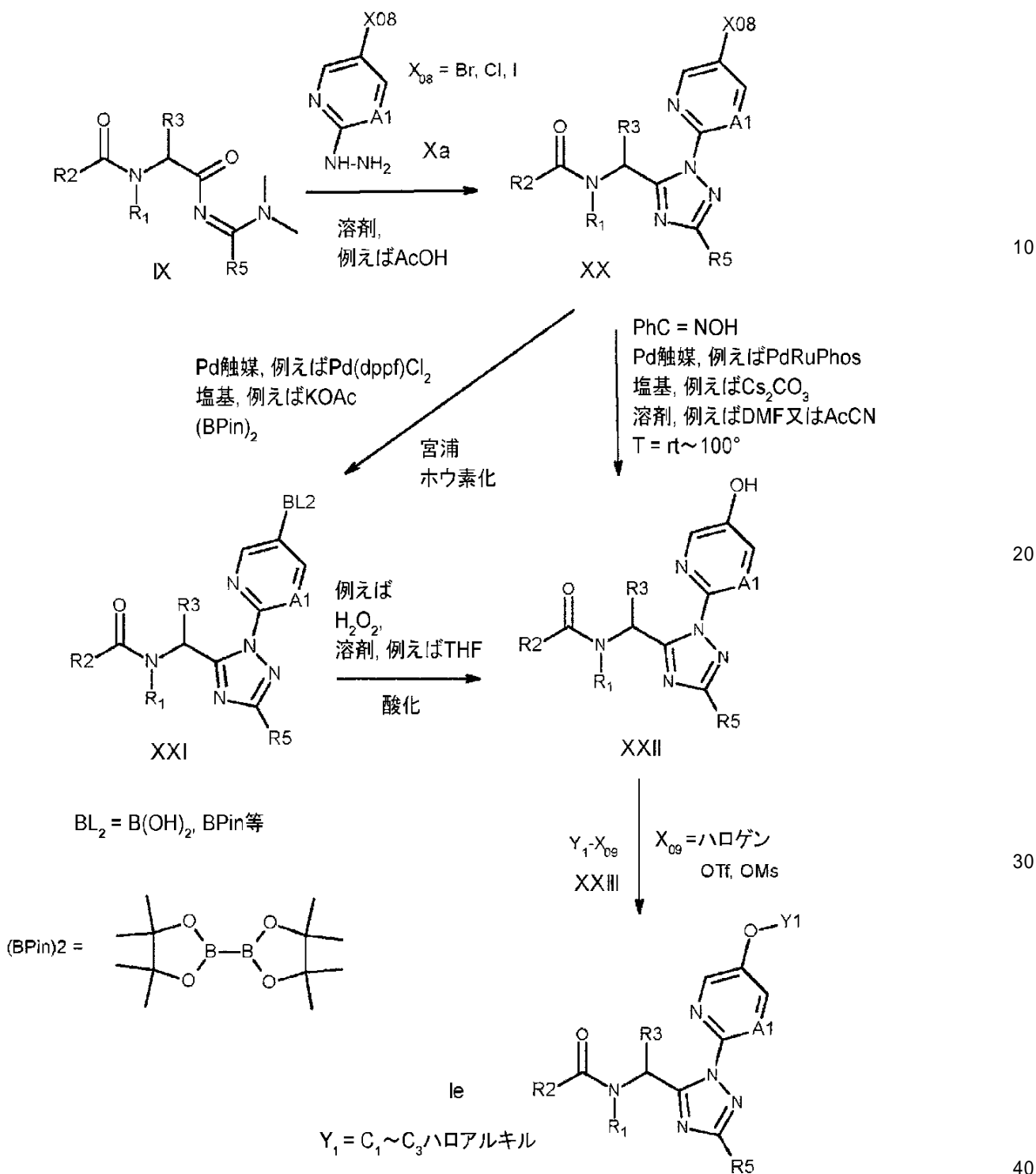
20

30

40

50

【化 1 8】



【0083】

従って、式Ieの化合物（ここで、R₁、R₂、R₃、R₅及びA₁は、式Iに定義されているとおりであり、及びY₁は、C₁～C₃ハロアルキルである）は、水素化ナトリウム、K₂CO₃又はCs₂CO₃などの塩基の存在下、THF、DMF又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中における一般式XXIII（ここで、X₀₉は、好ましくは、Cl、Br、F、I、OSO₂CF₃又はOSO₂CH₃などの脱離基であり、及びY₁は、C₁～C₃ハロアルキルである）をアルキル化試薬で処理して、式XXIIIの化合物から式Ieの化合物をもたらすことで調製可能である。このようなアルキル化反応は、当業者に周知である。

【0084】

10

20

30

40

50

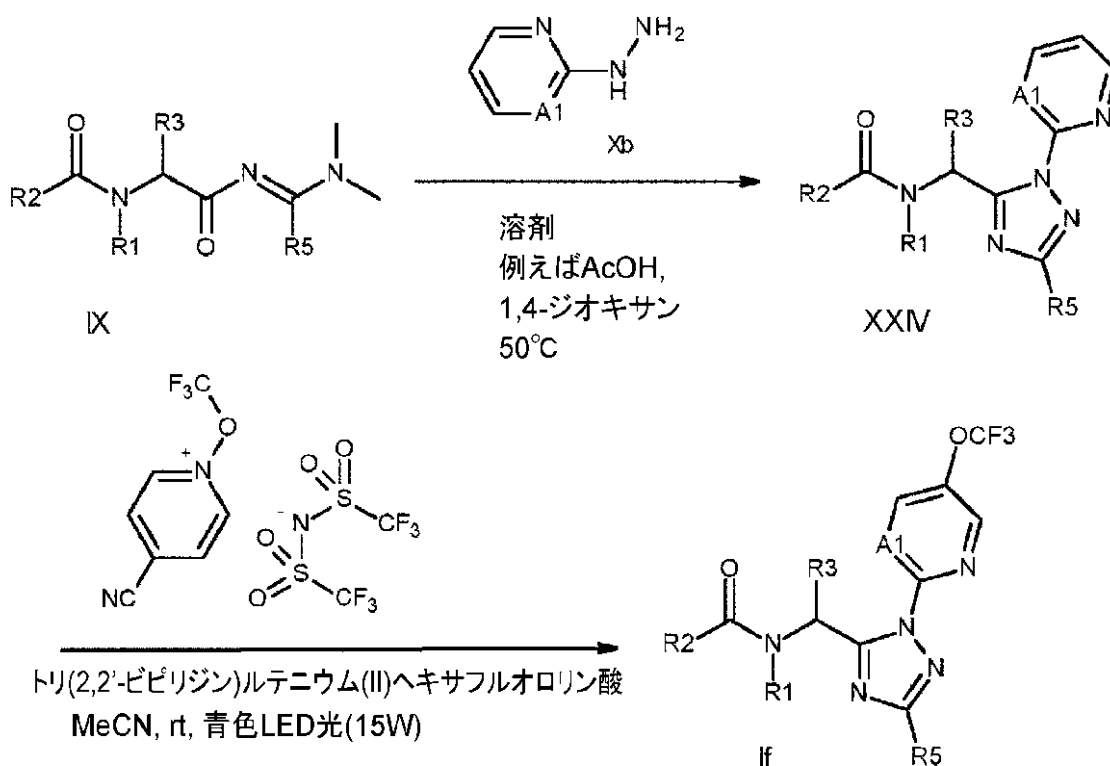
式XXIIの化合物は、式XXの化合物の宮浦ホウ素化、これに続く式XXIの中間体の酸化によって入手可能である。式XXIの中間体（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 及び A_1 は、式Iで定義されているとおりであり、及び BL_2 は、ボロン酸誘導体、好ましくは4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イルを表す）は、ビスピナコルジボラン（BPin）₂を伴うパラジウム触媒反応における、式XXの化合物（ここで、 X_{08} は、Cl、Br又はIなどの脱離基であり、及び R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 及び A_1 は、式Iで定義されているとおりである）の処理によって入手可能である。この反応は、非プロトン性溶剤中、塩基、好ましくは酢酸カリウムなどの弱塩基及びこの種の反応に係る一般的な触媒としてのPd(dppf)Cl₂の存在下において行うことが可能である。反応温度は、好ましくは、0～反応混合物の沸点である。得られた式XXIの中間体は、好ましくは、過酸化水素又はその尿素錯体といった酸化剤による処理によって式XXIIの化合物に転換可能である。式XXの化合物は、アセトニトリル又はDMFなどの非プロトン性溶剤中、炭酸カリウム又は炭酸セシウムなどの塩基の存在下、任意にRock Phos-G3-パラダサイクル（[(2-ジ-tert-ブチルホスフィノ-3-メトキシ-6-メチル-2',4',6'-トリイソプロピル-1,1'-ビフェニル)-2-(2-アミノビフェニル)]パラジウム(II)メタンスルホン酸）などのパラジウム触媒の存在下、25～100の温度における(E)-ベンズアルデヒドオキシムとの反応によっても式XXIIの化合物に転換され得る。このような反応は、文献において公知であり、例えばAng. Chem. Int. Ed. 56, (16) 4478-4482, 2017において記載されている。このようにして得られた式XXIIの化合物は、当業者に周知であると共に、上記で既述であるアルキル化法によって式Ieの化合物に転換される。

【0085】

R_{4a} がOCF₃である式Iの化合物、すなわち R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 及び A_1 が式Iで定義されている式Ifの化合物の調製は、スキーム9に従って調製可能である。

スキーム9.

【化19】



【0086】

スキーム9によれば、式Ifの化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 及び A_1 は、上記

のように定義され、及び R_{4a} は、トリフルオロメトキシである) は、アセトニトリルなどの不活性溶剤中における、トリス (2 , 2 ' - ビピリジン) ルテニウム (I I) ヘキサフルオロリン酸などの光酸化還元触媒による、青色 L E D 光 (1 5 W) の照射下及び 1 - (トリフルオロメトキシ) ピリジン - 4 - カルボニトリル ; 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - N (トリフルオロメチルスルホニル) メタンスルホンアミドなどのトリフルオロフルオロメトキシ移動試薬の存在下における化合物 X X I V (ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 及び A_1 は、上記に定義されているとおりである) の処理により調製可能である。このような反応は、20 で行われ、文献、例えば *Ang . Chem .* , 2 0 1 8 , 5 7 (4 2) , 1 3 7 8 4 - 1 3 7 8 9 に記載されている。

【 0 0 8 7 】

式 X X I V の化合物 (ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_5 及び A_1 は、式 I に定義されているとおりである) は、例えば、酢酸及び 1 , 4 - ジオキサンの混合物を含み得る好適な溶剤中、通常、室温 ~ 1 2 0 、好ましくは 4 0 ~ 反応混合物の沸点の温度、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式 X I I I の化合物 (ここで、 R_1 、 R_2 、 R_5 及び R_3 は、式 I に定義されているとおりである) と、式 X b の化合物 (ここで、 A_1 は、式 I において定義されている) との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、*Tetrahedron* 2 0 1 7 , 7 3 , 7 5 0 において以前に記載されている。

【 0 0 8 8 】

同様に、 R_5 がトリフルオロメトキシである式 I の化合物、すなわち式 I g の化合物は、アセトニトリルなどの不活性溶剤中における、トリス (2 , 2 ' - ビピリジン) ルテニウム (I I) ヘキサフルオロリン酸などの光酸化還元触媒による、青色 L E D 光 (1 5 W) の照射下及び 1 - (トリフルオロメトキシ) ピリジン - 4 - カルボニトリル ; 1 , 1 , 1 - トリフルオロ - N (トリフルオロメチルスルホニル) メタンスルホンアミドなどのトリフルオロフルオロメトキシ移動試薬の存在下における、化合物 X X V (ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりである) の処理によって調製可能である。このような反応は、20 で行われ、上記のとおり文献に記載されている。

スキーム 1 0 .

10

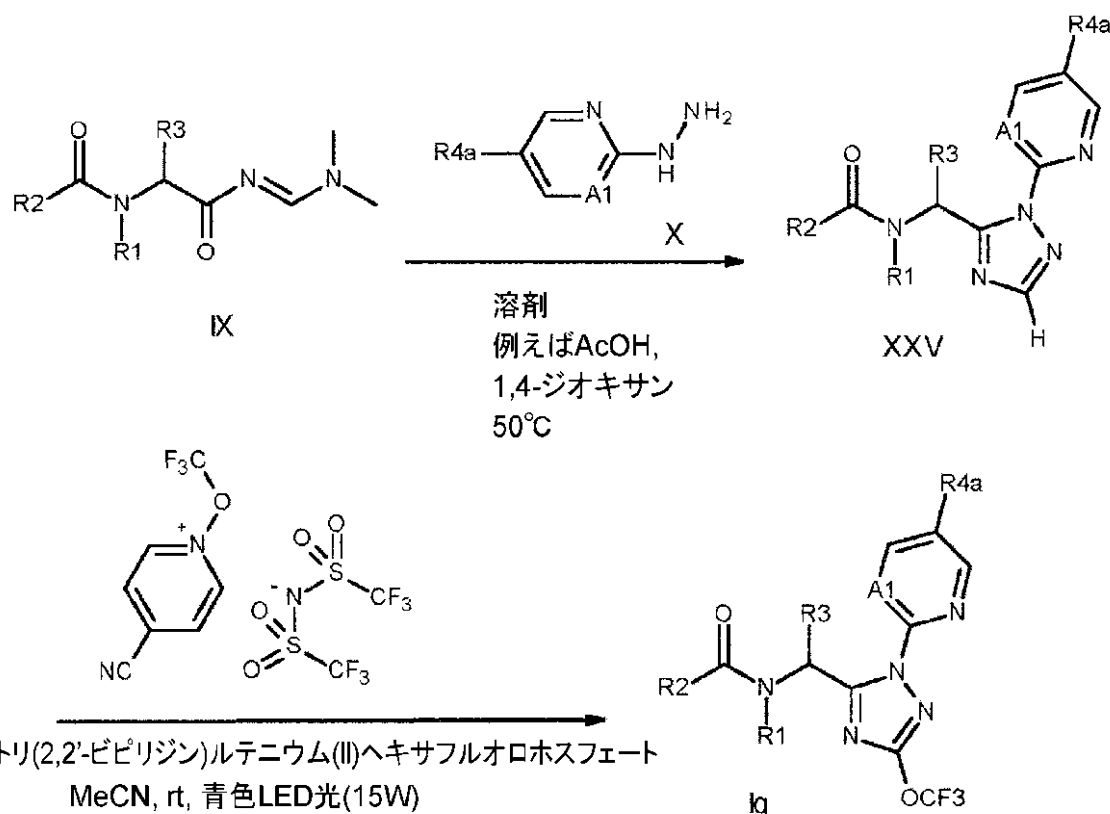
20

30

40

50

【化 20】



【0089】

式XXVの化合物（ここで、R₁、R₂、R₃、R_{4a}及びA₁は、式Iに定義されているとおりである）は、例えば、酢酸及び1,4-ジオキサンの混合物を含み得る好適な溶剤中、通常、室温～120℃、好ましくは40℃～反応混合物の沸点の温度、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式IXの化合物（ここで、R₁、R₂、R₃及びA₁は、式Iに定義されているとおりである）と、式Xの化合物（ここで、A₁及びR_{4a}は、式Iに定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750において以前に記載されている。化学は、スキーム10において記載されている（上記を参照されたい）。

【0090】

R₁、R₂、R₃、R_{4a}及びA₁が式Iについて上記に定義されているとおりであり、及びR₅がOCF₂Hである式Iの化合物、すなわち化合物Ihは、KOH又は炭酸カリウムなどの塩基の存在下、不活性溶剤中、20～80℃の温度における例えばClCF₂CO₂Na又はCF₂SO₂OC₂H₅といったジフルオロカルベン供給源による処理により、式Ijの化合物（ここで、R₁、R₂、R₃、R_{4a}及びA₁は、式Iについて上記に定義されているとおりである）から調製可能である（スキーム11）。このような手法は、例えば、J. Fluor. Chem. 2017, 203, 155及び米国特許出願公開第2013/0225552号明細書の128ページ並びにOrg. Process Res. Dev., 2011, 15, 721において記載されている。

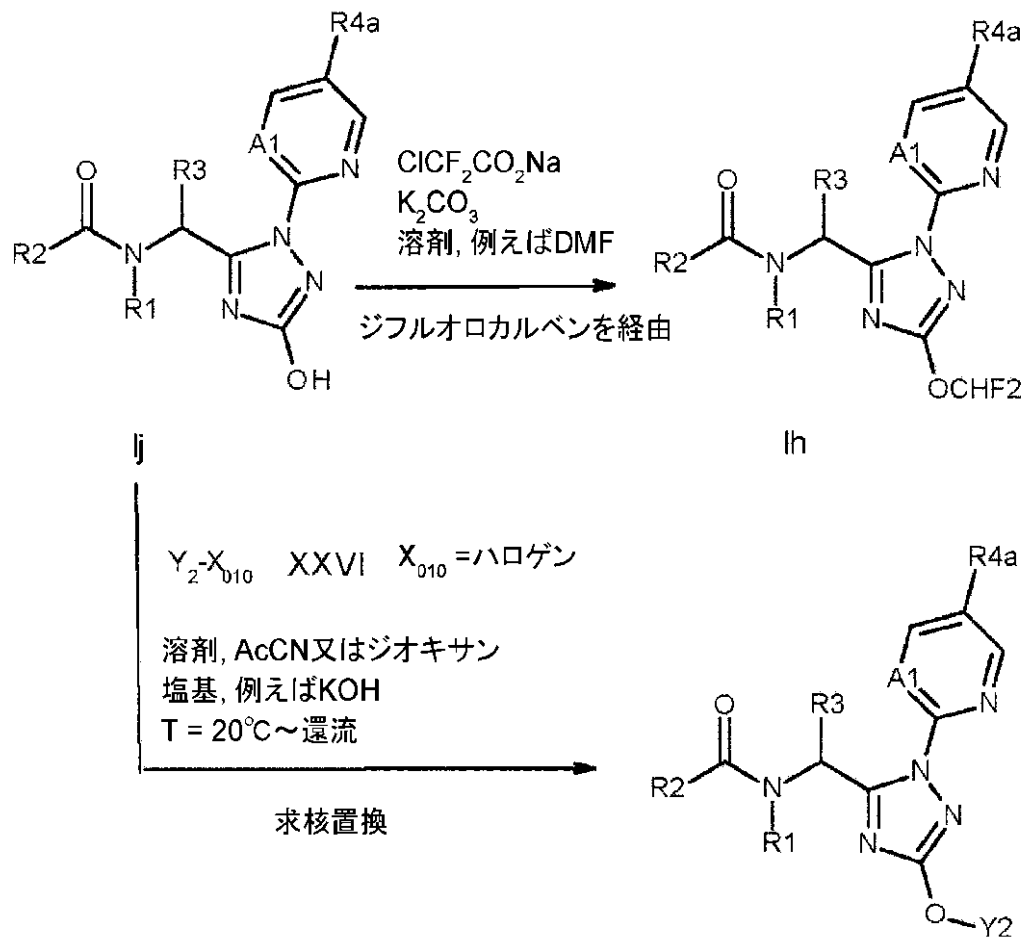
【0091】

式Ijの化合物（ここで、R₁、R₂、R₃、R_{4a}及びA₁は、式Iにおいて上記のように定義される）は、例えば、炭酸セシウム又は炭酸カリウムといった塩基の存在下、アセトニトリル又はDMなどの溶剤中、20～80℃の温度で式XXVIの化合物（ここで、X₁₀は、Cl、Br、Iなどのハロゲンであり、及びY₂は、C₁～C₃ハロアルキルである）によりハロアルキル化されて、式Iiの化合物を得ることが可能である。このような反応は、当業者に周知であって、以下において例えば報告されている：例えばMed. Ch

em. Letts., 2017, 8(5), p543-548及びBio. Med. Chem. Letts., 2017, 27(11), 2420-2423を参照されたい。

スキーム11.

【化21】



【0092】

式Ikの化合物(ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iにおいて記載されているとおりであり、及び Y_3 は、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである)は、不活性溶剤(アセトニトリル又はDMFなど)中において、25 ~ 120 の温度における、(bpy)CuSY₃(式XXVIIの化合物)(ここで、 Y_3 は、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルである)との反応によって調製可能である。このような化学は、公知であり、文献(Angew. Chem. Int. Ed., 2013, 52, 1548-1552)中において記載されている。式Ikの化合物は、当業者に公知の方法並びに国際公開第2013/018928号、国際公開第2012/086848号及び国際公開第2016/107831号に記載のものと同様の方法により、スキーム12に示されているとおり式Il及びImの化合物にさらに酸化され得る。

スキーム12.

10

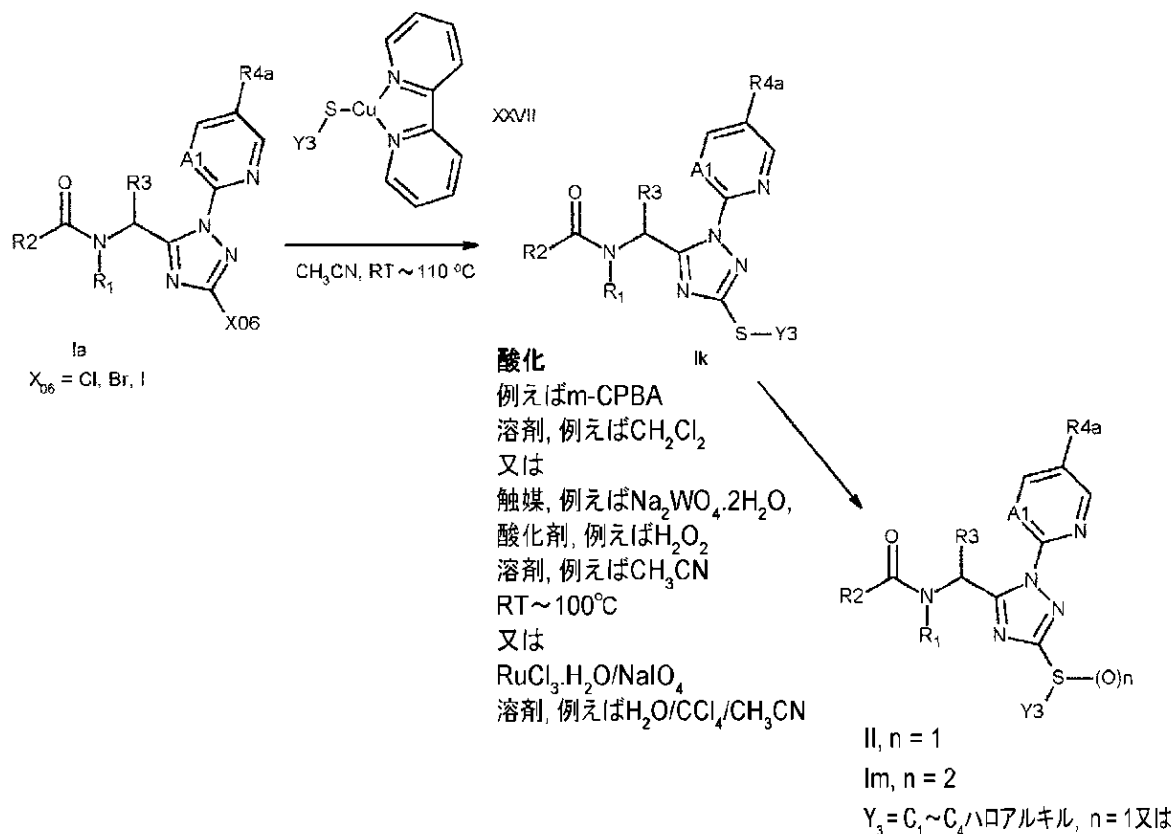
20

30

40

50

【化 2 2】



【0093】

従って、式 I k の化合物は、ジクロロメタン及びクロロホルムなどの不活性溶剤、メタノール及びエタノールなどのアルコール、酢酸、水並びにこれらの混合物中において、例えば m -クロロ過安息香酸で処理することで式 I l の化合物（ここで、 $n = 1$ ）に酸化可能である。この反応において用いられる酸化剤の量は、一般に、1モルの本化合物 I a に対して1～3モル、好ましくは1～1.1モルである。この反応の反応温度は、一般に、0～室温の範囲内である。式 I m（ここで、 $n = 2$ である）によって表される化合物は、 m -クロロ過安息香酸などの酸化剤の存在下、不活性溶剤中において化合物（I a）を反応させることにより生成され得る。この反応において用いられる溶剤の例としては、ジクロロメタン及びクロロホルムなどの脂肪族ハロゲン化炭化水素；メタノール及びエタノールなどのアルコール；酢酸；水；並びにこれらの混合物が挙げられる。この反応において用いられる酸化剤の例としては、 m -クロロ過安息香酸過酸化水素溶液が挙げられる。この反応において用いられる酸化剤の量は、1モルの本化合物（I a）に対して一般に1～4モル、好ましくは2～1モルである。この反応の反応温度は、一般に、0～室温の範囲内である。この反応は、触媒の存在下において実施され得る。この反応において用いられる触媒の例としては、タングステン酸ナトリウムが挙げられる。 Y_3 が $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルである SY_3 基は、酸化がより困難であり、従って、 $n = 2$ である I m の化合物は、一般に、 m -クロロ過安息香酸又は過酸化水素溶液などの酸化剤を伴って、例えばタングステン酸ナトリウムといった触媒の存在下でより高い温度を必要とする。酸化に係る程度及び位置は、酸化剤及び反応温度と等しい要因などに依存することを当業者は認識するであろう。生成物の混合物が形成された場合でも、これらは、結晶化又はクロマトグラフィ技術によって分離可能であり、また酸化に係る位置及び程度は、質量分光及びNMR技術などの分光法によって判定可能であることも当業者は認識するであろう。

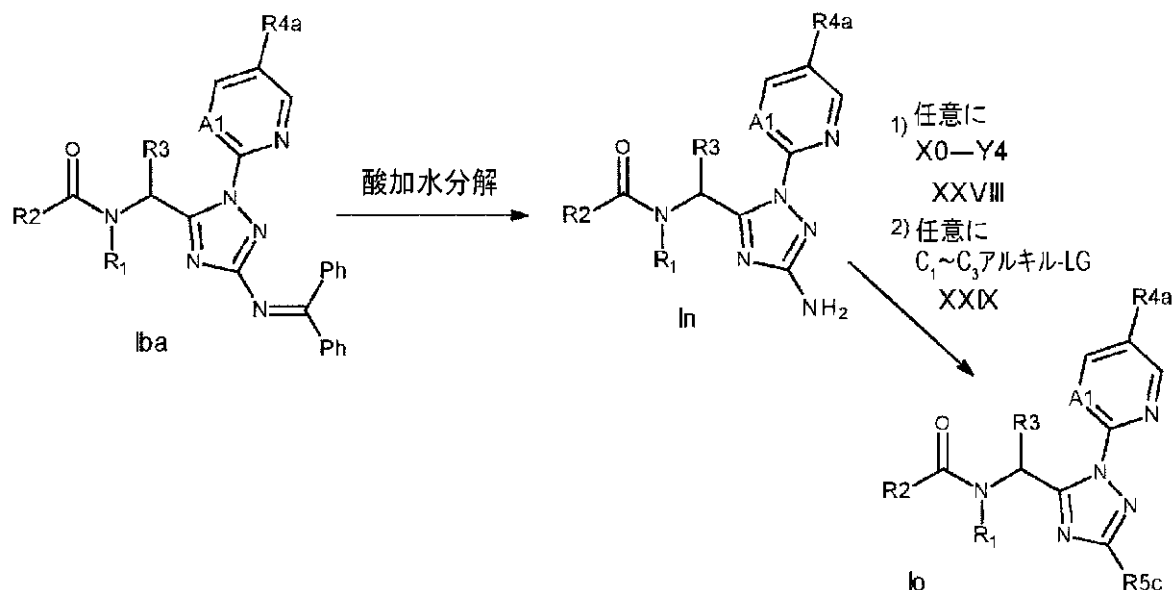
【0094】

式 I n 及び I o の化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりであり、及び R_{5c} （式 I o の場合）は、（ $\text{C}_1 \sim \text{C}_3$ アルキル）ア

ミノ、(C₁~C₃アルキル)スルホニルアミノ、(C₁~C₃アルキル)スルホニル(C₁~C₃アルキル)アミノ、(C₁~C₃アルキル)C(O)(C₁~C₃アルキル)N又は(C₁~C₃アルキル)C(O)NHである)は、当業者に周知であると共に、スキーム13に示されている合成方法により調製され得る。

スキーム13.

【化23】



【0095】

式Inの化合物(ここで、R₁、R₂、R₃、R_{4a}及びA₁は、式Iについて上記に定義されているとおりである)は、式Ibaの化合物(ここで、R₁、R₂、R₃、R_{4a}及びA₁は、式Iについて上記に定義されているとおりである)の変換によって調製可能である。この反応は、THFなどの好適な溶剤中、塩化水素又はクエン酸などの酸の存在下、通常、室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下において実施される。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2018/067432号又はEur. J. Med. Chem., 2018, 144, 151-163において以前に記載されている。

【0096】

式Ioの化合物(ここで、A₁、R₁、R₂、R₃、R_{4a}は、式Iについて上記に定義されているとおりであり、及びR_{5c}は、(C₁~C₃アルキル)アミノ、(C₁~C₃アルキル)スルホニルアミノ、(C₁~C₃アルキル)スルホニル(C₁~C₃アルキル)アミノ、(C₁~C₃アルキル)C(O)(C₁~C₃アルキル)N又は(C₁~C₃アルキル)C(O)NHである)は、化合物In(ここで、A₁、R₁、R₂、R₃、R_{4a}は、式Iについて上記に定義されているとおりである)と、化合物XXVII(ここで、X₀は、スキーム2に記載されていると共に、スキーム2に記載されているとおりX₀₁、X₀₂、X₀₃及びX₀₄もあり得、及びY₄は、(C₁~C₃アルキル)、(C₁~C₃アルキル)スルホニル又は(C₁~C₃アルキル)C(O)である)との反応により調製され得る。この反応は、ジクロロメタン又はDMFなどの好適な溶剤中、トリメチルアミン又はピリジンなどの好適な塩基の存在下、通常、室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下において実施される。得られる化合物は、この後者をTHF又はDMFなどの好適な溶剤中、水素化ナトリウムなどの好適な塩基の存在下、通常、室温~200の温度、好ましくは20~反応混合物の沸点の温度での加熱下において、化合物XXIX(ここで、LGは、塩素、メシルオキシ又はトシルオキシなどの脱離基である)で処理することにより、任意に第2のステップにおいてアルキル化が可能である。第1のステップは、任意であり、従って、化合物Inは、XXIXとの反応に直接使用が可能である。この

ような変換は、当業者により容易に実施されるか、又は国際公開第2010010186号若しくはEur. J. Med. Chem., 2013, 67, 243-251に記載の注意を伴って実施される。

【0097】

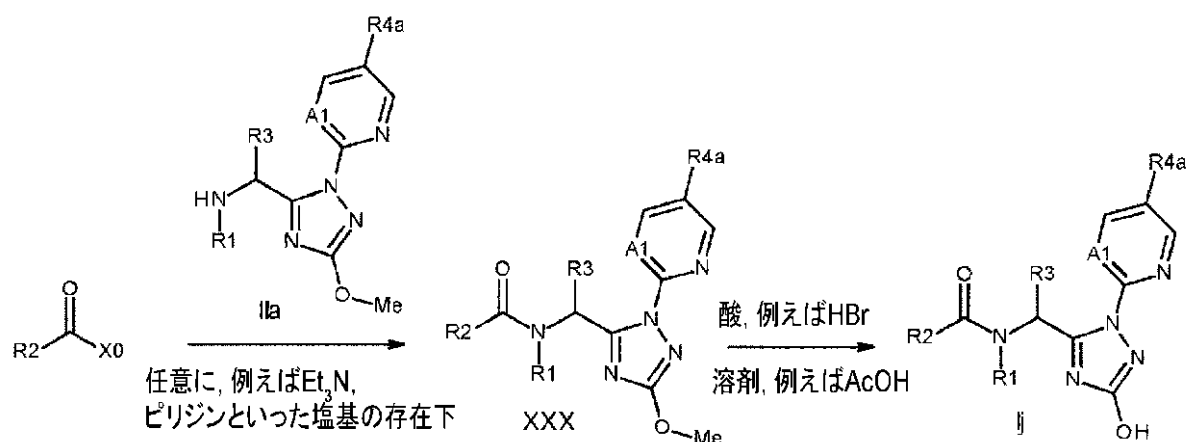
式Iの化合物の調製に関して記載された中間体は、公知であるか、又は下記のとおりに記載される方法により調製可能である。

【0098】

式Ijの化合物（ここで、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iについて上記に定義されているとおりである）は、例えば、酢酸を含み得る好適な溶剤中、通常、室温～200の温度、好ましくは20～反応混合物の沸点の温度での加熱下における、化合物XX
X（ここで、 A_1 、 R_1 、 R_2 、 R_3 及び R_{4a} は、上記の式Iのとおり定義される）と、例えばHBrといった酸との反応により調製され得る（スキーム14）。このようなプロセスは、例えば、国際公開第2017090743号において以前に記載されている。

スキーム14：

【化24】



【0099】

式IIの中間体（ここで、 R_1 、 R_3 、 R_5 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iに定義されているとおりである）を合成するためのプロセスは、一部公知であるか（国際公開第2017/192385号の24～30ページを参照されたい）、又は当業者によって容易に調製可能である。このような中間体に対する典型的な合成経路がスキーム15に概述される。

スキーム15。

10

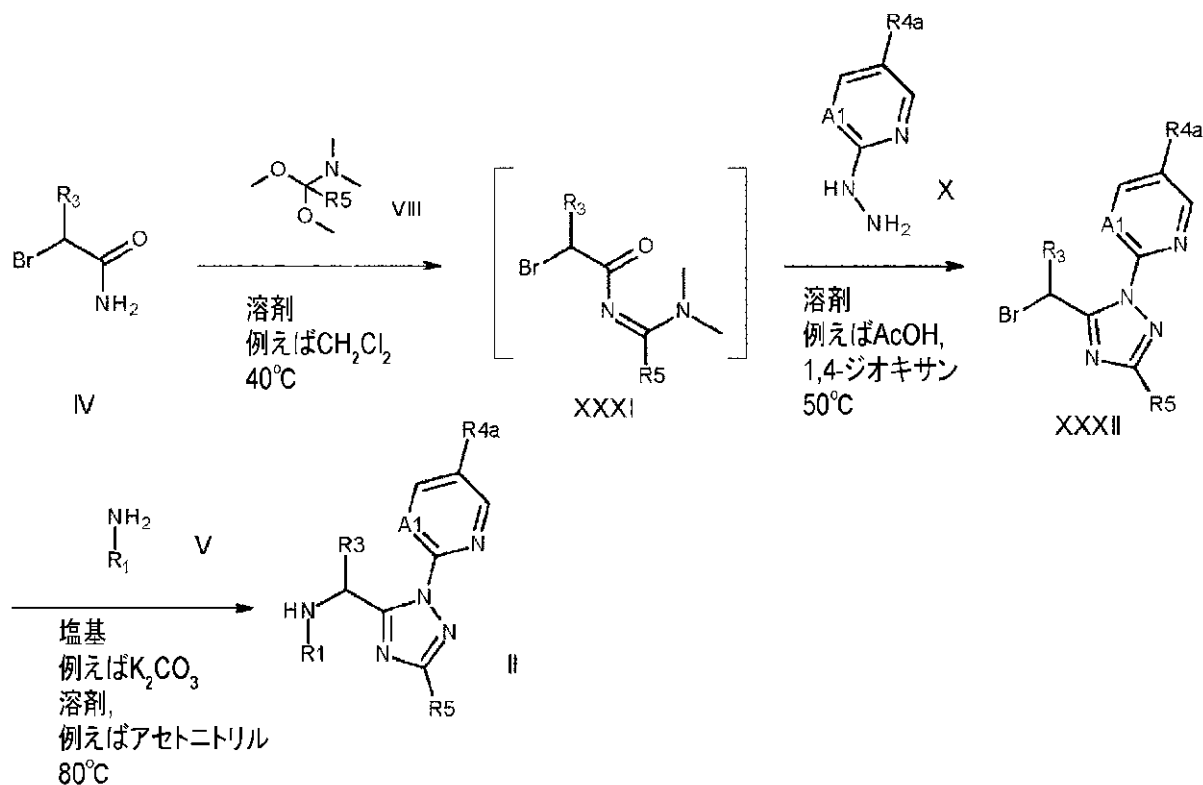
20

30

40

50

【化 2 5】



【0100】

例えば、式IIの化合物は、例えば、アセトニトリル又はジオキサンといった好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム）などの好適な塩基の存在下、通常、室温～150、好ましくは40～還流温度の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式XXXIIの化合物（ここで、 R_3 、 R_5 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iに定義されているとおりである）と、式Vの化合物（ここで、 R_1 は、式Iにおいて定義されている）との反応により調製され得る。

30

【0101】

式XXXIIの化合物（ここで、 R_3 、 R_{4a} 、 R_5 及び A_1 は、式Iに定義されているとおりである）は、例えば、酢酸及び1,4-ジオキサンの混合物といった好適な溶剤中、通常、室温～120の温度、好ましくは40～反応混合物の沸点の温度における、任意にマイクロ波による加熱条件下での加熱下における、式XXXIの化合物（ここで、 R_3 及び R_5 は、式Iにおいて定義されているとおりである）と、式Xの化合物（ここで、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iに定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750において以前に記載されている。

40

【0102】

式XXXIの化合物（ここで、 R_3 及び R_5 は、式Iにおいて上記に定義されているとおりである）は、例えば、ジクロロメタンといった好適な溶剤中、通常、室温～150、好ましくは40～反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式IVの化合物（ここで、 R_3 は、式Iにおいて定義されているとおりである）と、式VIIIの化合物（ここで、 R_5 は、式Iにおいて上記に定義されているとおりである）との反応により調製され得る。このようなプロセスは、例えば、Tetrahedron 2017, 73, 750において以前に記載されている。

【0103】

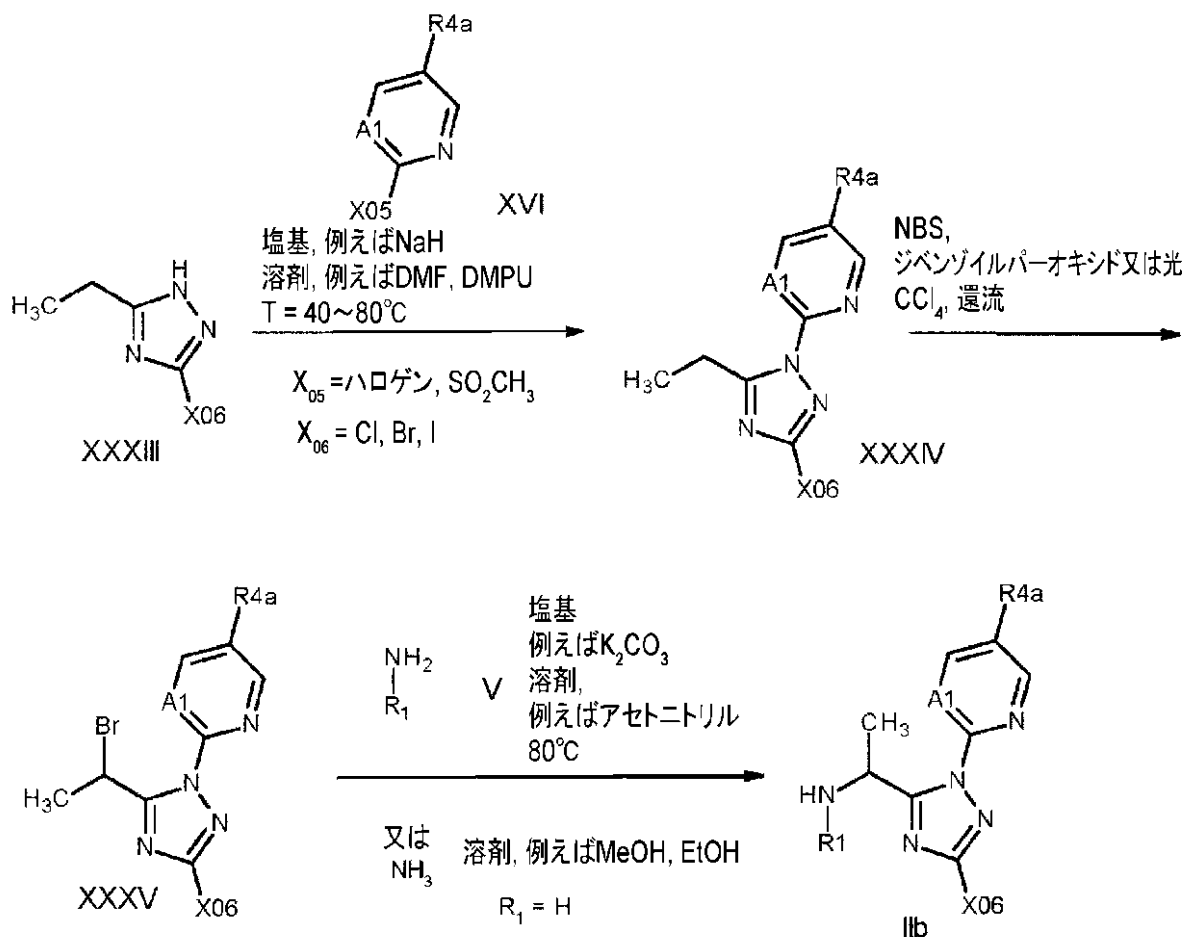
式IIbの化合物（ここで、 R_1 、 R_{4a} 及び A_1 は、式Iに定義されているとおりであり

50

、及びX₀₆は、塩素、臭素又はヨウ素である)は、スキーム16に記載されているとおり調製可能である。

スキーム16:

【化26】



【0104】

従って、式XXXIIIの化合物(ここで、X₀₆は、塩素、臭素又はヨウ素である)を、好ましくはNaHといった塩基の存在下、例えばDMF又はDMPUといった非プロトン性溶剤中において、式XVIの化合物(ここで、R_{4a}及びA₁は、式Iについて上記に定義されているとおりであり、及びX₀₅は、例えば、ハロゲン又はメチルスルホンといった脱離基である)で処理して、一般式XXXIVの化合物が得られる(Chem. Ber. 1967, 100, 2250のとおり)。公知の条件下(米国特許第4295876号明細書の14~15ページと同様)における式XXXIVの化合物のその後のベンジル臭素化で式XXXVの化合物(ここで、R_{4a}、X₀₆及びA₁は、式Iについて上記に定義されているとおりである)がもたらされる。最後に、任意にマイクロ波による加熱条件下における、式XXXVの化合物と、R₁が、上記に定義されているとおりである式Vのアミノニア(例えば、国際公開第2017/192385号の30ページを参照されたい)又はアミン(国際公開第2008/017932号の53ページと同様)との反応で式IIbの化合物が得られる。

【0105】

式IIaの中間体の調製がスキーム17に概述される。

スキーム17:

10

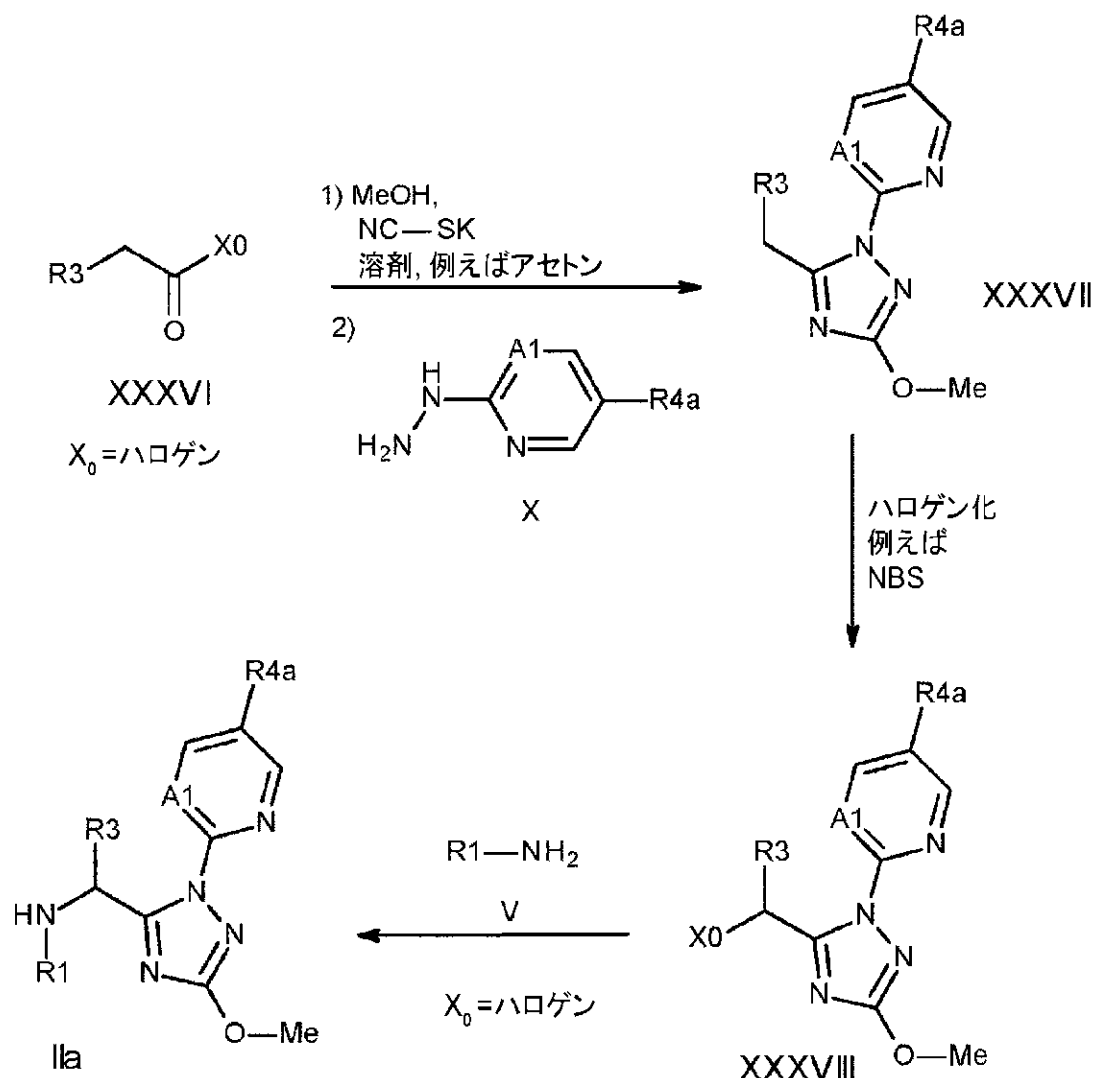
20

30

40

50

【化 2 7】



10

20

30

【 0 1 0 6】

従って、式 XXXVII の化合物（ここで、 R_3 、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりである）は、アセトンなどの好適な溶剤中、通常、室温～200 の温度、好ましくは 20 ～ 反応混合物の沸点の温度での加熱下における、式 XXXVI の化合物（ここで、 R_3 は、式 I について上記のように定義され、及び X_0 は、例えば、臭素、塩素又はヨウ素といったハロゲンである）と、カリウムチオシアネート及びメタノールとの反応により 2 段階で調製され得る。次いで、得られる中間体を、例えばエタノールなどの好適な溶剤中、通常、室温～200 の温度、好ましくは 20 ～ 反応混合物の沸点の温度での加熱下における式 X の化合物（ここで、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりである）を伴う第 2 のステップに供して、式 XXXVII の化合物が得られる。例えば、 CH_2Cl_2 を含む好適な溶剤中、過酸化ベンゾイルなどの好適な活性化剤の存在下、通常、室温～200 の温度、好ましくは 20 ～ 反応混合物の沸点の温度での加熱下、任意に白色光ランプ（230V）下における、例えば N - ブロモ - ハロスクシンイミドなどのハロゲン化剤による式 XXXVII の化合物の処理で式 XXXVIII の化合物が得られる。このようなプロセスは、以前に記載されており、このようなプロセスは、例えば、独国特許出願公開第 1962429 号明細書において以前に記載されている。例えば、アセトニトリル又はジオキサンを含む好適な溶剤中、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム又は炭酸セシウム（又は炭酸水素ナトリウム若しくは炭酸水素カリウム）などの好適な塩基の存在下、室温～200、好ましくは室温～40 の温度、

40

50

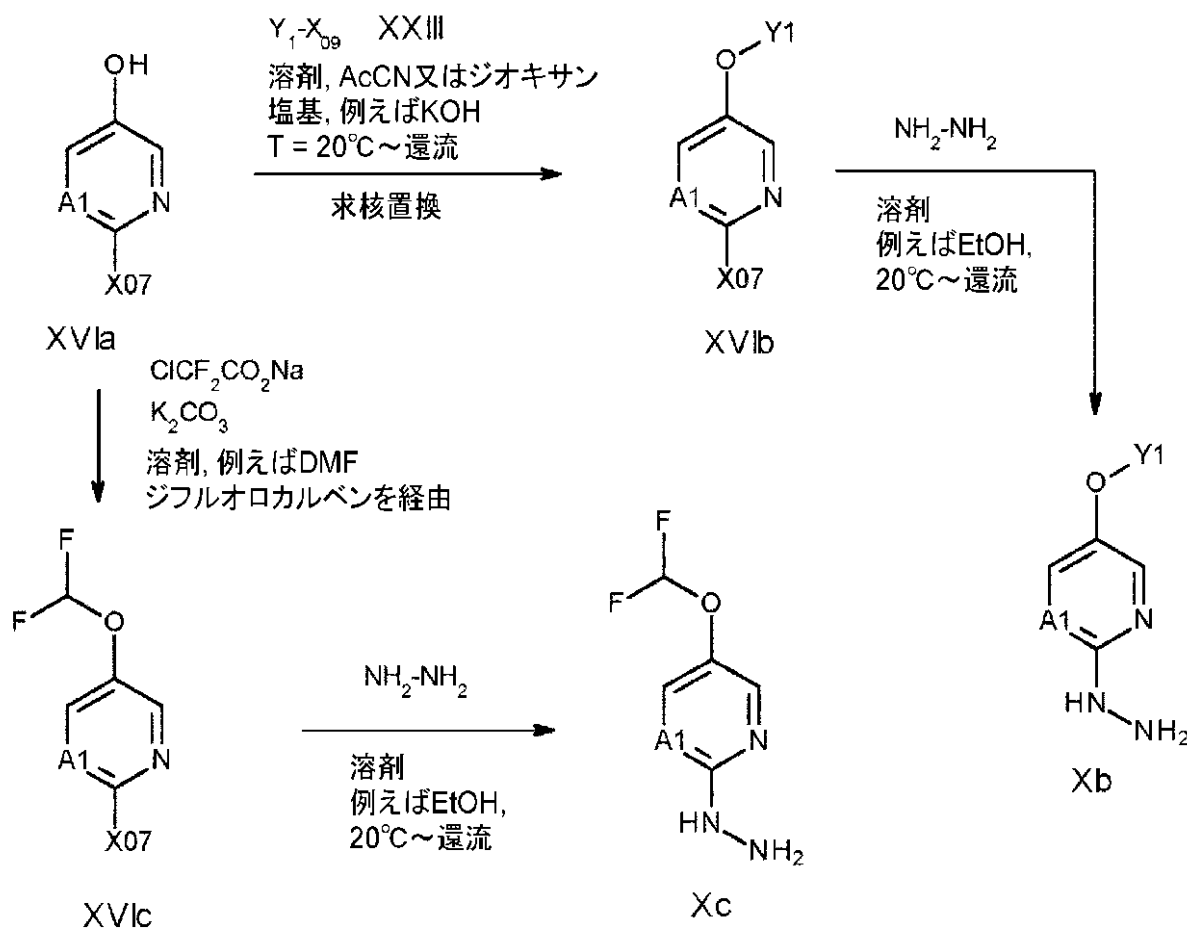
任意にマイクロ波による加熱条件下での式 $XXVII$ の化合物と、式 V の化合物（ここで、 R_1 は、式 I において定義されている）との反応で式 IIa の化合物がもたらされる。

【0107】

式 X のヒドラジン（ここで、 R_{4a} 及び A_1 は、式 I について上記に定義されているとおりである）は、市販されているか、又は周知の方法に従って若しくはスキーム 18 に示されているとおり調製可能である。

スキーム 18

【化 28】



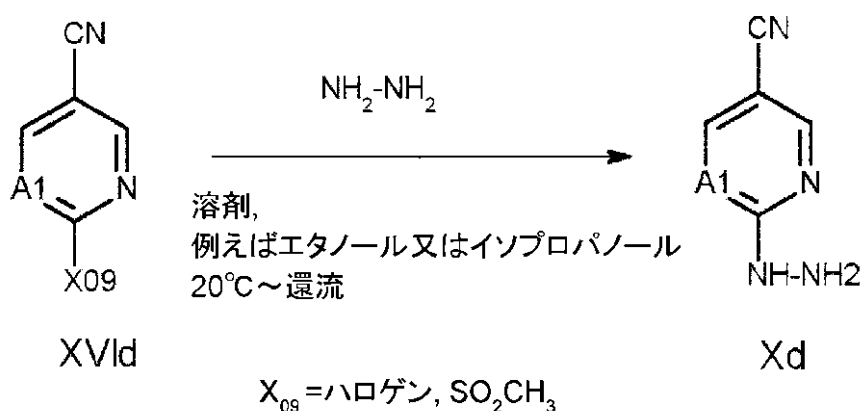
【0108】

従って、式 $XVIIa$ の化合物（ここで、 A_1 は、 N 又は CH であり、及び X_{07} は、 Cl 、 Br 、 F 、 I 又はメチルスルホンなどの脱離基である）は、例えば、炭酸セシウム又は炭酸カリウムといった塩基を伴って、アセトニトリル又はDMなどの溶剤中、 $20 \sim 80$ の温度で式 $XXII$ の化合物（ここで、 Y_1 は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり、及び X_{09} は、 Cl 、 Br 、 F 、 I 、 OSO_2CF_3 又は OSO_2CH_3 などの脱離基である）によりアルキル化されて、式 $XVIIb$ の化合物（ここで、 A_1 及び X_{07} は、以前に定義されているとおりであり、及び Y_1 は、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルである）をもたらすことが可能である。このような反応は、当業者に周知であると共に、例えば以下において報告されている：例えば *Med. Chem. Letts.*, 2017, 8(5), p 543 - 548 及び *Bio. Med. Chem. Letts.*, 2017, 27(11), 2420 - 2423 を参照されたい。式 $XVIIb$ の化合物は、例えば、エタノール、水性ジオキサンといった好適な溶剤中、 $20 \sim 80$ の温度においてヒドラジンで処理することで式 Xb の化合物（ここで、 Y_1 及び A_1 は、既述のとおりである）を得ることが可能である。同様の反応は、例えば、*J. Med. Chem.*, 2018, 61(1), 207 - 223 及び *Bi*

o. Med. Chem. Lett s., 2017, 27(21), 4858-4866において以前に記載されている。R_{4a}がOCHF₂である式XV I cの化合物は、KOH、炭酸カリウム等などの塩基の存在下、不活性溶剤中、20～80の温度における、例えばC1CF₂CO₂Na又はCF₂SO₂OCHF₂といったジフルオロカルベン供給源による処理によって式XV I aの化合物から調製可能である。このような手法は、例えば、J. Fluor. Chem. 2017, 203, 155及び米国特許出願公開第2013/0225552号明細書の128ページ並びにOrg. Process Res. Dev., 2011, 15, 721において記載されている。式XV I bの化合物(ここで、A₁は、式Iについて上記のように定義され、及びX₀₇は、ハロゲン又はメチルスルホンを表す)は、以前に考察されているとおり、ヒドラジンとの反応に供されて、式X cの化合物がもたらされる。A₁が式Iについて上記に定義されている式X dのヒドラジンは、以前にスキーム18において記載されているものときわめて同様に調製可能である。従って、スキーム19に示されているとおり、式XV I dの化合物(ここで、A₁は、式Iについて上記に定義されているとおりであり、及びX₀₉は、ハロゲン又はメチルスルホンを表す)は、好適な溶剤中、好ましくはエタノール又はイソプロパノール中、20～還流条件の温度でヒドラジンとの反応に供されて、式X dの化合物が得られる(例えば、Tet. Lett. 2016, 57, 1056を参照されたい)。

スキーム19

【化29】



【0109】

式I I Iの化合物は、公知であり、市販されているか又は当業者によって調製可能である、例えば3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)安息香酸CAS: [2248290-21-1]、3-ブromo-5-(トリフルオロメチル)安息香酸CAS: [328-67-6]、3-ヨード-5-(トリフルオロメチル)安息香酸、CAS: [28186-62-1]である。例えば、国際公開第2013/171712号、国際公開第2012/117000号、国際公開第2017/192385号も参照されたい。いくつかの式I I Iの化合物は、新規であり、式Iの化合物の調製を可能とするために特別に調製される。このような化合物の合成がスキーム20に示される。

スキーム20

10

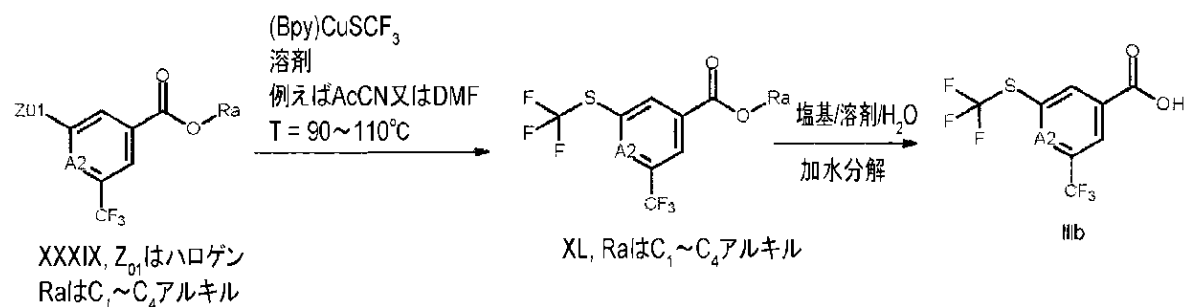
20

30

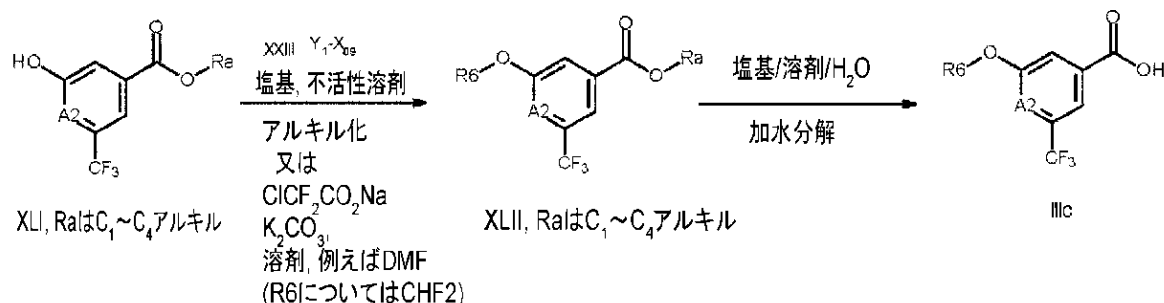
40

50

【化 3 0】



10



【 0 1 1 0】

20

スキーム 20 に示されているとおり、式 XXXIX の化合物（ここで、Z₀₁ は、好ましくは、臭素又はヨウ素といったハロゲンであり、A₂ は、窒素又は CH であり、及び Ra は、C₁~C₄ アルキルである）は、アセトニトリル又は DMF などの不活性溶剤中、室温~120 の温度、任意にマイクロ波による加熱下において、bpy がピピリジルであるピピリジン銅試薬 (bpy)CuSCF₃ で処理されて、式 XL の化合物（ここで、A₂ 及び Ra は、以前に定義されているとおりである）が得られる。このような化学は、公知であると共に、例えば Angew. Chem. Int. Ed. 2013, 52, 1548-1552 といった文献において記載されている。この変換に係る好ましい試薬は、(bpy)CuSCF₃ (CAS [1413732-47-4]) である。式 XL の化合物は、水中、任意に THF、アセトン、ジオキサン等などの水和性溶剤の存在下における、例えば水酸化リチウム、水酸化カリウム又は水酸化ナトリウムといった塩基を伴う反応といったエステル加水分解により例えば式 IIIb の化合物に転換される。このような反応は、当業者に周知である。

30

【 0 1 1 1】

式 XLI の化合物（ここで、A₂ は、窒素又は CH であり、R₆ は、C₁~C₃ ハロアルキルであり、及び Ra は、C₁~C₄ アルキルである）は、水素化ナトリウム、K₂CO₃ 又は Cs₂CO₃ などの塩基の存在下、THF、DMF 又はアセトニトリルなどの不活性溶剤中における、式 XLI の化合物と、式 XXIII の化合物（ここで、X₀₉ は、Cl、Br、F、I、OSO₂CF₃ 又は OSO₂CH₃ であり、及び Y₁ は、C₁~C₃ ハロアルキルである）との反応により調製可能である。式 XLI の化合物（ここで、R₆ は、CHF₂ である）は、以前に記載されている手法と同様に、インサイチュで生成されたジフルオロカルベンによる処理により調製される。式 IIIc の化合物が得られる式 XLI の化合物の加水分解は、上記のとおりである。

40

【 0 1 1 2】

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

50

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。

10

【0113】

反応剤は、そのまま、すなわち溶媒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、不活性溶媒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、溶媒又は希釈剤としての役割も果たし得る。

【0114】

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 の範囲で行われるのが有利である。

【0115】

20

それぞれ好適な反応条件及び出発材料の選択に応じて、例えば1つの反応工程において、1つの置換基を本発明に係る別の置換基で単に置換することが可能であるか、又は複数の置換基は、同じ反応工程において、本発明に係る他の置換基で置換され得る。

【0116】

式Iの化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。従って、例えば、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、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。

【0117】

式Iの化合物の塩は、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慣例的な方法で転化され得る。

30

【0118】

式Iの化合物の塩は、例えば、塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、従って反応混合物から沈殿する好適な溶媒中において、例えば塩酸塩などの無機酸塩を酸のナトリウム塩、バリウム塩又は銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することにより、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化され得る。

【0119】

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。

【0120】

40

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において、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、或いは鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物又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つの形態で又はこれらの混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、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。

【0121】

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

50

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において、例えば分別結晶化、蒸留及び／又はクロマトグラフィにより、成分の物理化学的差異に基づいて純粋なジアステレオマー又はラセミ体に公知の方法で分離され得る。

【 0 1 2 2 】

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、例えば好適な微生物を用いたアセチルセルロースにおける高速液体クロマトグラフィ（HPLC）により、例えば1つのみの鏡像異性体が複合されるキラルクラウンエーテルを用いた、包接化合物の形成を介した特定の固定化酵素による開裂により、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。

10

【 0 1 2 3 】

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。

【 0 1 2 4 】

20

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。

【 0 1 2 5 】

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。

【 0 1 2 6 】

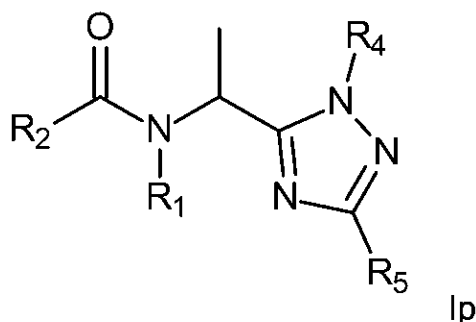
式 I の化合物及び必要に応じてその互変異性体は、それぞれ遊離形態又は塩形態において、必要に応じて水和物の形態において得ることもでき、且つ／又は他の溶媒、例えば固体形態で存在する化合物の結晶化に使用され得た溶媒を含む。

30

【 0 1 2 7 】

以下の表 A - 1 ~ A - 297 による式 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、本発明を例示することが意図されており、式 I p の化合物の形態で好ましい式 I の化合物を示す。

【 化 3 1 】



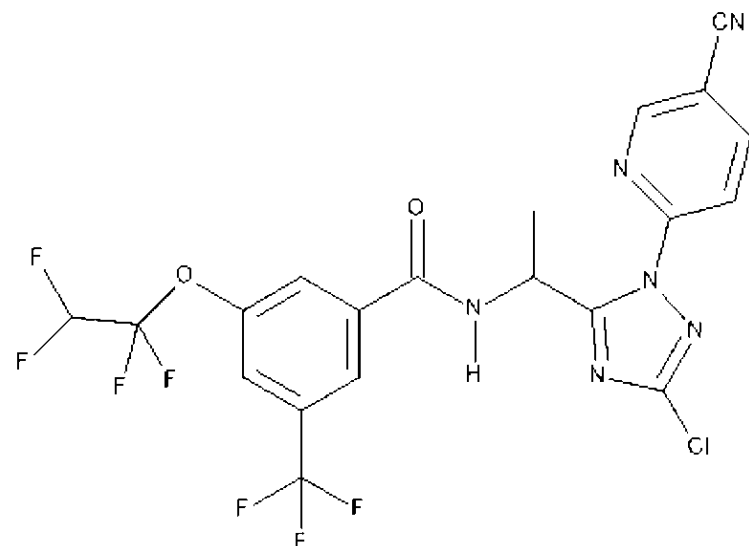
40

【 0 1 2 8 】

表 A - 1 は、12種の式 I p の化合物 A - 1 . 001 ~ A - 1 . 012 を提供するもの

50

であり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はClであり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。例えば、A - 1 . 0 0 2 は、



である。

【 0 1 2 9 】

10

20

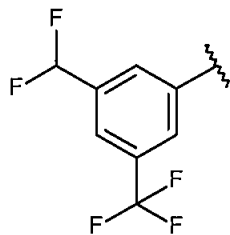
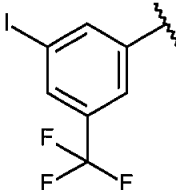
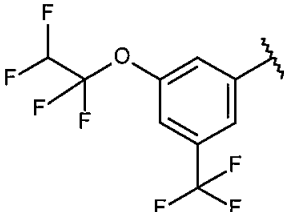
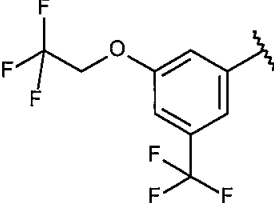
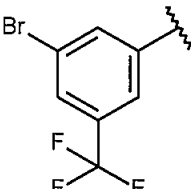
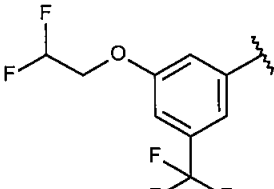
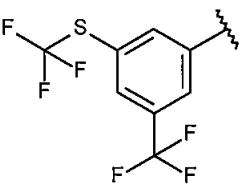
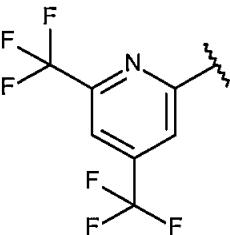
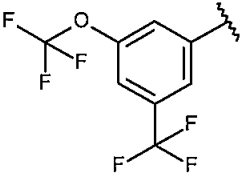
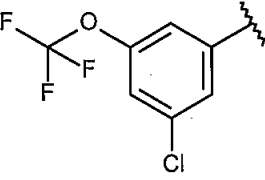
30

40

50

【表 1 - 1】

表 Z: R₂ の置換基の定義:

索引	R ₂	索引	R ₂
1		7	
2		8	
3		9	
4		10	
5		11	

10

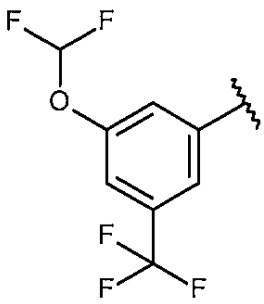
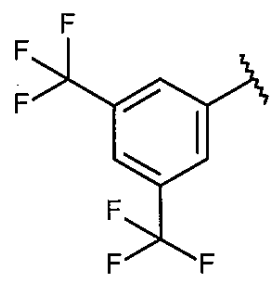
20

30

40

50

【表 1 - 2】

索引	R ₂	索引	R ₂
6		12	

10

【0130】

表 A - 2 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 . 001 ~ A - 2 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0131】

表 A - 3 は、12 種の式 I p の化合物 A - 3 . 001 ~ A - 3 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0132】

表 A - 4 は、12 種の式 I p の化合物 A - 4 . 001 ~ A - 4 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0133】

表 A - 5 は、12 種の式 I p の化合物 A - 5 . 001 ~ A - 5 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0134】

表 A - 6 は、12 種の式 I p の化合物 A - 6 . 001 ~ A - 6 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0135】

表 A - 7 は、12 種の式 I p の化合物 A - 7 . 001 ~ A - 7 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0136】

表 A - 8 は、12 種の式 I p の化合物 A - 8 . 001 ~ A - 8 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はC1であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0137】

表 A - 9 は、12 種の式 I p の化合物 A - 9 . 001 ~ A - 9 . 012 を提供するもの

50

であり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はC1であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0138】

表A - 10は、12種の式Ipの化合物A - 10 . 001 ~ A - 10 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0139】

表A - 11は、12種の式Ipの化合物A - 11 . 001 ~ A - 11 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0140】

表A - 12は、12種の式Ipの化合物A - 12 . 001 ~ A - 12 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0141】

表A - 13は、12種の式Ipの化合物A - 13 . 001 ~ A - 13 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0142】

表A - 14は、12種の式Ipの化合物A - 14 . 001 ~ A - 14 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0143】

表A - 15は、12種の式Ipの化合物A - 15 . 001 ~ A - 15 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0144】

表A - 16は、12種の式Ipの化合物A - 16 . 001 ~ A - 16 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0145】

表A - 17は、12種の式Ipの化合物A - 17 . 001 ~ A - 17 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0146】

表A - 18は、12種の式Ipの化合物A - 18 . 001 ~ A - 18 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はBrであり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0147】

表A - 19は、12種の式Ipの化合物A - 19 . 001 ~ A - 19 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 はIであり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0148】

50

表 A - 20 は、12 種の式 I p の化合物 A - 20 . 001 ~ A - 20 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0149】

表 A - 21 は、12 種の式 I p の化合物 A - 21 . 001 ~ A - 21 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0150】

表 A - 22 は、12 種の式 I p の化合物 A - 22 . 001 ~ A - 22 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0151】

表 A - 23 は、12 種の式 I p の化合物 A - 23 . 001 ~ A - 23 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0152】

表 A - 24 は、12 種の式 I p の化合物 A - 24 . 001 ~ A - 24 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0153】

表 A - 25 は、12 種の式 I p の化合物 A - 25 . 001 ~ A - 25 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0154】

表 A - 26 は、12 種の式 I p の化合物 A - 26 . 001 ~ A - 26 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0155】

表 A - 27 は、12 種の式 I p の化合物 A - 27 . 001 ~ A - 27 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はIであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0156】

表 A - 28 は、12 種の式 I p の化合物 A - 28 . 001 ~ A - 28 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0157】

表 A - 29 は、12 種の式 I p の化合物 A - 29 . 001 ~ A - 29 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0158】

表 A - 30 は、12 種の式 I p の化合物 A - 30 . 001 ~ A - 30 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

50

。

【 0 1 5 9 】

表 A - 3 1 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 1 . 0 0 1 ~ A - 3 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 6 0 】

表 A - 3 2 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 2 . 0 0 1 ~ A - 3 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

10

【 0 1 6 1 】

表 A - 3 3 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 3 . 0 0 1 ~ A - 3 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 6 2 】

表 A - 3 4 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 4 . 0 0 1 ~ A - 3 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【 0 1 6 3 】

表 A - 3 5 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 5 . 0 0 1 ~ A - 3 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 6 4 】

表 A - 3 6 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 6 . 0 0 1 ~ A - 3 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNH₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【 0 1 6 5 】

表 A - 3 7 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 7 . 0 0 1 ~ A - 3 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 6 6 】

表 A - 3 8 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 8 . 0 0 1 ~ A - 3 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 6 7 】

表 A - 3 9 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 3 9 . 0 0 1 ~ A - 3 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【 0 1 6 8 】

表 A - 4 0 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 0 . 0 0 1 ~ A - 4 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 1 6 9 】

50

表 A - 4 1 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 1 . 0 0 1 ~ A - 4 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 0】

表 A - 4 2 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 2 . 0 0 1 ~ A - 4 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 1】

表 A - 4 3 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 3 . 0 0 1 ~ A - 4 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 2】

表 A - 4 4 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 4 . 0 0 1 ~ A - 4 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 3】

表 A - 4 5 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 5 . 0 0 1 ~ A - 4 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 4】

表 A - 4 6 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 6 . 0 0 1 ~ A - 4 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 5】

表 A - 4 7 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 7 . 0 0 1 ~ A - 4 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 6】

表 A - 4 8 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 8 . 0 0 1 ~ A - 4 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 7】

表 A - 4 9 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 4 9 . 0 0 1 ~ A - 4 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 8】

表 A - 5 0 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 5 0 . 0 0 1 ~ A - 5 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【0 1 7 9】

表 A - 5 1 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 5 1 . 0 0 1 ~ A - 5 1 . 0 1 2 を提供す

10

20

30

40

50

るものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0180】

表A-52は、12種の式Ipの化合物A-52.001~A-52.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0181】

表A-53は、12種の式Ipの化合物A-53.001~A-53.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0182】

表A-54は、12種の式Ipの化合物A-54.001~A-54.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0183】

表A-55は、12種の式Ipの化合物A-55.001~A-55.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0184】

表A-56は、12種の式Ipの化合物A-56.001~A-56.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0185】

表A-57は、12種の式Ipの化合物A-57.001~A-57.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0186】

表A-58は、12種の式Ipの化合物A-58.001~A-58.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0187】

表A-59は、12種の式Ipの化合物A-59.001~A-59.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2, 2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0188】

表A-60は、12種の式Ipの化合物A-60.001~A-60.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2, 2, 2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0189】

表A-61は、12種の式Ipの化合物A-61.001~A-61.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2,

50

2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0190】

表 A - 62 は、12 種の式 I p の化合物 A - 62 . 001 ~ A - 62 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は NHCOCH₃ であり、R₄ は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0191】

表 A - 63 は、12 種の式 I p の化合物 A - 63 . 001 ~ A - 63 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は NHCOCH₃ であり、R₄ は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0192】

表 A - 64 は、12 種の式 I p の化合物 A - 64 . 001 ~ A - 64 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0193】

表 A - 65 は、12 種の式 I p の化合物 A - 65 . 001 ~ A - 65 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0194】

表 A - 66 は、12 種の式 I p の化合物 A - 66 . 001 ~ A - 66 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0195】

表 A - 67 は、12 種の式 I p の化合物 A - 67 . 001 ~ A - 67 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0196】

表 A - 68 は、12 種の式 I p の化合物 A - 68 . 001 ~ A - 68 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0197】

表 A - 69 は、12 種の式 I p の化合物 A - 69 . 001 ~ A - 69 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0198】

表 A - 70 は、12 種の式 I p の化合物 A - 70 . 001 ~ A - 70 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

【0199】

表 A - 71 は、12 種の式 I p の化合物 A - 71 . 001 ~ A - 71 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁ は H であり、R₅ は OCF₃ であり、R₄ は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂ は表 Z において定義されているとおりである。

50

。

【 0 2 0 0 】

表 A - 7 2 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 2 . 0 0 1 ~ A - 7 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 0 1 】

表 A - 7 3 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 3 . 0 0 1 ~ A - 7 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

10

【 0 2 0 2 】

表 A - 7 4 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 4 . 0 0 1 ~ A - 7 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 0 3 】

表 A - 7 5 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 5 . 0 0 1 ~ A - 7 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【 0 2 0 4 】

表 A - 7 6 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 6 . 0 0 1 ~ A - 7 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 0 5 】

表 A - 7 7 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 7 . 0 0 1 ~ A - 7 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【 0 2 0 6 】

表 A - 7 8 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 8 . 0 0 1 ~ A - 7 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 0 7 】

表 A - 7 9 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 7 9 . 0 0 1 ~ A - 7 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【 0 2 0 8 】

表 A - 8 0 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 0 . 0 0 1 ~ A - 8 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 0 9 】

表 A - 8 1 は、 1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 1 . 0 0 1 ~ A - 8 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はO C H F₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

50

【 0 2 1 0 】

表 A - 8 2 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 2 . 0 0 1 ~ A - 8 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 1 】

表 A - 8 3 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 3 . 0 0 1 ~ A - 8 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 2 】

表 A - 8 4 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 4 . 0 0 1 ~ A - 8 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 3 】

表 A - 8 5 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 5 . 0 0 1 ~ A - 8 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 4 】

表 A - 8 6 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 6 . 0 0 1 ~ A - 8 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 5 】

表 A - 8 7 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 7 . 0 0 1 ~ A - 8 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2 , 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 6 】

表 A - 8 8 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 8 . 0 0 1 ~ A - 8 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 7 】

表 A - 8 9 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 8 9 . 0 0 1 ~ A - 8 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 8 】

表 A - 9 0 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 9 0 . 0 0 1 ~ A - 9 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 1 9 】

表 A - 9 1 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 9 1 . 0 0 1 ~ A - 9 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はHであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 2 0 】

表 A - 9 2 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 9 2 . 0 0 1 ~ A - 9 2 . 0 1 2 を提供す

10

20

30

40

50

るものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0221】

表A - 93は、12種の式Ipの化合物A - 93.001 ~ A - 93.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0222】

表A - 94は、12種の式Ipの化合物A - 94.001 ~ A - 94.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0223】

表A - 95は、12種の式Ipの化合物A - 95.001 ~ A - 95.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0224】

表A - 96は、12種の式Ipの化合物A - 96.001 ~ A - 96.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0225】

表A - 97は、12種の式Ipの化合物A - 97.001 ~ A - 97.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0226】

表A - 98は、12種の式Ipの化合物A - 98.001 ~ A - 98.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0227】

表A - 99は、12種の式Ipの化合物A - 99.001 ~ A - 99.012を提供するものであり、ここで、 R_1 はHであり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0228】

表A - 100は、12種の式Ipの化合物A - 100.001 ~ A - 100.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 はClであり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0229】

表A - 101は、12種の式Ipの化合物A - 101.001 ~ A - 101.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 はClであり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0230】

表A - 102は、12種の式Ipの化合物A - 102.001 ~ A - 102.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 はClであり、 R_4 は[5 - (トリ

50

フルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0231】

表 A - 103 は、12 種の式 I p の化合物 A - 103 . 001 ~ A - 103 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0232】

表 A - 104 は、12 種の式 I p の化合物 A - 104 . 001 ~ A - 104 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

10

【0233】

表 A - 105 は、12 種の式 I p の化合物 A - 105 . 001 ~ A - 105 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0234】

表 A - 106 は、12 種の式 I p の化合物 A - 106 . 001 ~ A - 106 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

20

【0235】

表 A - 107 は、12 種の式 I p の化合物 A - 107 . 001 ~ A - 107 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0236】

表 A - 108 は、12 種の式 I p の化合物 A - 108 . 001 ~ A - 108 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

30

【0237】

表 A - 109 は、12 種の式 I p の化合物 A - 109 . 001 ~ A - 109 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0238】

表 A - 110 は、12 種の式 I p の化合物 A - 110 . 001 ~ A - 110 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

40

【0239】

表 A - 111 は、12 種の式 I p の化合物 A - 111 . 001 ~ A - 111 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【0240】

表 A - 112 は、12 種の式 I p の化合物 A - 112 . 001 ~ A - 112 . 012 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は [5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義さ

50

れているとおりである。

【0241】

表A-113は、12種の式I pの化合物A-113.001～A-113.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0242】

表A-114は、12種の式I pの化合物A-114.001～A-114.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5-(2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0243】

表A-115は、12種の式I pの化合物A-115.001～A-115.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5-(2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0244】

表A-116は、12種の式I pの化合物A-116.001～A-116.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0245】

表A-117は、12種の式I pの化合物A-117.001～A-117.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はBrであり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0246】

表A-118は、12種の式I pの化合物A-118.001～A-118.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0247】

表A-119は、12種の式I pの化合物A-119.001～A-119.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0248】

表A-120は、12種の式I pの化合物A-120.001～A-120.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0249】

表A-121は、12種の式I pの化合物A-121.001～A-121.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0250】

表A-122は、12種の式I pの化合物A-122.001～A-122.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はIであり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

50

【 0 2 5 1 】

表 A - 1 2 3 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 3 . 0 0 1 ~ A - 1 2 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 5 2 】

表 A - 1 2 4 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 4 . 0 0 1 ~ A - 1 2 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

10

【 0 2 5 3 】

表 A - 1 2 5 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 5 . 0 0 1 ~ A - 1 2 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 5 4 】

表 A - 1 2 6 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 6 . 0 0 1 ~ A - 1 2 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はIであり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

20

【 0 2 5 5 】

表 A - 1 2 7 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 7 . 0 0 1 ~ A - 1 2 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はN H₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 5 6 】

表 A - 1 2 8 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 8 . 0 0 1 ~ A - 1 2 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はN H₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 5 7 】

表 A - 1 2 9 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 2 9 . 0 0 1 ~ A - 1 2 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はN H₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

30

【 0 2 5 8 】

表 A - 1 3 0 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 0 . 0 0 1 ~ A - 1 3 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はN H₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 5 9 】

表 A - 1 3 1 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 1 . 0 0 1 ~ A - 1 3 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はN H₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

40

【 0 2 6 0 】

表 A - 1 3 2 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 2 . 0 0 1 ~ A - 1 3 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁はC H₃であり、R₅はN H₂であり、R₄は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 1 】

50

表 A - 1 3 3 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 3 . 0 0 1 ~ A - 1 3 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H₂であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 2 】

表 A - 1 3 4 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 4 . 0 0 1 ~ A - 1 3 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H₂であり、R₄は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 3 】

表 A - 1 3 5 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 5 . 0 0 1 ~ A - 1 3 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H₂であり、R₄は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 4 】

表 A - 1 3 6 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 6 . 0 0 1 ~ A - 1 3 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 5 】

表 A - 1 3 7 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 7 . 0 0 1 ~ A - 1 3 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 6 】

表 A - 1 3 8 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 8 . 0 0 1 ~ A - 1 3 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 7 】

表 A - 1 3 9 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 3 9 . 0 0 1 ~ A - 1 3 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 8 】

表 A - 1 4 0 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 4 0 . 0 0 1 ~ A - 1 4 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 6 9 】

表 A - 1 4 1 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 4 1 . 0 0 1 ~ A - 1 4 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 7 0 】

表 A - 1 4 2 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 4 2 . 0 0 1 ~ A - 1 4 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₃であり、R₅は N H C H₃であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 2 7 1 】

表 A - 1 4 3 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 4 3 . 0 0 1 ~ A - 1 4 3 . 0 1 2 を

10

20

30

40

50

提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0272】

表A - 144は、12種の式I pの化合物A - 144 . 001 ~ A - 144 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCH_3$ であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0273】

表A - 145は、12種の式I pの化合物A - 145 . 001 ~ A - 145 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0274】

表A - 146は、12種の式I pの化合物A - 146 . 001 ~ A - 146 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0275】

表A - 147は、12種の式I pの化合物A - 147 . 001 ~ A - 147 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0276】

表A - 148は、12種の式I pの化合物A - 148 . 001 ~ A - 148 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0277】

表A - 149は、12種の式I pの化合物A - 149 . 001 ~ A - 149 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0278】

表A - 150は、12種の式I pの化合物A - 150 . 001 ~ A - 150 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0279】

表A - 151は、12種の式I pの化合物A - 151 . 001 ~ A - 151 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0280】

表A - 152は、12種の式I pの化合物A - 152 . 001 ~ A - 152 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0281】

表A - 153は、12種の式I pの化合物A - 153 . 001 ~ A - 153 . 012を

50

提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $N(CH_3)_2$ であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0282】

表A-154は、12種の式Ipの化合物A-154.001~A-154.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0283】

表A-155は、12種の式Ipの化合物A-155.001~A-155.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0284】

表A-156は、12種の式Ipの化合物A-156.001~A-156.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0285】

表A-157は、12種の式Ipの化合物A-157.001~A-157.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0286】

表A-158は、12種の式Ipの化合物A-158.001~A-158.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0287】

表A-159は、12種の式Ipの化合物A-159.001~A-159.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0288】

表A-160は、12種の式Ipの化合物A-160.001~A-160.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0289】

表A-161は、12種の式Ipの化合物A-161.001~A-161.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0290】

表A-162は、12種の式Ipの化合物A-162.001~A-162.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $NHCOCH_3$ であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0291】

表A-163は、12種の式Ipの化合物A-163.001~A-163.012を

50

提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0292】

表A - 164は、12種の式Ipの化合物A - 164 . 001 ~ A - 164 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0293】

表A - 165は、12種の式Ipの化合物A - 165 . 001 ~ A - 165 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0294】

表A - 166は、12種の式Ipの化合物A - 166 . 001 ~ A - 166 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0295】

表A - 167は、12種の式Ipの化合物A - 167 . 001 ~ A - 167 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0296】

表A - 168は、12種の式Ipの化合物A - 168 . 001 ~ A - 168 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0297】

表A - 169は、12種の式Ipの化合物A - 169 . 001 ~ A - 169 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0298】

表A - 170は、12種の式Ipの化合物A - 170 . 001 ~ A - 170 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0299】

表A - 171は、12種の式Ipの化合物A - 171 . 001 ~ A - 171 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCF_3 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0300】

表A - 172は、12種の式Ipの化合物A - 172 . 001 ~ A - 172 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $OCHF_2$ であり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0301】

表A - 173は、12種の式Ipの化合物A - 173 . 001 ~ A - 173 . 012を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は $OCHF_2$ であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義さ

50

れているとおりである。

【0302】

表A - 174は、12種の式I pの化合物A - 174 . 001 ~ A - 174 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0303】

表A - 175は、12種の式I pの化合物A - 175 . 001 ~ A - 175 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0304】

表A - 176は、12種の式I pの化合物A - 176 . 001 ~ A - 176 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0305】

表A - 177は、12種の式I pの化合物A - 177 . 001 ~ A - 177 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0306】

表A - 178は、12種の式I pの化合物A - 178 . 001 ~ A - 178 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0307】

表A - 179は、12種の式I pの化合物A - 179 . 001 ~ A - 179 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0308】

表A - 180は、12種の式I pの化合物A - 180 . 001 ~ A - 180 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0309】

表A - 181は、12種の式I pの化合物A - 181 . 001 ~ A - 181 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0310】

表A - 182は、12種の式I pの化合物A - 182 . 001 ~ A - 182 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0311】

表A - 183は、12種の式I pの化合物A - 183 . 001 ~ A - 183 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

50

【0312】

表A - 184は、12種の式I pの化合物A - 184 . 001 ~ A - 184 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0313】

表A - 185は、12種の式I pの化合物A - 185 . 001 ~ A - 185 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0314】

表A - 186は、12種の式I pの化合物A - 186 . 001 ~ A - 186 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0315】

表A - 187は、12種の式I pの化合物A - 187 . 001 ~ A - 187 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0316】

表A - 188は、12種の式I pの化合物A - 188 . 001 ~ A - 188 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0317】

表A - 189は、12種の式I pの化合物A - 189 . 001 ~ A - 189 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0318】

表A - 190は、12種の式I pの化合物A - 190 . 001 ~ A - 190 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0319】

表A - 191は、12種の式I pの化合物A - 191 . 001 ~ A - 191 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0320】

表A - 192は、12種の式I pの化合物A - 192 . 001 ~ A - 192 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0321】

表A - 193は、12種の式I pの化合物A - 193 . 001 ~ A - 193 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₃であり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

50

【 0 3 2 2 】

表 A - 1 9 4 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 9 4 . 0 0 1 ~ A - 1 9 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 2 3 】

表 A - 1 9 5 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 9 5 . 0 0 1 ~ A - 1 9 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

10

【 0 3 2 4 】

表 A - 1 9 6 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 9 6 . 0 0 1 ~ A - 1 9 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 2 5 】

表 A - 1 9 7 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 9 7 . 0 0 1 ~ A - 1 9 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

20

【 0 3 2 6 】

表 A - 1 9 8 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 9 8 . 0 0 1 ~ A - 1 9 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_3 であり、 R_5 は OCH_2CHF_2 であり、 R_4 は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 2 7 】

表 A - 1 9 9 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 1 9 9 . 0 0 1 ~ A - 1 9 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cyp であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は(5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 2 8 】

表 A - 2 0 0 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 2 0 0 . 0 0 1 ~ A - 2 0 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cyp であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

30

【 0 3 2 9 】

表 A - 2 0 1 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 2 0 1 . 0 0 1 ~ A - 2 0 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cyp であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 0 】

表 A - 2 0 2 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 2 0 2 . 0 0 1 ~ A - 2 0 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cyp であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

40

【 0 3 3 1 】

表 A - 2 0 3 は、1 2 種の式 I p の化合物 A - 2 0 3 . 0 0 1 ~ A - 2 0 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は CH_2Cyp であり、 R_5 は Cl であり、 R_4 は[5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 2 】

50

表 A - 204 は、12 種の式 I p の化合物 A - 204 . 001 ~ A - 204 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は C l であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 3 】

表 A - 205 は、12 種の式 I p の化合物 A - 205 . 001 ~ A - 205 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は C l であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 4 】

表 A - 206 は、12 種の式 I p の化合物 A - 206 . 001 ~ A - 206 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は C l であり、R₄は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 5 】

表 A - 207 は、12 種の式 I p の化合物 A - 207 . 001 ~ A - 207 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は C l であり、R₄は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 6 】

表 A - 208 は、12 種の式 I p の化合物 A - 208 . 001 ~ A - 208 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は B r であり、R₄は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 7 】

表 A - 209 は、12 種の式 I p の化合物 A - 209 . 001 ~ A - 209 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 8 】

表 A - 210 は、12 種の式 I p の化合物 A - 210 . 001 ~ A - 210 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 3 9 】

表 A - 211 は、12 種の式 I p の化合物 A - 211 . 001 ~ A - 211 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 4 0 】

表 A - 212 は、12 種の式 I p の化合物 A - 212 . 001 ~ A - 212 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 4 1 】

表 A - 213 は、12 種の式 I p の化合物 A - 213 . 001 ~ A - 213 . 012 を提供するものであり、ここで、R₁は C H₂C y p であり、R₅は B r であり、R₄は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R₂は表 Z において定義されているとおりである。

【 0 3 4 2 】

表 A - 214 は、12 種の式 I p の化合物 A - 214 . 001 ~ A - 214 . 012 を

10

20

30

40

50

提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0343】

表A-215は、12種の式Ipの化合物A-215.001~A-215.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0344】

表A-216は、12種の式Ipの化合物A-216.001~A-216.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は Br であり、 R_4 は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0345】

表A-217は、12種の式Ipの化合物A-217.001~A-217.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0346】

表A-218は、12種の式Ipの化合物A-218.001~A-218.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0347】

表A-219は、12種の式Ipの化合物A-219.001~A-219.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0348】

表A-220は、12種の式Ipの化合物A-220.001~A-220.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0349】

表A-221は、12種の式Ipの化合物A-221.001~A-221.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0350】

表A-222は、12種の式Ipの化合物A-222.001~A-222.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0351】

表A-223は、12種の式Ipの化合物A-223.001~A-223.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及び R_2 は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0352】

表A-224は、12種の式Ipの化合物A-224.001~A-224.012を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は[5-(

50

ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

【 0 3 5 3 】

表 A - 2 2 5 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 2 5 . 0 0 1 ~ A - 2 2 5 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は I であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

【 0 3 5 4 】

表 A - 2 2 6 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 2 6 . 0 0 1 ~ A - 2 2 6 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は (5 - シアノ - 2 - ピリジル) であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

10

【 0 3 5 5 】

表 A - 2 2 7 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 2 7 . 0 0 1 ~ A - 2 2 7 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

【 0 3 5 6 】

表 A - 2 2 8 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 2 8 . 0 0 1 ~ A - 2 2 8 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

20

【 0 3 5 7 】

表 A - 2 2 9 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 2 9 . 0 0 1 ~ A - 2 2 9 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

【 0 3 5 8 】

表 A - 2 3 0 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 3 0 . 0 0 1 ~ A - 2 3 0 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

30

【 0 3 5 9 】

表 A - 2 3 1 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 3 1 . 0 0 1 ~ A - 2 3 1 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

【 0 3 6 0 】

表 A - 2 3 2 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 3 2 . 0 0 1 ~ A - 2 3 2 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

40

【 0 3 6 1 】

表 A - 2 3 3 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 3 3 . 0 0 1 ~ A - 2 3 3 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル] であり、及び R_2 は表 Z において定義されているとありである。

【 0 3 6 2 】

表 A - 2 3 4 は、12 種の式 I p の化合物 A - 2 3 4 . 0 0 1 ~ A - 2 3 4 . 0 1 2 を提供するものであり、ここで、 R_1 は $CH_2Cy p$ であり、 R_5 は NH_2 であり、 R_4 は [5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル] であり、及び R_2 は表 Z において定義さ

50

れているとおりである。

【0363】

表A - 235は、12種の式I pの化合物A - 235 . 001 ~ A - 235 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0364】

表A - 236は、12種の式I pの化合物A - 236 . 001 ~ A - 236 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0365】

表A - 237は、12種の式I pの化合物A - 237 . 001 ~ A - 237 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0366】

表A - 238は、12種の式I pの化合物A - 238 . 001 ~ A - 238 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0367】

表A - 239は、12種の式I pの化合物A - 239 . 001 ~ A - 239 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0368】

表A - 240は、12種の式I pの化合物A - 240 . 001 ~ A - 240 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0369】

表A - 241は、12種の式I pの化合物A - 241 . 001 ~ A - 241 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0370】

表A - 242は、12種の式I pの化合物A - 242 . 001 ~ A - 242 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0371】

表A - 243は、12種の式I pの化合物A - 243 . 001 ~ A - 243 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCH₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0372】

表A - 244は、12種の式I pの化合物A - 244 . 001 ~ A - 244 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおり

50

である。

【0373】

表A - 245は、12種の式I pの化合物A - 245 . 001 ~ A - 245 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0374】

表A - 246は、12種の式I pの化合物A - 246 . 001 ~ A - 246 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0375】

表A - 247は、12種の式I pの化合物A - 247 . 001 ~ A - 247 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0376】

表A - 248は、12種の式I pの化合物A - 248 . 001 ~ A - 248 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0377】

表A - 249は、12種の式I pの化合物A - 249 . 001 ~ A - 249 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0378】

表A - 250は、12種の式I pの化合物A - 250 . 001 ~ A - 250 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0379】

表A - 251は、12種の式I pの化合物A - 251 . 001 ~ A - 251 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0380】

表A - 252は、12種の式I pの化合物A - 252 . 001 ~ A - 252 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はN(CH₃)₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0381】

表A - 253は、12種の式I pの化合物A - 253 . 001 ~ A - 253 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0382】

表A - 254は、12種の式I pの化合物A - 254 . 001 ~ A - 254 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにお

50

いて定義されているとおりである。

【0383】

表A - 255は、12種の式I pの化合物A - 255 . 001 ~ A - 255 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0384】

表A - 256は、12種の式I pの化合物A - 256 . 001 ~ A - 256 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0385】

表A - 257は、12種の式I pの化合物A - 257 . 001 ~ A - 257 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0386】

表A - 258は、12種の式I pの化合物A - 258 . 001 ~ A - 258 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0387】

表A - 259は、12種の式I pの化合物A - 259 . 001 ~ A - 259 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0388】

表A - 260は、12種の式I pの化合物A - 260 . 001 ~ A - 260 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0389】

表A - 261は、12種の式I pの化合物A - 261 . 001 ~ A - 261 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はNHCOCH₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0390】

表A - 262は、12種の式I pの化合物A - 262 . 001 ~ A - 262 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0391】

表A - 263は、12種の式I pの化合物A - 263 . 001 ~ A - 263 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0392】

表A - 264は、12種の式I pの化合物A - 264 . 001 ~ A - 264 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義され

50

ているとおりである。

【0393】

表A-265は、12種の式I pの化合物A-265.001～A-265.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0394】

表A-266は、12種の式I pの化合物A-266.001～A-266.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0395】

表A-267は、12種の式I pの化合物A-267.001～A-267.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0396】

表A-268は、12種の式I pの化合物A-268.001～A-268.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0397】

表A-269は、12種の式I pの化合物A-269.001～A-269.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0398】

表A-270は、12種の式I pの化合物A-270.001～A-270.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCF₃であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0399】

表A-271は、12種の式I pの化合物A-271.001～A-271.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0400】

表A-272は、12種の式I pの化合物A-272.001～A-272.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0401】

表A-273は、12種の式I pの化合物A-273.001～A-273.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0402】

表A-274は、12種の式I pの化合物A-274.001～A-274.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zに

50

において定義されているとおりである。

【0403】

表A-275は、12種の式I pの化合物A-275.001~A-275.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0404】

表A-276は、12種の式I pの化合物A-276.001~A-276.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0405】

表A-277は、12種の式I pの化合物A-277.001~A-277.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0406】

表A-278は、12種の式I pの化合物A-278.001~A-278.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

20

【0407】

表A-279は、12種の式I pの化合物A-279.001~A-279.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCHF₂であり、R₄は[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0408】

表A-280は、12種の式I pの化合物A-280.001~A-280.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は(5-シアノ-2-ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

30

【0409】

表A-281は、12種の式I pの化合物A-281.001~A-281.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0410】

表A-282は、12種の式I pの化合物A-282.001~A-282.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(トリフルオロメトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

40

【0411】

表A-283は、12種の式I pの化合物A-283.001~A-283.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0412】

表A-284は、12種の式I pの化合物A-284.001~A-284.012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cy pであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおい

50

て定義されているとおりである。

【0413】

表A - 285は、12種の式I pの化合物A - 285 . 001 ~ A - 285 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0414】

表A - 286は、12種の式I pの化合物A - 286 . 001 ~ A - 286 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Z

10

【0415】

表A - 287は、12種の式I pの化合物A - 287 . 001 ~ A - 287 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0416】

表A - 288は、12種の式I pの化合物A - 288 . 001 ~ A - 288 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CF₃であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて

20

【0417】

表A - 289は、12種の式I pの化合物A - 289 . 001 ~ A - 289 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は(5 - シアノ - 2 - ピリジル)であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0418】

表A - 290は、12種の式I pの化合物A - 290 . 001 ~ A - 290 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて

30

【0419】

表A - 291は、12種の式I pの化合物A - 291 . 001 ~ A - 291 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (トリフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて

【0420】

表A - 292は、12種の式I pの化合物A - 292 . 001 ~ A - 292 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて

40

【0421】

表A - 293は、12種の式I pの化合物A - 293 . 001 ~ A - 293 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2 - ジフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて

【0422】

表A - 294は、12種の式I pの化合物A - 294 . 001 ~ A - 294 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ)ピリミジン - 2 - イル]であり、及び

50

R₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0423】

表A - 295は、12種の式Ipの化合物A - 295 . 001 ~ A - 295 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (2, 2, 2 - トリフルオロエトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0424】

表A - 296は、12種の式Ipの化合物A - 296 . 001 ~ A - 296 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) - 2 - ピリジル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

10

【0425】

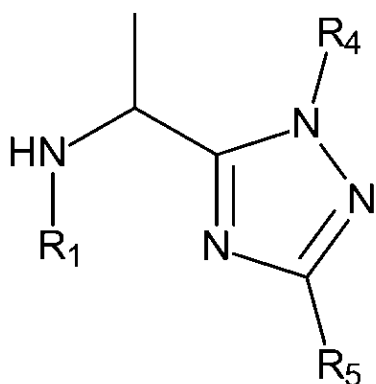
表A - 297は、12種の式Ipの化合物A - 297 . 001 ~ A - 297 . 012を提供するものであり、ここで、R₁はCH₂Cypであり、R₅はOCH₂CHF₂であり、R₄は[5 - (ジフルオロメトキシ) ピリミジン - 2 - イル]であり、及びR₂は表Zにおいて定義されているとおりである。

【0426】

また、式IIa

【化33】

20



IIa

30

(式中、R₁、R₄(式Iに定義されているA₂及びR_{4a}を含有する環に対応)及びR₅は、式Iに定義されているとおりである)

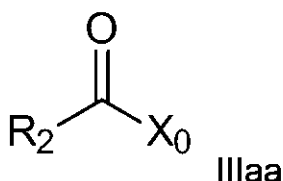
のアミンの特定の間体化合物が利用可能にされ、そのいくつかは、新規である。式Iに係るR₁、R₄及びR₅の好ましい実施形態は、対応して、式IIaに係るR₁、R₄及びR₅の好ましい実施形態である。式IIaの化合物の特定の例は、R₁、R₄及びR₅が、表A - 1 ~ A - 297において定義されているとおりであるものである。

【0427】

また、式IIIa

40

【化34】



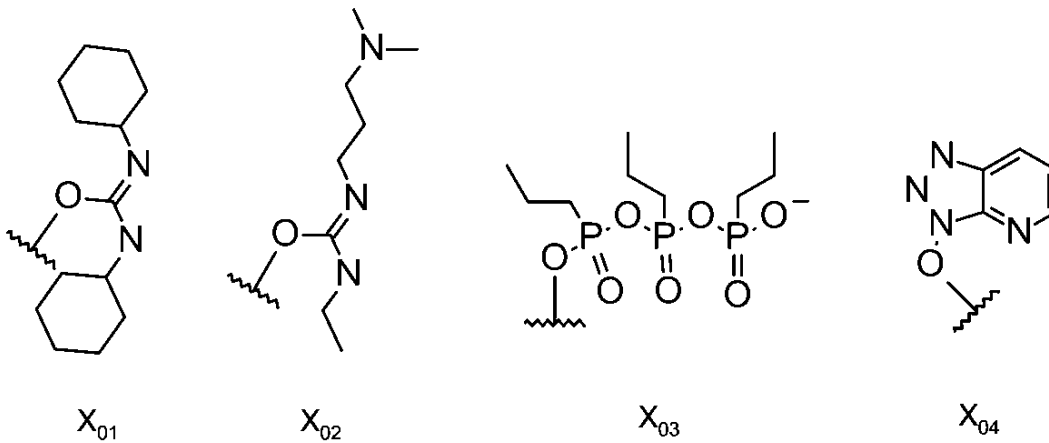
IIIa

(式中、R₂は、式Iに定義されているとおりである)

50

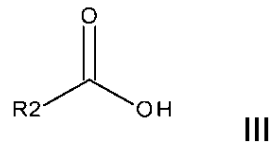
のアミンの特定の間体化合物が利用可能にされ、そのいくつかは、新規である。式 I に係る R_2 の好ましい実施形態は、対応して、式 I I I a に係る R_2 の好ましい実施形態である。式 I I I a の化合物の特定の例は、(A) X_0 がハロゲンであり、及び R_2 が、表 Z において定義されているとおりであり；(B) X_0 が X_{01} であり、及び R_2 が、表 Z において定義されているとおりであり；(C) X_0 が X_{02} であり、及び R_2 が、表 Z において定義されているとおりであり；(D) X_0 が X_{03} であり、及び R_2 が、表 Z において定義されているとおりであり；及び (E) X_0 が X_{04} であり、及び R_2 が、表 Z において定義されているとおりであるものである。

【化 3 5】



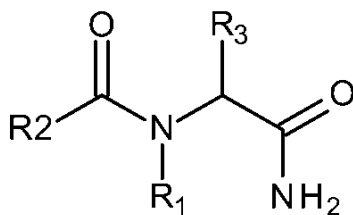
【0 4 2 8】

さらに、
・式 I I I
【化 3 6】



の化合物が利用可能にされ、ここで、 R_2 は、式 I において定義されているとおりであり；式 I に係る R_2 の好ましい実施形態は、対応して、式 I I I に係る R_2 の好ましい実施形態である。式 I I I の化合物の特定の例は、 R_2 が、表 Z において定義されているとおりであり；

・式 V I I
【化 3 7】

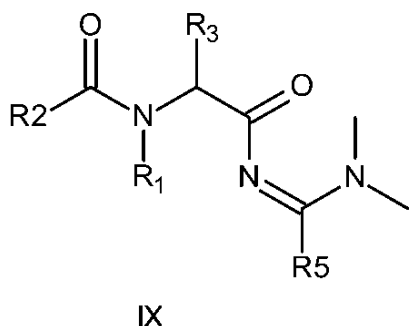


VII

の化合物が利用可能にされ、ここで、 R_2 、 R_1 及び R_3 は、式 I に定義されているとおりであり；式 I に係る R_2 、 R_1 及び R_3 の好ましい実施形態は、対応して、式 V I I に係る R_2 、 R_1 及び R_3 の好ましい実施形態である。式 V I I の化合物の特定の例は、(i) R_3 がメチルであり、 R_2 が、表 Z において定義されている置換基であり、及び R_1 が水素であり；(i i) R_3 がメチルであり、 R_2 が、表 Z において定義されている置換基であり、及び R_1 がメチルであり、及び(i i i) R_3 がメチルであり、 R_2 が、表 Z において定義されている置換基であり、及び R_1 が $-CH_2Cyp$ であるものであり；

・式 I X

【化 3 8】

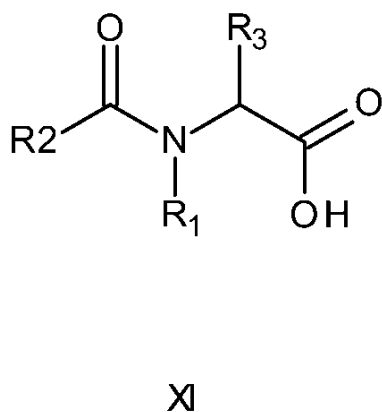


10

の化合物が利用可能にされ、ここで、 R_2 、 R_1 、 R_3 及び R_5 は、式 I に定義されているとおりであり；式 I に係る R_2 、 R_1 、 R_3 及び R_5 の好ましい実施形態は、対応して、式 I X に係る R_2 、 R_1 及び R_3 の好ましい実施形態である。式 I X の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、及び R_1 、 R_2 及び R_5 が、表 A - 1 ~ A - 2 9 7 中における化合物のいずれか 1 つについて定義されているとおりであるものであり；

・式 X I

【化 3 9】



20

30

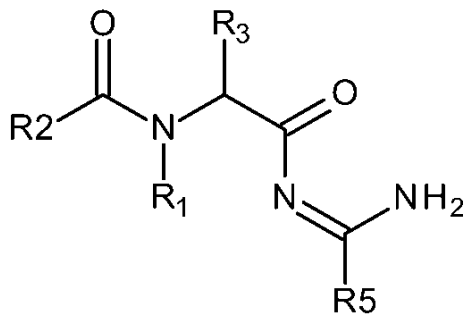
の化合物が利用可能にされ、ここで、 R_2 、 R_1 及び R_3 は、式 I に定義されているとおりであり；式 I に係る R_2 、 R_1 及び R_3 の好ましい実施形態は、対応して、式 X I に係る R_2 、 R_1 及び R_3 の好ましい実施形態である。式 X I の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、及び R_1 及び R_2 が、表 A - 1 ~ A - 2 9 7 中における化合物のいずれか 1 つについて定義されているとおりであるものであり；

・式 X I I I

40

50

【化 4 0】



XIII

10

の化合物が利用可能にされ、ここで、 R_2 、 R_1 、 R_3 及び R_5 は、式 I に定義されており、式 I に係る R_2 、 R_1 、 R_3 及び R_5 の好ましい実施形態は、対応して、式 X I I I に係る R_2 、 R_1 、 R_3 及び R_5 の好ましい実施形態である。式 X I I I の化合物の特定の例は、 R_3 がメチルであり、及び R_1 、 R_2 及び R_5 が、表 A - 1 ~ A - 2 9 7 中における化合物のいずれか 1 つについて定義されているとおりであるものである。

【 0 4 2 9】

20

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に及び／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。

【 0 4 3 0】

上記の動物有害生物の例は、以下のとおりである：

30

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 latiusculi)、パノニクス属 (Panonychus spp.)、ミカンサビダニ (Phyllocoptruta 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 (

40

50

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.)、ベムフィグス属(*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(*Anthrenus* 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(*Atenius* spp.)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属(*Cerotoma* spp.)、コノデルス属(*Conoderus* spp.)、コスモポリテス属(*Cosmopolites* spp.)、コチニス・ニチダ(*Cotininitida*)、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・フィロサ(*Lagria villosa*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソルホプトルス属(*Lissorhopterus* spp.)、リオゲニス属(*Liogenys* spp.)、マエコラスピス属(*Maecolaspis* spp.)、アカピロウドコガネ(*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(*Otiorhynchus* spp.)、フィロファガ属(*Phyllophaga* spp.)、フリクチヌス属(*Phlyctinus* spp.)、ポピリア属(*Popillia* spp.)、プシリオデス属(*Psylliodes* spp.)、リソマツス・アウブチリス(*Rhyssomatus aubtilis*)、リゾペルタ属(*Rhizopertha* spp.)、コガネムシ科(*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・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(*Bradysia* 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(*Geomyza tripunctata*)、ツエツエバエ属

10

20

30

40

50

(*Glossina* spp.), ヒフバエ属(*Hypoderma* spp.), ヒツボスカ属(*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*), アンブリペルタ・ニチダ(*Amblypelta nitida*), バチコエリア・タラシナ(*Bathycoelia thalassina*), ブリサス属(*Blissus* spp.), トコジラミ属(*Cimex* spp.), クラビグララ・トメントシコリス(*Clavigralla tomentosicollis*), クレオンチアデス属(*Creontiades* spp.), ジスタンチエラ・テオブロマ(*Distantiella theobroma*), ジケロプス・フルカツス(*Dichelops furcatus*), ジスデルクス属(*Dysdercus* spp.), エデッサ属(*Edeessa* 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・ノピレルス(*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・シムランス(*Nysius simulans*), オエバルス・インストラリス(*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・カスターネア(*Scaptocoris castanea*), スコチノファラ属(*Scotinophara* spp.), チアンタ属(*Thyanta* spp.), サシガメ属(*Triatoma* spp.), ヴァチガ・イルデンス(*Vatiga illudens*); アシルトシウム・ピスム(*Acyrtosium pisum*), アダルゲス属(*Adalgas* spp.), アガリアナ・エンシゲラ(*Agalliana ensigera*), アゴノセナ・タルギオニイ(*Agonoscena targionii*), アレウロジクス属(*Aleurodicus* spp.), アレウロカンツス属(*Aleurocanthus* spp.), アレウロロブス・バロデンシス(*Aleurolobus barodensis*), アレウロトリクス・フロッコスス(*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(*Be*

10

20

30

40

50

misia 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 dictyospermi)、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)、シカデュリナ属 (Cicadulina spp)、ヒラタカタカイガラムシ (Coccus hesperidum)、ダルブルス・マイジス (Dalbulus maidis)、ジアレウロデス属 (Dialeurodes spp)、ミカンキジラミ (Diaphorina citri)、ジウラフィス・ノキシア (Diuraphis noxia)、ジサフィス属 (Dysaphis spp)、エンポアスカ属 (Empoasca spp.)、リンゴワタムシ (Eriosoma larigerum)、エリスロネウラ属 (Erythronaura 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 brimblecombei)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (Hyadaphis pseudobrassicae)、ヒアロプテルス属 (Hyalopterus spp)、ヒペロミズス・パリズス (Hyperomyzus pallidus)、リュウガンズキンヨコバイ (Idioscopus clypealis)、ヤコビアスカ・リビカ (Jacobiasca 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 (Lepidosaphes spp.)、ニセダイコンアブラムシ (Lopaphis erysimi)、リオゲニス・マイジス (Lyogenys maidis)、マクロシフム属 (Macrosiphum spp.)、マハナルヴァ属 (Mahanarva spp)、メタカルファ・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.)、ネオトキシソプテラ属 (Neotoxoptera sp)、ツماغロヨコバイ属 (Nephotettix spp.)、ニラバルバタ属 (Nilaparvata spp.)、ナシミドリオオアブラムシ (Nippolachnus piri Mats)、オドナスピス・ルタエ (Odonaspis ruthae)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (Oregma lanigera Zehnter)、ヤマモモコナジラミ (Parabemisia myricae)、パラトリオザ・コッケレリ (Paratrioza cockerelli)、バルラトリア属 (Parlatoria spp.)、ペムフィグス属 (Pemphigus spp.)、トウモロコシウンカ (Peregrinus maidis)、ペルキンシエラ属 (Perkinsiella spp)、ホップイボアブラムシ (Phorodon humuli)、フィロキセラ属 (Phylloxera spp)、プラノコッカス属 (Planococcus spp.)、シュウダウラカスピス属 (Pseudaulacaspis spp.)、シュードコッカス属 (Pseudococcus spp.)、ワタノミハムシ (Pseudatomoscelis seriatus)、プシラ属 (Psylla spp.)、ブルビナリア・エチオピカ (Pulvinaria aethiopica)、クアドラズピジオツス属 (Quadraspidiotus 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 (Rhopalosiphum 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 (Schizaphis spp.)、シトビオン属 (Sitobion spp.)、セジロウンカ (Sogatella furcifera)、スピシスチルス・フェスチヌス (Spissistilus festinus)、タロファガス・プロセルピナ (Tarophagus Proserpina)、トキシソプテラ属 (

10

20

30

40

50

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 flammigera)、ジギニジア・スクテラリス(Zyginiidia scutellaris);

膜翅目(Hymenoptera)から、例えばヒメハキリアリ属(Acromyrmex)、アルゲ属(Arges spp)、ハキリアリ属(Atta spp.)、セフス属(Cephus spp.)、ジプリオン属(Diprion spp.)、マツハバチ科(Diprionidae)、シマトウヒハバチ(Gilpinia polytoma)、ホプロカンパ属(Hoplocampa spp.)、ケアリ属(Lasius spp.)、イエヒメアリ(Monomorium pharaonis)、ネオジプリオン属(Neodiprion spp.)、シュウカクアリ属(Pogonomyrmex spp)、スレノプシス・インビクタ(Slenopsis invicta)、ソレノプシス属(Solenopsis spp.)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・クムランズ(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(Acleris 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.)、ブククラトリクス・ツルベリエラ(Bucculatrix thurberiella)、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(Cnephasia spp.)、コチリス属(Cochylis spp.)、コレオフォラ属(Coleophora spp.)、コリアス・レスビア(Colias lesbia)、ワタアカキリバ(Cosmophila flava)、クラムバス属(Crambus spp)、ケブカノメイガ(Crociodomia binotalis)、クリプトフレビア・ロイコトレタ(Cryptophlebia leucotreta)、シダリマ・ペルスペクタリス(Cydalima perspectalis)、シジア属(Cydia spp.)、ジアファニア・ペルスペクタリス(Diaphania perspectalis)、ジアトラエア属(Diatraea spp.)、ジパロプシス・カスタンエ(Diparopsis castanea)、エアリアス属(Earias spp.)、エルダナ・サッカリナ(Eldana saccharina)、エフェスチア属(Ephestia spp.)、エピノチア属(Epinotia spp)、エスチグメネ・アクレア(Estigmene acrea)、エチエラ・ジンキネラ(Etiella zinckinella)、ユーコスマ属(Eucosma spp.)、ブドウホソハマキ(Eupoecilia a

10

20

30

40

50

mbiguella)、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 jaculiferia*)、グラホリタ属(*Grapholita* spp.)、ヘディア・ヌビフェラナ(*Hedya nubiferana*)、ヘリオティス属(*Heliothis* spp.)、ハイマダラノメイガ(*Hellula undalis*)、ヘルペトグラム属(*Herpetogramma* spp.)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコペルシセラ(*Keiferia lycopersicella*)、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(*Lyonetia* spp.)、マラコソマ属(*Malacosoma* spp.)、ヨトウガ(*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ(*Manduca sexta*)、ミチムナ属(*Mythimna* spp.)、ノクツア属(*Noctua* spp.)、オペロフテラ属(*Operophtera* spp.)、オルニオデス・インディカ(*Orniodes indica*)、アワノメイガ(*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属(*Pammene* spp.)、パンデミス属(*Pandemis* spp.)、マツキリガ(*Panolis flammea*)、パパイペマ・ネブリス(*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ(*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ(*Perileucoptera coffeella*)、シューダレチア・ウニプンクタ(*Pseudaletia unipuncta*)、ジャガイモガ(*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ(*Pieris rapae*)、ピエリス属(*Pieris* spp.)、コナガ(*Plutella xylostella*)、プレイス属(*Prays* spp.)、シュードブルシア属(*Pseudoplusia* spp.)、ラキプルシア・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.)、スバルガノチス属(*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.)、スカプテリスカス属(*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(*Caliothrips phaseoli*)、ハナアザミウマ属(*Franklinie*

10

20

30

40

50

lla 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)。

【0431】

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において発生する上記のタイプの有害生物を防除、すなわち抑制又は破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

10

【0432】

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;ホウレンソウ、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。

20

【0433】

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。

30

【0434】

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(Anisodonteia capsensis)、アンテミス属の種(Anthemis spp.)、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lorens(B.semperflorens)、B.チューベレウクス(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(Centaurea spp.)、キク属の種(Chrysanthemum spp.)、シネラリア属の種(Cineraria spp.) (C.マリチメ(C.maritime))、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 spectabil

40

50

is)、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*)、ヘリオトロピウム属の種(*Heliotropium* spp.)、ヘリアンツス属の種(*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*))、イレシネス属の種(*Iresines* 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.)、パ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(*Nicotinia* 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において用いられ得る。

【0435】

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 vulgarus*)、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BITA属の種 (*Cucurbita* spp.) (ペポカボチャ (*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*) のいずれかにおいて用いられ得る。

【0436】

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。

【0437】

本発明に係る有効成分は、綿、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物における、マメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除に特に好適である。本発明に係る有効成分は、ヨトウガ (*Mamestra*) (好ましくは、野菜)、コドリリング (*Cydia pomonella*) (好ましくは、リンゴ)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好ましくは、野菜、ブドウ園)、レプチノタルサ属 (*Leptinotarsa*) (好ましくは、ジャガイモ) 及びニカメイガ (*Chilo suppressalis*) (好ましくは、イネ) の防除にさらに特に好適である。

【0438】

本発明に係る有効成分は、ワタ、野菜、トウモロコシ、イネ及びダイズ作物におけるマメアブラムシ (*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ (*Diabrotica balteata*)、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、コナガ (*Plutella xylostella*) 及びエジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) を防除するのに特に好適である。本発明に係る有効成分は、マメストラ属 (*Mamestra*) (好ましくは、野菜中)、コドリリング (*Cydia pomonella*) (好ましくは、リンゴ中)、エンポアスカ属 (*Empoasca*) (好

ましくは、野菜、ブドウ園中)、レプチノタルサ属(*Leptinotarsa*)(好ましくは、ジャガイモ中)及びニカメイガ(*Chilo suppressalis*)(好ましくは、イネ中)を防除するのにさらに特に好適である。

【0439】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫(内部寄生性、半内部寄生性及び外部寄生性線虫)、特にネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ(*Meloidogyne hapla*)、サツマイモネコブセンチュウ(*Meloidogyne incognita*)、ジャワネコブセンチュウ(*Meloidogyne javanica*)、アレナリアネコブセンチュウ(*Meloidogyne arenaria*)及び他のメロイドギネ属(*Meloidogyne*)種;シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ(*Globodera rostochiensis*)及び他のグロボデラ属(*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*)及び他のヘテロデラ属(*Heterodera*)種;タネコブセンチュウ、アングナ属(*Anguina*)種;クキセンチュウ及びハセンチュウ、アフエレンコイデス属(*Aphelenchoides*)種;刺毛センチュウ(*Sting nematode*)、ベロノライムス・ロンギカウダツス(*Belonolaimus longicaudatus*)及び他のベロノライムス属(*Belonolaimus*)種;マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ(*Bursaphelenchus xylophilus*)及び他のバーサフエレンカス属(*Bursaphelenchus*)種;ワセンチュウ(*Ring nematode*)、クリコネマ属(*Criconema*)種、クリコネメラ属(*Criconemella*)種、クリコネモイデス属(*Criconemoides*)種、メソクリコネマ属(*Mesocriconema*)種;クキ及びリンケイセンチュウ、イモグサレセンチュウ(*Ditylenchus destructor*)、ナミクキセンチュウ(*Ditylenchus dipsaci*)及び他のジチレンクス属(*Ditylenchus*)種;キリセンチュウ(*Awl nematode*)、ドリコドルス属(*Dolichodorus*)種;ラセンセンチュウ(*Spiral nematode*)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス(*Helicotylenchus multicinctus*)及び他のヘリオコチレンクス属(*Helicotylenchus*)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*)種;ヤリセンチュウ(*Lance nematode*)、ホプロライムス(*Hoploaimus*)種;ニセネコブセンチュウ、ナコブス属(*Nacobbus*)種;ハリセンチュウ(*Needle nematode*)、ロンギドルス・エロンガツス(*Longidorus elongatus*)及び他のロンギドルス属(*Longidorus*)種;ピンセンチュウ(*Pin nematode*)、プラチレンクス属(*Pratylenchus*)種;ネグサレセンチュウ(*Lesion nematode*)、ムギネグサレセンチュウ(*Pratylenchus neglectus*)、キタネグサレセンチュウ(*Pratylenchus penetrans*)、プラチレンクス・カービタツス(*Pratylenchus curvittatus*)、プラチレンクス・ゴオデイ(*Pratylenchus goodeyi*)及び他のプラチレンクス属(*Pratylenchus*)種;ネモグリセンチュウ(*Burrowing nematode*)、バナナネモグリセンチュウ(*Radopholus similis*)及び他のラドホルス属(*Radopholus*)種;ニセフクロセンチュウ(*Reniform nematode*)、ロチレンクス・ロブスタス(*Rotylenchus robustus*)、ロチレンクス・レニフォルミス(*Rotylenchus reniformis*)及び他のロチレンクス属(*Rotylenchus*)種;スクテロネマ属(*Scutellonema*

10

20

30

40

50

種；ミハリセンチュウ (*Stubby root nematode*)、トリコドルス・プリミチプス (*Trichodorus primitivus*) 及び他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種；イシュクセンチュウ (*Stunt nematode*)、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*)、チレンコリンクス・デュビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) 及び他のチレンコリンクス属 (*Tylenchorhynchus*) 種；ミカンセンチュウ (*Citrus nematode*)、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) 種；オオハリセンチュウ (*Dagger nematode*)、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫；並びにスバングナ属 (*Subanguina* spp.)、ヒブソペリン属 (*Hypsoperine* spp.)、マクロポストニア属 (*Macroposthonia* spp.)、メリニウス属 (*Melinius* spp.)、プンクトデラ属 (*Punctodera* spp.) 及びキニスルシウス属 (*Quinisulcius* spp.) などの他の植物寄生性線虫種による植物及び植物の部分への被害を防除する方法にも関する。

10

【0440】

本発明の化合物は、軟体動物に対しても活性を有し得る。軟体動物の例としては、例えば、スクミリングガイ科 (*Ampullariidae*)；アリオン属 (*Arion*) (*コウラクロナメクジ* (*A. ater*)、*A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*)、*A. ホルテンシス* (*A. hortensis*)、*A. ルーフラス* (*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 (*Deroceras*) (*D. アグレスチス* (*D. agrestis*)、*D. エムピリコルム* (*D. empiricorum*)、*D. ラエヴェ* (*D. laeve*)、*D. レチクラツム* (*D. reticulatum*))；ディスクス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*))；ユーオムファリア属 (*Euomphalia*)；ガルバ属 (*Galba*) (*G. トルンクラタ* (*G. trunculata*))；ヘリセリア属 (*Helicelina*) (*H. イタラ* (*H. itala*)、*H. オブヴィア* (*H. obvia*))；マイマイ科 (*Helicidae*) *ヘリシゴナ・アルブストルム* (*Helicigona arbustorum*)；ヘリコディスクス属 (*Helicodiscus*)；ヘリクス属 (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*))；リマックス属 (*Limax*) (*L. シネレオニゲル* (*L. cinereoniger*)、*キイロナメクジ* (*L. flavus*)、*チャコウラナメクジ* (*L. marginatus*)、*マダラコウラナメクジ* (*L. maximus*)、*L. テネルス* (*L. tenellus*))；モノアラガイ属 (*Lymnaea*)；ミラックス属 (*Milax*) (*ニワコウラナメクジ* (*M. gagates*)、*M. マルギナツス* (*M. marginatus*)、*M. ソウエルバイ* (*M. sowerbyi*))；オペアス属 (*Opeas*)；リンゴガイ属 (*Pomacea*) (*スクミリングガイ* (*P. canaticulata*))；ミジンマイマイ属 (*Vallonia*) 及びザニトイデス属 (*Zanitoidea*) が挙げられる。

20

30

40

【0441】

「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。

【0442】

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 - エンドトキシン、例えば Cr

50

y 1 A b、C r y 1 A c、C r y 1 F、C r y 1 F a 2、C r y 2 A b、C r y 3 A、C r y 3 B b 1 又は C r y 9 C 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 *Vip* 1、*Vip* 2、*Vip* 3 又は *Vip* 3 A；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 luminescens*)、キセノラブダス・ネマトフィルス (*Xenorhabdus nematophilus*) などのフォトラブダス属 (*Photorhabdus* spp.) 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、パパ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 - R I P、アブリン、ルフィン、サポリン又はブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (R I P)；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 - U D P - 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、H M G - C O A - 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。

10

20

【 0 4 4 3 】

本発明に関して、 - エンドトキシンは、例えば、C r y 1 A b、C r y 1 A c、C r y 1 F、C r y 1 F a 2、C r y 2 A b、C r y 3 A、C r y 3 B b 1 又は C r y 9 C 又は植物性殺虫タンパク質 (*Vip*)、例えば *Vip* 1、*Vip* 2、*Vip* 3 又は *Vip* 3 A、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み合わ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 0 2 / 1 5 7 0 1 号を参照されたい)。切断毒素、例えば切断 C r y 1 A b 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 C r y 3 A 0 5 5 の場合、カテプシン - G - 認識配列が、C r y 3 A 毒素に挿入される (国際公開第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号を参照されたい)。

30

【 0 4 4 4 】

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 0 3 7 4 7 5 3 号明細書、国際公開第 9 3 / 0 7 2 7 8 号、国際公開第 9 5 / 3 4 6 5 6 号、欧州特許出願公開第 0 4 2 7 5 2 9 号明細書、欧州特許出願公開第 4 5 1 8 7 8 号明細書及び国際公開第 0 3 / 0 5 2 0 7 3 号に開示されている。

【 0 4 4 5 】

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。C r y I 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 9 5 / 3 4 6 5 6 号、欧州特許出願公開第 0 3 6 7 4 7 4 号明細書、欧州特許出願公開第 0 4 0 1 9 7 9 号明細書及び国際公開第 9 0 / 1 3 6 5 1 号から公知である。

40

【 0 4 4 6 】

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

【 0 4 4 7 】

50

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、Yield Gard (登録商標) (Cry 1 Ab 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Rootworm (登録商標) (Cry 3 B b 1 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Yield Gard Plus (登録商標) (Cry 1 Ab 及び Cry 3 B b 1 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Starlink (登録商標) (Cry 9 C 毒素を発現するトウモロコシ品種) ; Herculex I (登録商標) (Cry 1 Fa 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ラーゼ (PAT) を発現するトウモロコシ品種) ; NuCOTN 33B (登録商標) (Cry 1 Ac 毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard I (登録商標) (Cry 1 Ac 毒素を発現するワタ品種) ; Bollgard II (登録商標) (Cry 1 Ac 及び Cry 2 Ab 毒素を発現するワタ品種) ; VipCot (登録商標) (Vip 3 A 及び Cry 1 Ab 毒素を発現するワタ品種) ; NewLeaf (登録商標) (Cry 3 A 毒素を発現するジャガイモ品種) ; NatureGard (登録商標) 、 Agrisure (登録商標) GT Advantage (GA 21 グリホサート耐性形質) 、 Agrisure (登録商標) CB Advantage (Bt 11 アワノメイガ (CB) 形質) 及び Protecta (登録商標) である。

【0448】

このようなトランスジェニック作物のさらなる例は、以下のとおりである：

1. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F - 31 790 St. Sauveur, France) 製の Bt 11 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。切断 Cry 1 Ab 毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (Ostrinia nubilalis)) 及びセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt 11 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 PAT も遺伝子組み換えにより発現する。

【0449】

2. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F - 31 790 St. Sauveur, France) 製の Bt 176 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。Cry 1 Ab 毒素のトランスジェニック発現により、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (Ostrinia nubilalis)) 及びセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides)) による攻撃に対する耐性を与えられた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt 176 トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素 PAT も遺伝子組み換えにより発現する。

【0450】

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F - 31 790 St. Sauveur, France) 製の MIR 604 トウモロコシ、登録番号 C / FR / 96 / 05 / 10。改変 Cry 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 Cry 3 A 055 である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第 03 / 018810 号に記載されている。

【0451】

4. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium) 製の MON 863 トウモロコシ、登録番号 C / DE / 02 / 9。MON 863 は、Cry 3 B b 1 毒素を発現し、特定の鞘翅目 (Coleoptera) 昆虫に対する耐性を有する。

【0452】

5. Monsanto Europe S.A. (270 - 272 Avenue de Tervuren, B - 1150 Brussels, Belgium) 製のIPC 531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

【0453】

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 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Cry 1F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。

【0454】

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 EPS PS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Cry 1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。

【0455】

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。

【0456】

「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。

【0457】

作物は、真菌 (例えば、フザリウム属 (Fusarium)、炭疽病又はフィトトラ属 (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。

【0458】

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。

【0459】

非生物的ストレスに耐性である作物は、例えば、NF-YB又は当技術分野において公知である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。

【0460】

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

10

20

30

40

50

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、国際公開第95/33818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03/000906号に記載されている、いわゆる「植物病害抵抗性遺伝子」）が挙げられる。

【0461】

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）、床仕上げ材及び建築物の保護及び衛生分野において、特に上記のタイプの有害生物からのヒト、家畜及び生産性家畜の保護である。

10

【0462】

本発明は、治療において用いられる第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／又は処置において用いられる第1の態様の化合物をさらに提供する。

【0463】

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。

20

【0464】

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。

【0465】

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。

30

【0466】

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。

【0467】

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、動物内において進展する症状又は病害の回避を指す。

【0468】

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

【0469】

「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（Acarina）（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

50

イタマダニ属 (*Rhipicaphalus*)、例えばオウシマダニ (*Rhipicaphalus (Boophilus) microplus*) 及びクリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*) ; キラマダニ属 (*Amblyomma*) ; カクマダニ属 (*Dermacentor*) ; チマダニ属 (*Haemaphysalis*) ; イボマダニ属 (*Hyalomma*) ; マダニ属 (*Ixodes*) ; リピセントール属 (*Rhipicentor*) ; マルガロプス属 (*Margaropus*) ; ナガヒメダニ属 (*Argas*) ; オトビウス属 (*Otobius*) ; 及びカズキダニ属 (*Ornithodoros*) が挙げられる。ダニとしては、これらに限定されないが、以下の属の構成員 : ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes*)、例えばウシショクヒヒゼンダニ (*Chorioptes bovis*) ; キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes*)、例えばヒツジキュウセンヒゼンダニ (*Psoroptes ovis*) ; ツメダニ属 (*Cheyletiella*) ; デルマニッスス属 (*Dermanyssus*) ; 例えばワクモ (*Dermanyssus gallinae*) ; イエダニ属 (*Ornithonyssus*) ; ニキビダニ属 (*Demodex*)、例えばイヌニキビダニ (*Demodex canis*) ; サルコプテス属 (*Sarcoptes*)、例えばヒゼンダニ (*Sarcoptes scabiei*) ; 及びヒツジツメダニ属 (*Psorergates*) が挙げられる。昆虫としては、これらに限定されないが、以下の目の構成員 : ノミ目 (*Siphonaptera*)、双翅目 (*Diptera*)、咀嚼目、鱗翅目 (*Lepidoptera*)、鞘翅目 (*Coleoptera*) 及び同翅目 (*Homoptera*) が挙げられる。ノミ目 (*Siphonaptera*) の構成員としては、これらに限定されないが、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*) 及びイヌノミ (*Ctenocephalides canis*) が挙げられる。双翅目 (*Diptera*) の構成員としては、これらに限定されないが、イエバエ属の種 (*Musca spp.*) ; ウマバエ、例えばウマバエ (*Gasterophilus intestinalis*) 及びヒツジバエ (*Oestrus ovis*) ; サシバエ ; アブ、例えばゴマフアブ属の種 (*Haematopota spp.*) 及びタブヌス属の種 (*Tabanus spp.*) ; ヘマトビア属 (*haematobia*)、例えばノサシバエ (*haematobia irritans*) ; サシバエ属 (*Stomoxys*) ; ギンバエ属 (*Lucilia*) ; ユスリカ ; 並びに蚊が挙げられる。咀嚼目の構成員としては、これらに限定されないが、吸血シラミ及び刺咬性のシラミ、例えばヒツジハジラミ (*Bovicola Ovis*) 及びウシハジラミ (*Bovicola Bovis*) が挙げられる。

【0470】

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、「有効量」という用語は、本発明又はその塩の化合物の量又は投与量であって、動物への一回又は複数回の投与量において動物内又は上で所望の効果が得られるものを指す。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、当業者としての担当の診断医によって容易に判定され得る。有効量の判定では、特に、これらに限定されないが、哺乳類の種 ; そのサイズ、年齢及び一般的な健康状態 ; 防除される寄生生物及び侵襲の程度 ; 関連する特定の病害又は障害 ; 病害又は障害の程度又は合併症又は重症度 ; 固体の応答 ; 投与される特定の化合物 ; 投与モード ; 投与される調製物のバイオアベイラビリティ特徴 ; 選択される投与量投与計画 ; 併用薬の使用 ; 並びに他の関連する状況を含む多数の要因が担当の診断医によって考慮される。

【0471】

本発明の化合物は、特に、これらに限定されないが、局部、経口、非経口及び皮下を含む、所望の効果を有するいずれかの経路によって動物に投与され得る。局部投与が好ましい。局部投与に好適な配合物としては、例えば、溶液、エマルジョン及び懸濁液が挙げられ、ポアオン、スポットオン、スプレーオン、スプレーレース又はディップの形態であり得る。代わりに、本発明の化合物は、耳標又はカラーによって投与され得る。

【0472】

本発明の化合物の塩形態は、農芸化学的に許容可能な塩と異なり得る薬学的に許容可能

10

20

30

40

50

な塩及び獣医学的に許容可能な塩の両方を含む。薬学的及び獣医学的に許容可能な塩並びにこれらを調製するための一般的な方法論は、当技術分野において周知である。例えば、Gould, P. L., "Salt selection for basic drugs", 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。

【0473】

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する。一実施形態において、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。別の実施形態において、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。

【0474】

一実施形態において、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。別の実施形態において、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。

【0475】

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。

【0476】

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／幹処理の分野である。

【0477】

樹幹注入／幹処理の分野において、本発明に係る化合物は、上記の鱗翅目（Lepidoptera）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る。

【 0 4 7 8 】

【表 2】

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)	アノプラ・グラブリペンニス (<i>Anoplua 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

【 0 4 7 9 】

20

30

40

50

【表 3 - 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
	クリソボトリス・フェモラタ (<i>Chrysobothris femorata</i>)	リンゴ、アンズ、ブナ、トネリコバノカ エデ、サクランボ、クリ、スグリ、ニ レ、サンザシ、エノキ、ヒッコリー、セ イヨウトチノキ、リンデン、カエデ、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 ブスベリー、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・プルベルレンツス(<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、サクランボ、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

10

20

30

40

50

【表 3 - 2】

科	種	寄生される宿主又は作物
		チ、ハナミズキ、ユーカリ属 (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、サクランボ、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・プリーノス (<i>Pseudopityophthorus pruinosis</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、サクランボ、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、サクランボ、ブナ、アメリカザクラ
	シナンテドン・ルブロファスシア (<i>Synanthedon rubrofascia</i>)	アメリカヌマミズキ
	シナンテドン・シツラ (<i>Synanthedon scitula</i>)	ハナミズキ、ペカン、ヒッコリー、オーク、クリ、ブナ、カバノキ、アメリカザクラ、ニレ、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

【0480】

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 pearl)、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使用され得る。

【0481】

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

えば、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. majalis*)、コチヌス属 (*Cotinus spp.*) (例えば、アオコフキコガネ、*C. nitida*)、ポピリア属 (*Popillia spp.*) (例えば、マメコガネ (*Japanese beetle*)、*P. japonica*)、フィロファガ属 (*Phyllophaga 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. spretnus*)、マラデラ属 (*Maladera spp.*) (例えば、アカピロウドコガネ、*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; スカプテリスキス属 (*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ーンフライ (*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。

【0482】

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. 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。

【0483】

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 cynodoniensis*))、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・ピシンクタ (*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。

【0484】

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。

【0485】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ (*hard tick*)、ヒメダニ (*soft tick*)、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ (サシバエ及び舐性 (*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る。

【0486】

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*

10

20

30

40

50

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 (*Phtirus* spp.)、ソレノポテス属 (*Solenopotes* spp.)。

【0487】

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

10

【0488】

双翅目 (*Diptera*) 並びにその亜目であるネマトセリナ亜目 (*Nematocetrina*) 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.)、ツノマユブヨ属 (*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 (*Meiophagus* spp.)。

20

30

【0489】

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.)。

【0490】

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

【0491】

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

【0492】

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 (*Argas* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、オトビ

50

ウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、キラマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Haemophysalis* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニスス属 (*Dermanyssus* spp.)、ライリエチア属 (*Raillietia* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.) 及びバロア属 (*Varroa* spp.)。

【0493】

ダニ目 (*Actiniedida*) (前気門類 (*Prostigmata*)) 及びカイチュウ目 (*Acaridida*) (コナダニ亜目 (*Astigmata*)) のうち、例えばアカラピス属 (*Acarapis* spp.)、ツメダニ属 (*Cheyletiella* spp.)、オルニソケイレチア属 (*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属 (*Myobia* spp.)、ヒツジツメダニ属 (*Psorergates* spp.)、ニキビダニ属 (*Demodex* spp.)、ツツガムシ属 (*Trombicula* spp.)、リストロホルス属 (*Listrophorus* spp.)、コナダニ属 (*Acarus* spp.)、チロファグス属 (*Tyrophagus* spp.)、ゴミコナダニ属 (*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属 (*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属 (*Pterolichus* spp.)、キュウセンヒゼンダニ属 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属 (*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属 (*Otodectes* spp.)、ヒゼンダニ属 (*Sarcoptes* spp.)、ショウセンコウヒゼンダニ属 (*Notoedres* spp.)、クネミドコプテス属 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属 (*Cytodites* spp.) 及びラミノシオプテス属 (*Laminosioptes* spp.)。

【0494】

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好適である。

【0495】

本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ (*Hylotrupes bajulus*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosis*)、アノビウム・プンクタツム (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホピロスム (*Xestobium rufovillosum*)、プチリヌスペクチコルニス (*Ptilinus pecticornis*)、デンドロビウム・ベルチネクス (*Dendrobium pertinex*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Priobium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)、アフリカヒラタキクイムシ (*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ (*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ (*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンス (*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・アエクアレ (*Trogoxylon aequale*)、ミンテスルギコリス (*Minthes rugicollis*)、キシルボルス属種 (*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種 (*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス (*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシンス (*Bostrychus capucins*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス (*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種 (*Sinoxylon spec.*) 及びチピタケナガシンクイムシ (*Dinoderus minutus*) などの甲虫並びにさらにコルリキバチ (*Sirex juvencus*)、モミノオオキバチ (*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス (*Urocer*

10

20

30

40

50

us 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 (Mastoterme 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。式 I 及び I' a の化合物又はその塩は、科：ヤガ科 (Noctuidae)、クチブサガ科 (Plutellidae)、ハムシ科 (Chrysomelidae)、アザミウマ科 (Thripidae)、カメムシ科 (Pentatomidae)、ハマキガ科 (Tortricidae)、ウンカ科 (Delphacidae)、アリマキ科 (Aphididae)、ヤガ科 (Noctuidae)、ツトガ科 (Crambidae)、ロイドギネ科 (Meloidogynidae) 及びシストセンチュウ科 (Heteroderidae) 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。各態様の好ましい実施形態において、化合物 TX (ここで、略語「TX」は、「表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P において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、科：ヤガ科 (Noctuidae)、クチブサガ科 (Plutellidae)、ハムシ科 (Chrysomelidae)、アザミウマ科 (Thripidae)、カメムシ科 (Pentatomidae)、ハマキガ科 (Tortricidae)、ウンカ科 (Delphacidae)、アリマキ科 (Aphididae)、ヤガ科 (Noctuidae)、ツトガ科 (Crambidae)、ロイドギネ科 (Meloidogynidae) 及びシストセンチュウ科 (Heteroderidae) から選択される 1 種以上の有害生物を防除する。

【0496】

式 I 及び I' a の化合物又はその塩は、属：スポドプテラ属の種 (Spodoptera spp)、プルテラ属の種 (Plutella spp)、ハナアザミウマ属の種 (Frankliniella spp)、トリプス属の種 (Thrips spp)、ユースキスツス属の種 (Euschistus spp)、シジア属の種 (Cydia spp)、ニラバルバタ属の種 (Nilaparvata spp)、ミズス属の種 (Myzus spp)、ワタアブラムシ属の種 (Aphis spp)、ジアブロチカ属の種 (Diabrotica spp)、ロパロシフム属の種 (Rhopalosiphum spp)、シュードブルシア属の種 (Pseudoplusia spp) 及びキ口属の種 (Chilo spp) 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。各態様の好ましい実施形態において、化合物 TX (ここで、略語「TX」は、「表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P において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、属：スポドプテラ属の種 (Spodoptera spp)、プルテラ属の種 (Plutella spp)、ハナアザミウマ属の種 (Frankliniella spp)、トリプス属の種 (Thrips spp)、ユースキスツス属の種 (Euschistus spp)、シジア属の種 (Cydia spp)、ニラバルバタ属の種 (Nilaparvata spp)、ミズス属の種 (Myzus spp)、ワタアブラムシ属の種 (Aphis spp)、ジアブロチカ属の種 (Diabrotica spp)、ロパロシフム属の種 (Rhopalosiphum spp)、シュードブルシア属の種 (Pseudoplusia spp) 及びキ口属の種 (Chilo spp) から選択される 1 種以上の有害生物を防除する。

【0497】

式 I 及び I' a の化合物又はその塩は、エジプトヨトウ (Spodoptera lit

toralis)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ユースキスツス・ヘロス(*Euschistus heros*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、クリソデイキス・インクルデンス(*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウム・パディ(*Rhopalosiphum padi*)及びニカメイガ(*Chilo suppressalis*)の1種以上の防除に特に好適である。

10

【0498】

各態様の好ましい実施形態において、化合物TX(ここで、略語「TX」は、「表A-1~A-297及び表Pにおいて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、エジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ユースキスツス・ヘロス(*Euschistus heros*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、クリソデイキス・インクルデンス(*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウム・パディア(*Rhopalosiphum Padi*)並びにエジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)+TX、コナガ(*Plutella xylostella*)+TXなどのニカメイガ(*Chilo suppressalis*)；ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)+TX、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)+TX、ユースキスツス・ヘロス(*Euschistus heros*)+TX、コドリング(*Cydia pomonella*)+TX、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)+TX、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)+TX、クリソデイキス・インクルデンス(*Chrysodeixis includens*)+TX、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)+TX、ジアブロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)+TX、ロパロシフウム・パディ(*Rhopalosiphum Padi*)+TX及びニカメイガ(*Chilo suppressalis*)+TXの1種以上を防除する。

20

30

【0499】

各態様の一実施形態において、表A-1~A-297及び表Pにおいて定義されている化合物から選択される1種の化合物は、綿、野菜、トウモロコシ、穀類、イネ及びダイズ作物における、エジプトヨトウ(*Spodoptera littoralis*)、コナガ(*Plutella xylostella*)、ミカンキイロアザミウマ(*Frankliniella occidentalis*)、ネギアザミウマ(*Thrips tabaci*)、ユースキスツス・ヘロス(*Euschistus heros*)、コドリング(*Cydia pomonella*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)、クリソデイキス・インクルデンス(*Chrysodeixis includens*)、マメアブラムシ(*Aphis craccivora*)、ジアブロチカ・バルテアタ(*Diabrotica balteata*)、ロパロシフウム・パディア(*Rhopalosiphum Padi*)及びニカメイガ(*Chilo suppressalis*)の防除に好適である。

40

【0500】

一実施形態において、表A-1~A-297及び表Pにおいて定義されている化合物から選択される1種の化合物は、ヨトウガ(*Mamestra*)(好ましくは野菜における

50

もの)、コドリング(*Cydia pomonella*)(好ましくはリンゴにおけるもの)、エンポアスカ属(*Empoasca*)(好ましくは野菜、ブドウ園におけるもの)、レプチノタルサ属(*Leptinotarsa*)(好ましくはジャガイモにおけるもの)及びニカメイガ(*Chilo suppressalis*)(好ましくはイネにおけるもの)の防除に好適である。

【0501】

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活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。

10

【0502】

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 of 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。

20

【0503】

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。

30

【0504】

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。封入メンブレンは、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。

40

【0505】

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

50

、 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、ジブロピレングリコール、ジブロピレングリコールメチルエーテル、ジブロピレングリコールジベンゾエート、ジブロキシトール、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。

【0506】

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

【0507】

多数の表面活性物質は、固体及び液体配合物の両方において、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リア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., Ridgewood New Jersey (1981) に記載のさらなる物質が挙げられる。

【0508】

有害生物防除配合物において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。

【0509】

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0.01~10%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、the Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010から公知である。

【0510】

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。

【0511】

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。

【0512】

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%

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%

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%

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%

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%

【0513】

以下の例は、本発明をさらに例示するが、限定するものではない。

【 0 5 1 4 】

【表 4】

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 %
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 %	—

10

【 0 5 1 5 】

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可能である水和剤を得る。

【 0 5 1 6 】

【表 5】

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 5 1 7 】

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。

【 0 5 1 8 】

【表 6】

乳化性濃縮物	
有効成分	10 %
オクチルフェノールポリエチレングリコールエーテル(4~5 mol 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 %
ひまし油ポリグリコールエーテル(35 mol のエチレンオキシド)	4 %
シクロヘキサノン	30 %
キシレン混合物	50 %

30

40

【 0 5 1 9 】

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が可能である。

【 0 5 2 0 】

50

【表 7】

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 %

【0521】

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中において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ることができる。

10

【0522】

【表 8】

押出し顆粒	
有効成分	15 %
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	82 %

20

【0523】

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、次いで空気流中において乾燥させる。

【0524】

【表 9】

被覆顆粒	
有効成分	8 %
ポリエチレングリコール(mol. wt. 200)	3 %
カオリン	89 %

30

【0525】

ミキサ中において、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。

【0526】

【表 10】

懸濁液濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	10 %
ノニルフェノールポリエチレングリコールエーテル(15 mol のエチレンオキシド)	6 %
リグノスルホン酸ナトリウム	10 %
カルボキシメチルセルロース	1 %
シリコン油(水中の 75 %エマルジョンの形態)	1 %
水	32 %

40

【0527】

50

微細に粉砕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可能である。このような希釈を用いて、生存している植物及び植物繁殖体を、吹付け、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による外寄生に対して処理及び保護することが可能である。

【 0 5 2 8 】

【表 1 1】

種子処理用のフロアブル濃縮物

有効成分	40 %
プロピレングリコール	5 %
コポリマーブタノール PO/EO	2 %
10～20 モルの EO を含むトリスチレンフェノール	2 %
1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン(水中 20%の溶液の形態)	0.5 %
モノアゾ顔料カルシウム塩	5 %
シリコーン油(水中 75%の乳剤の形態)	0.2 %
水	45.3 %

10

【 0 5 2 9 】

この微粉化された組み合わせは、補助剤と均質混合され、懸濁液濃縮物が得られ、この懸濁液濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物並びに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけ又は浸漬により、微生物による寄生から保護され得る。

20

【 0 5 3 0 】

緩効性カプセル懸濁液

2 8 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 . 0 5 部の脱泡剤及び 5 1 . 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 . 2 5 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、2 8 % の有効成分を含有する。中型カプセルの直径は、8 ~ 1 5 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中において、水性懸濁液として種子に適用する。

30

【 0 5 3 1 】

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) 又は農学的に許容可能な補助剤と組み合わせられるいずれかの技術的に好ましい配合物が挙げられる。

40

【実施例】

【 0 5 3 2 】

調製例：

L C M S 法：

方法 1：スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性：陽イオン及び陰イオン、キャピラリ：3 . 0 0 k V、コーン範囲：3 0 V、抽出器：2 . 0 0 V、ソース温度：1 5 0 、脱溶剤温度：3 5 0 、コーンガス流：5 0 l / h、脱溶剤ガス流：6 5 0 l / h、質量範囲：1 0 0 ~ 9 0 0 D a) を備える W a t e r s 製の質量分光計 (S Q D、S Q

50

D I I シングル四重極型質量分光計) 並びにW a t e r s 製のA c q u i t y U P L C : 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E L S D 検出器で記録した。カラム: W a t e r s U P L C H S S T 3、1.8 μm、30 × 2.1 mm、温度: 60、D A D 波長範囲 (nm): 210 ~ 500、溶剤勾配: A = 水 + 5% M e O H + 0.05% H C O O H、B = アセトニトリル + 0.05% H C O O H、勾配: 1.2 分間で10 ~ 100% のB; 流れ (ml / 分) 0.85。

【0533】

方法2: スペクトルを、エレクトロスプレーソース (極性: 陽イオン及び陰イオン)、キャピラリ: 3.00 kV、コーン範囲: 30 V、抽出器: 2.00 V、ソース温度: 150、脱溶剤温度: 350、コーンガス流: 50 l / h、脱溶剤ガス流: 650 l / h、質量範囲: 100 ~ 900 Da) を備えるW a t e r s 製の質量分光計 (S Q D、S Q D I I シングル四重極型質量分光計) 並びにW a t e r s 製A c q u i t y U P L C : 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E L S D 検出器で記録した。カラム: W a t e r s U P L C H S S T 3、1.8 μm、30 × 2.1 mm、温度: 60、D A D 波長範囲 (nm): 210 ~ 500、溶剤勾配: A = 水 + 5% M e O H + 0.05% H C O O H、B = アセトニトリル + 0.05% H C O O H、勾配: 2.7 分間で10 から100% のB; 流量 (ml / min) 0.85。

【0534】

方法3:

質量分光計: W a t e r s S Q D e t e c t o r 2 質量分光計

H P L C : U P L C 「H」クラス + Q u a t e r n a r y G r a d i e n t

最適化質量パラメータ: -

イオン化法: エレクトロスプレー (E S I)

極性: 陽及び陰極性スイッチ

走査タイプ: フル走査

キャピラリ (kV): 3.00

コーン電圧 (V): 41.00

ソース温度 (): 150

脱溶剤ガス流 (L / Hr): 1000

脱溶剤温度 (): 500

コーンにおけるガス流 (L / Hr): 50

質量範囲: 110 ~ 800 Da

最適化クロマトグラフィパラメータ: -

勾配条件:

溶剤A: 水 + 0.1% 酢酸: アセトニトリル: : 95 : 5 v / v

溶剤B: アセトニトリル + 0.05% 酢酸

時間 (分) A (%) B (%) 流量 (ml / min)

0 90 10 0.6

0.2 50 50 0.6

0.7 0 100 0.6

1.3 0 100 0.6

1.4 90 10 0.6

1.6 90 10 0.6

P D A 波長範囲: 200 ~ 400 nm

カラム: A c q u i t y U P L C H S S T 3 C 1 8

カラム長: 30 mm

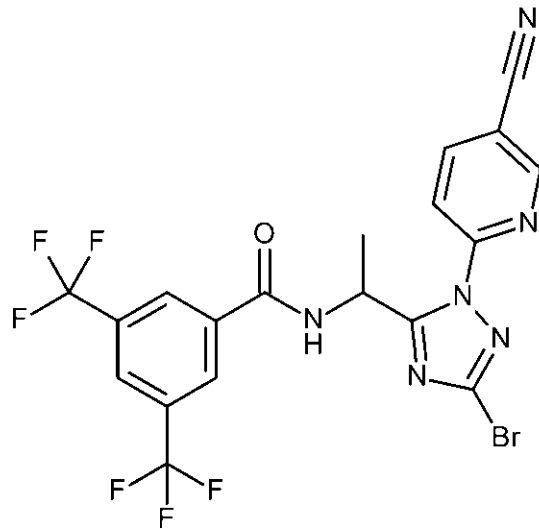
カラム内径: 2.1 mm

粒径: 1.8 μ

カラムオープン温度: 40

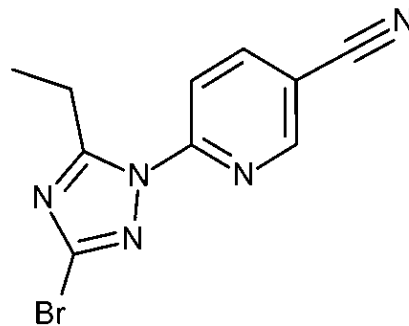
【0535】

実施例 1 : N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 1 1) の調製
【化 4 1】



(P11)

ステップ 1 : 6 - (3 - ブロモ - 5 - エチル - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 3 - カルボニトリル (中間体 I 1) の調製
【化 4 2】



(I1)

アルゴン雰囲気下において水素化ナトリウムをバイアルに入れ、乾燥ジメチルホルムアミド (20 mL) を添加した。3 - ブロモ - 5 - エチル - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール (CAS : 15777 - 58 - 9、1.00 g、5.68 mmol) の乾燥ジメチルホルムアミド (6.0 mL) 中の溶液を室温で数回に分けて添加した。この反応混合物を室温で 30 分間攪拌し、その後、6 - ブロモピリジン - 3 - カルボニトリル (CAS : 139585 - 70 - 9、1.25 g、6.82 mmol) を添加し、得られた混合物を室温で 1 時間攪拌した。この反応混合物を酢酸エチルで希釈し、有機層を水 (5 × 20 mL) 、塩水で 1 回洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させた。粗生成物をシリカゲルにおけるクロマトグラフィにより精製して、6 - (3 - ブロモ - 5 - エチル - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 3 - カルボニトリルを得た。

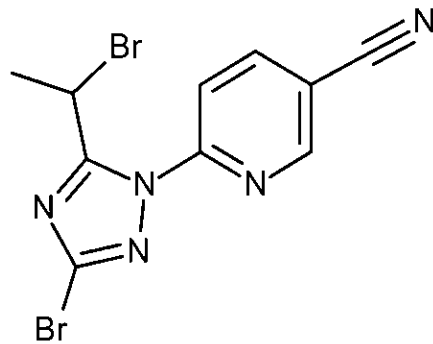
^1H NMR (400 MHz , クロロホルム - d) ppm : 1.43 (t , J = 7.34 Hz , 3 H) 3.37 (q , J = 7.58 Hz , 2 H) 8.07 - 8.12 (m , 1 H) 8.12 - 8.19 (m , 1 H) 8.76 - 8.83 (m , 1 H) .

LC - MS (方法 1) : 保持時間 0.93 分間、m / z 280 [M + H⁺] .

【 0 5 3 6 】

ステップ 2 : 6 - [3 - ブロモ - 5 - (1 - ブロモエチル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリル (中間体 I 2) の調製

【 化 4 3 】



(I2)

6 - (3 - ブロモ - 5 - エチル - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 3 - カルボニトリル (0 . 9 8 g 、 3 . 5 2 m m o l) 、 N - ブロモスクシンイミド (1 . 9 4 g 、 1 0 . 6 m m o l 、 3 . 0 1 当量) 及び過酸化ベンゾイル (0 . 0 1 4 g 、 0 . 0 5 6 m m o l 、 0 . 0 1 6 当量) のアセトニトリル (1 2 m L) 中の混合物を、シールしたバイアル中において 1 4 時間加熱還流した。N - ブロモスクシンイミド (0 . 3 2 3 g 、 1 . 7 6 m m o l 、 0 . 5 0 当量) 及び過酸化ベンゾイル (0 . 0 2 9 g 、 0 . 1 1 2 m m o l 、 0 . 0 3 2 当量) を再度添加し、バイアルをアルゴンでパージし、封止し、2 時間超にわたって 8 0 ° に加熱した。この反応混合物を減圧下で濃縮し、次いでシリカゲルにおけるクロマトグラフィにより精製して、6 - [3 - ブロモ - 5 - (1 - ブロモエチル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリルを得た。

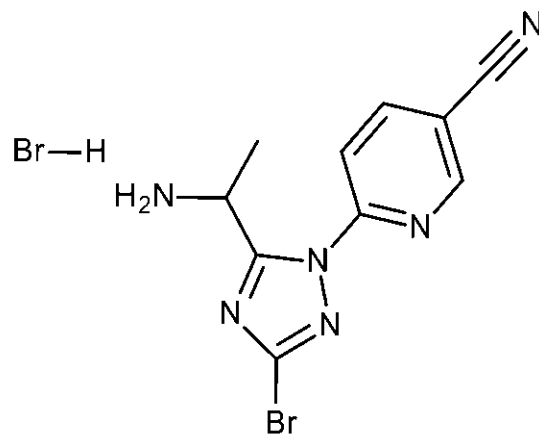
^1H NMR (4 0 0 M H z , クロロホルム - d) δ : 2 . 2 2 (d , J = 6 . 9 7 H z , 3 H) 6 . 3 7 (q , J = 6 . 9 7 H z , 1 H) 8 . 0 8 - 8 . 1 4 (m , 1 H) 8 . 1 6 - 8 . 2 3 (m , 1 H) 8 . 8 4 (d , J = 1 . 4 7 H z , 1 H) .

LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 0 2 分間、 m/z 3 5 6 - 3 5 8 - 3 6 0 [$M + H^+$] .

【 0 5 3 7 】

ステップ 3 : 6 - [5 - (1 - アミノエチル) - 3 - ブロモ - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリル臭化水素酸塩 (中間体 I 3) の調製

【 化 4 4 】



(I3)

6 - [3 - ブロモ - 5 - (1 - ブロモエチル) - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル

] ピリジン - 3 - カルボニトリル (0 . 5 7 g 、 1 . 5 9 6 m m o l) のアンモニア溶液 (メタノール中に 7 M 、 2 9 m L) 中の混合物を室温で 1 5 時間撹拌した。この反応混合物を蒸発させ、次のステップにおいて粗生成物として用いた。

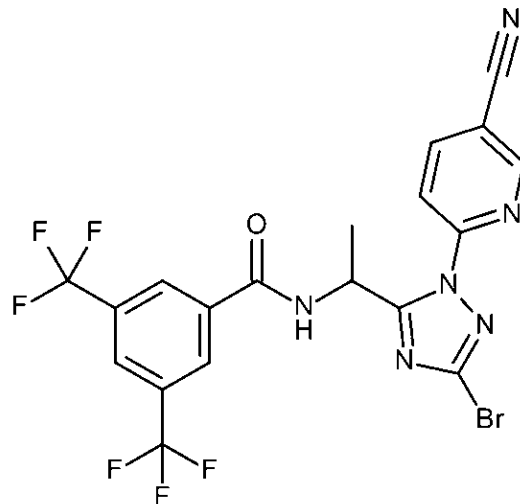
LC - MS (方法 1) : 保持時間 0 . 6 6 分間、 m/z 2 9 3 [$M + H^+$] (臭化水素酸塩を伴わない) 。

【 0 5 3 8 】

ステップ 4 : N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 1 1) の調製

【 化 4 5 】

10



(P11)

20

0 で冷却した 6 - [5 - (1 - アミノエチル) - 3 - ブロモ - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリル臭化水素酸塩 (1 7 0 m g 、 0 . 4 5 6 m m o l 、 1 . 3 0 当量) のジクロロメタン (5 . 0 0 m L) 中の溶液にトリエチルアミン (0 . 2 4 4 m L 、 1 . 7 5 m m o l 、 5 . 0 0 当量) 、続いて 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) 塩化ベンゾイル (0 . 0 6 5 m L 、 0 . 3 5 1 m m o l 、 1 . 0 0 当量) を添加した。この反応混合物を室温で 2 時間撹拌し、次いで濃縮した。粗材料を酢酸エチル中に溶解し、有機相を水で 3 回洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥させ、ろ過し、減圧下で i s o l u t e において濃縮し、シリカゲルにおけるフラッシュクロマトグラフィ (シクロヘキサン中に酢酸エチル) により精製して、N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) ベンズアミドを得た。

30

1H NMR (4 0 0 M H z , クロロホルム - d) p p m : 1 . 7 8 (d , $J = 6 . 6$ 0 H z , 3 H) 6 . 4 8 (m , 1 H) 8 . 0 5 (s , 1 H) 8 . 1 5 (m , 1 H) 8 . 2 2 (m , 1 H) 8 . 2 7 (m , 2 H) 8 . 8 9 (m , 1 H) .

40

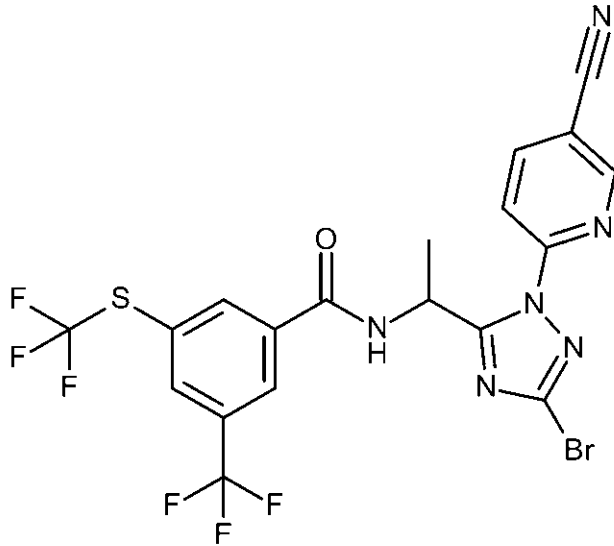
LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 1 4 分間、 m/z 5 3 5 [$M + H$] $^+$ 。

【 0 5 3 9 】

実施例 2 : N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズアミド (化合物 P 5) の調製

50

【化 4 6】



(P5)

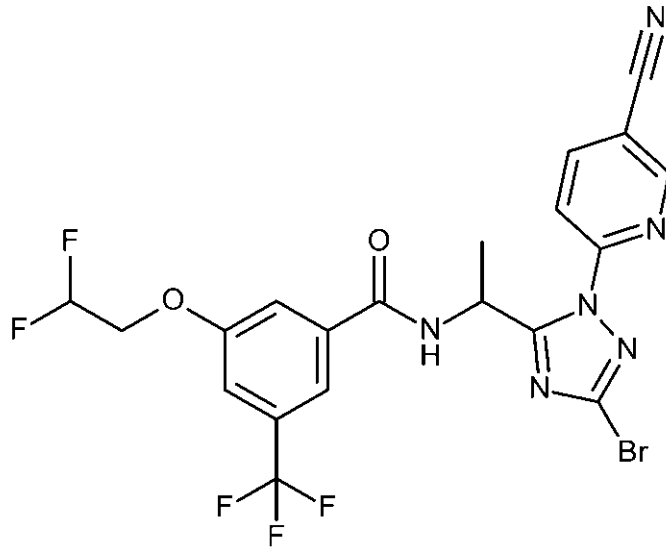
6 - [5 - (1 - アミノエチル) - 3 - ブロモ - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル] ピリジン - 3 - カルボニトリル臭化水素酸塩 (0 . 1 5 g 、 0 . 4 0 1 m m o l) をアセトニトリル (4 m L) 中に溶解し、N - エチル - N - イソプロピル - プロパン - 2 - アミン (0 . 2 1 0 m L 、 1 . 2 0 3 1 m m o l) を添加した。室温で 1 0 分間撹拌した後、3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) 安息香酸 (0 . 1 2 8 g 、 0 . 4 4 1 m m o l) 、続いて H A T U (0 . 2 0 4 g 、 0 . 5 2 1 m m o l) を添加した。次いで、混合物を室温で 1 6 時間撹拌した。この反応混合物を減圧下で蒸発させ、得られた残渣をシリカゲルにおけるクロマトグラフィにより精製して、N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (トリフルオロメチル) - 5 - (トリフルオロメチルスルファニル) ベンズアミドを得た。

^1H NMR (4 0 0 M H z , クロロホルム) p p m 1 . 7 7 (d , J = 6 . 6 0 H z , 3 H) 6 . 4 1 - 6 . 5 2 (m , 1 H) 7 . 2 8 (s , 1 H) 8 . 0 6 - 8 . 0 9 (m , 1 H) 8 . 1 2 - 8 . 1 6 (m , 1 H) 8 . 1 7 - 8 . 2 0 (m , 1 H) 8 . 2 0 - 8 . 2 5 (m , 1 H) 8 . 2 6 - 8 . 2 8 (m , 1 H) 8 . 8 6 - 8 . 9 1 (m , 1 H) LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 1 8 分間、m / z 5 6 7 [M + H] + 。

【 0 5 4 0 】

実施例 3 : N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 3 3) の調製

【化 4 7】



(P33)

所望の生成物を、実施例 2 に記載の条件を用いて調製して、N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (2 , 2 - ジフルオロエトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドを得た。

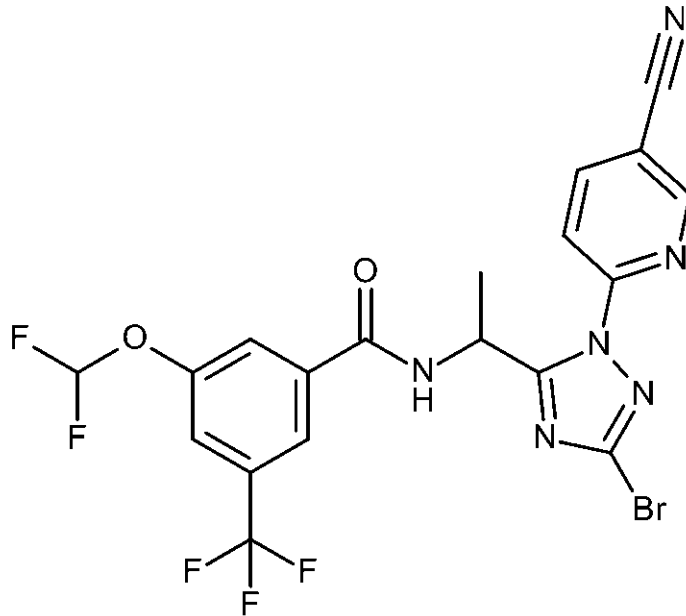
^1H NMR (400 MHz , クロロホルム) ppm 1 . 7 6 (d , J = 6 . 6 0 Hz , 3 H) 4 . 2 8 (td , J = 12 . 8 4 , 4 . 0 3 Hz , 2 H) 5 . 9 5 - 6 . 3 0 (m , 1 H) 6 . 4 4 (dd , J = 8 . 0 7 , 6 . 9 7 Hz , 1 H) 7 . 2 6 (br d , J = 8 . 4 4 Hz , 1 H) 7 . 3 3 (s , 1 H) 7 . 5 5 (s , 1 H) 7 . 6 7 (s , 1 H) 8 . 1 0 - 8 . 1 6 (m , 1 H) 8 . 1 9 - 8 . 2 5 (m , 1 H) 8 . 8 8 (dd , J = 2 . 2 0 , 0 . 7 3 Hz , 1 H)

LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 0 9 分間、 m/z 545 [$M + H$] $^{+}$ 。

【 0 5 4 1 】

実施例 4 : N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (ジフルオロメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 1 0) の調製

【化 4 8】



(P10)

所望の生成物を、実施例 2 に記載の条件を用いて調製して、N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (ジフルオロメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドを得た。

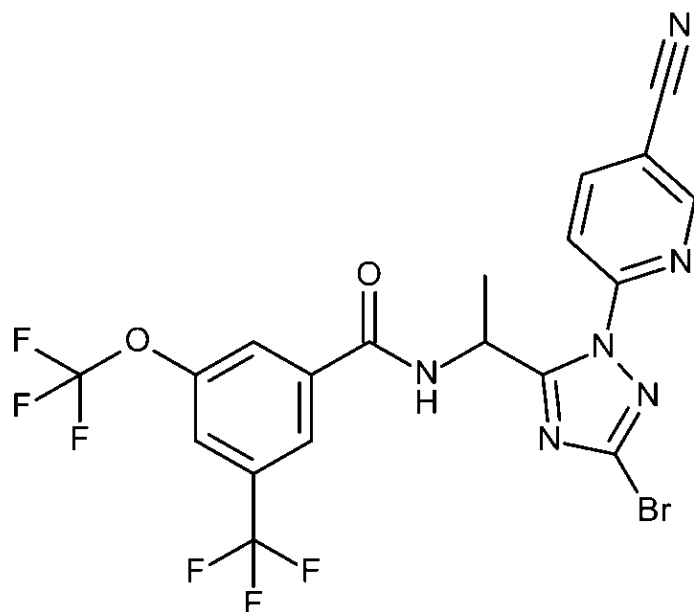
¹H NMR (400 MHz , クロロホルム) ppm 1 . 76 (d , J = 6 . 60 Hz , 3 H) 6 . 40 - 6 . 50 (m , 1 H) 6 . 44 - 6 . 82 (m , 1 H) 7 . 26 (br d , J = 8 . 07 Hz , 1 H) 7 . 56 (s , 1 H) 7 . 77 (s , 1 H) 7 . 90 (s , 1 H) 8 . 10 - 8 . 18 (m , 1 H) 8 . 19 - 8 . 28 (m , 1 H) 8 . 83 - 8 . 92 (m , 1 H)

LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 09 分間、m / z 533 [M + H] +。

【 0 5 4 2 】

実施例 5 : N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (トリフルオロメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 P 9) の調製

【化 4 9】



(P9)

所望の生成物を、実施例 2 に記載の条件を用いて調製して、N - [1 - [5 - ブロモ - 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] - 3 - (トリフルオロメトキシ) - 5 - (トリフルオロメチル) ベンズアミドを得た。

^1H NMR (400 MHz , クロロホルム) ppm 1 . 77 (d , J = 6 . 60 Hz , 3 H) 6 . 46 (br d , J = 1 . 10 Hz , 1 H) 7 . 27 (br s , 1 H) 7 . 64 (s , 1 H) 7 . 87 (s , 1 H) 7 . 99 (s , 1 H) 8 . 11 - 8 . 17 (m , 1 H) 8 . 19 - 8 . 25 (m , 1 H) 8 . 86 - 8 . 91 (m , 1 H)

LC - MS (方法 1) : 保持時間 1 . 16 分間、 m/z 549 [$M + H$] $^{+}$. 表 P : 式 I の化合物の例

【 0 5 4 3 】

【表 1 2 - 1】

項目	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (実測値)	方法	MP°C
P1	3-ブromo-N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	587	3	191 - 193
P2	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.15	577	3	171 - 173
P3	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	574	3	150 - 152
P4	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	607	3	153 - 155

10

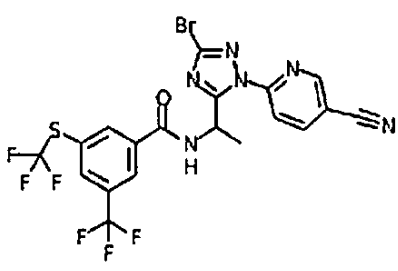
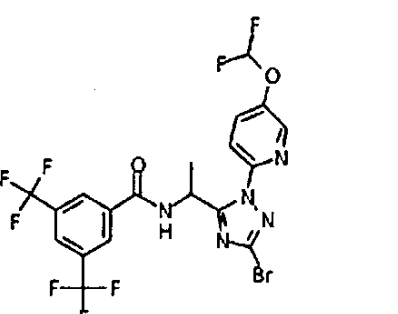
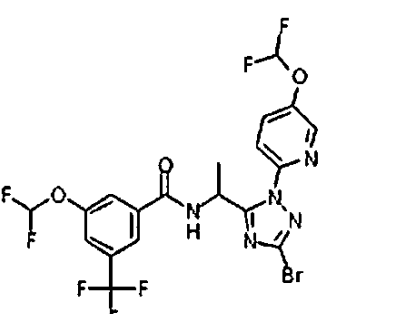
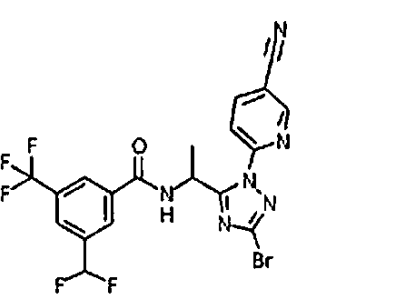
20

30

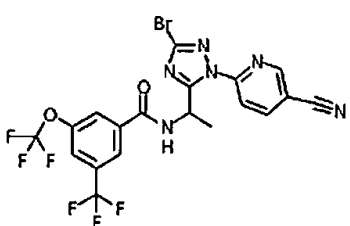
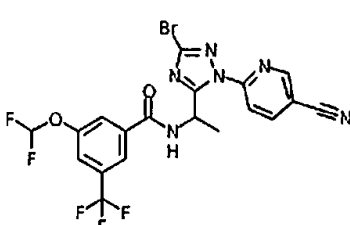
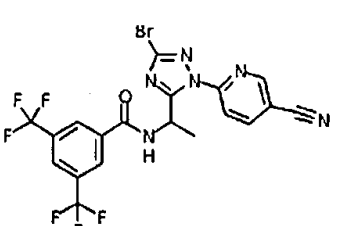
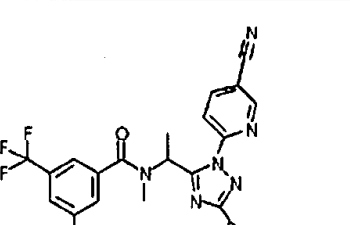
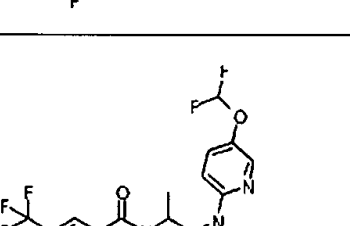
40

50

【表 1 2 - 2】

P5	N-[1-[5-ブromo-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]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズアミド		1.19	567	1	175 176	-
P6	N-[1-[5-ブromo-2-(5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.21	574	3	153 155	-
P7	N-[1-[5-ブromo-2-(5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル)-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.60	572	3	68 - 70	-
P8	N-[1-[5-ブromo-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]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					204 206	-

【表 1 2 - 3】

P9	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-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]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.16	549	1	178 179	-
P10	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-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]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	533	1	123 124	-
P11	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-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]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.14	535	1	110 111	-
P12	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-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]- <i>N</i> -メチル-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.15	549	1		
P13	3-ブromo- <i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメチル)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					146 148	-

10

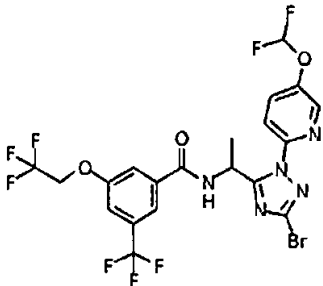
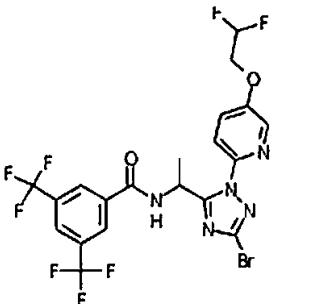
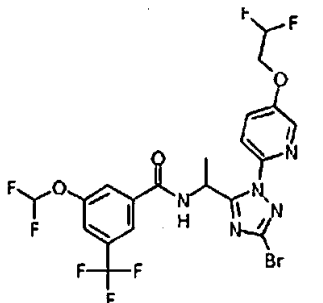
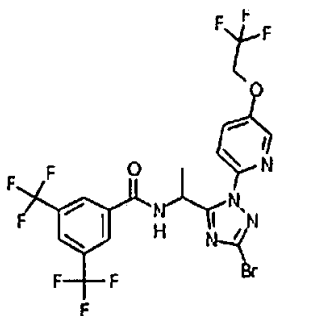
20

30

40

50

【表 1 2 - 4】

P14	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.63	404	?	72 - 74
P15	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド					181 - 183
P16	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					136 - 138
P17	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.65	608	?	133 - 135

10

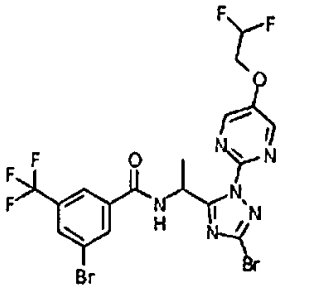
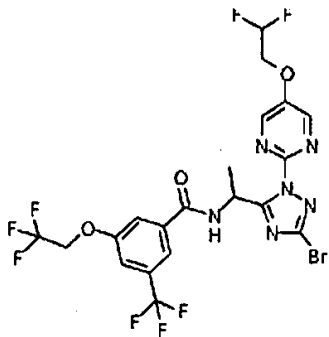
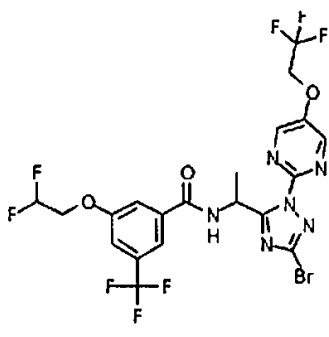
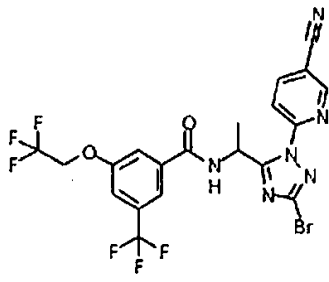
20

30

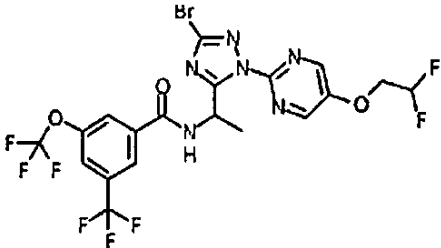
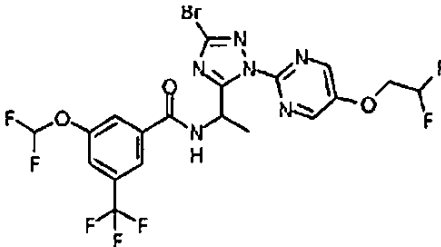
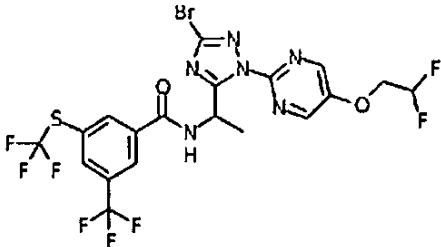
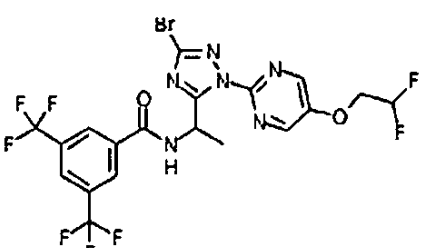
40

50

【表 1 2 - 5】

P18	3-ブromo-N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.12	601	3	104 - 106
P19	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.12	619	3	88 - 90
P20	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	620	3	91 - 93
P21	N-[1-[5-ブromo-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]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.16	563	3	188 - 190

【表 1 2 - 6】

P22	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.12	607	1	142 - 153
P23	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.07	589	1	
P24	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(トリフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチルスルファニル)ベンズアミド		1.16	623	1	140 - 150
P25	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.11	589	1	

10

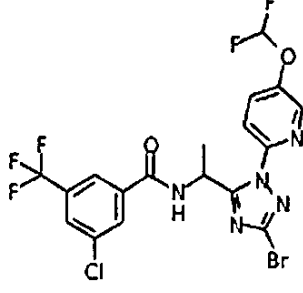
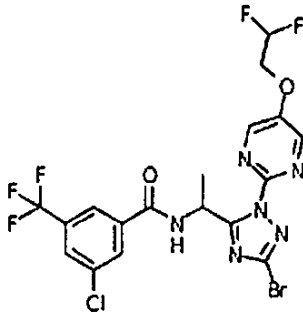
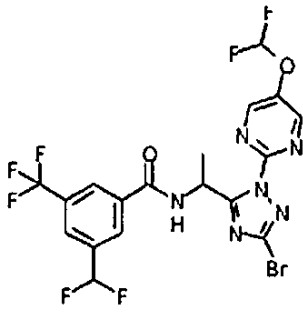
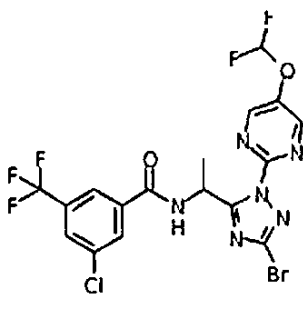
20

30

40

50

【表 1 2 - 7】

P26	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					90 - 92
P27	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.11	557	3	100 - 102
P28	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.53	557	?	181 - 183
P29	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.57	541	?	179 - 181

10

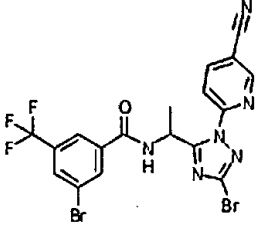
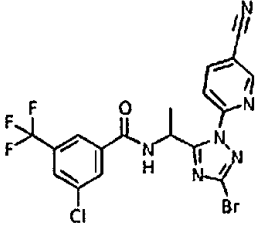
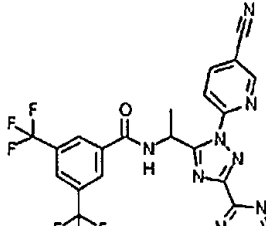
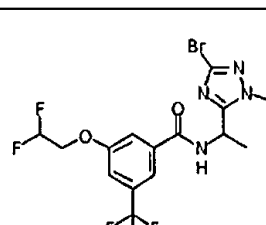
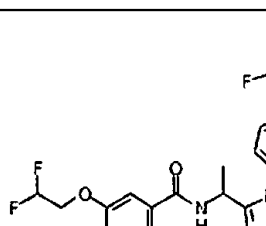
20

30

40

50

【表 1 2 - 8】

P30	3-ブromo-N-[1-[5-ブromo-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]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					178 180	-
P31	N-[1-[5-ブromo-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]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					94 - 96	
P32	N-[1-[2-(5-シアノ-2-ピリジル)-5-ピリミジン-2-イル-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.02	533	1	272 274	-
P33	N-[1-[5-ブromo-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]-3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.09	545	1	166 167	-
P34	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.59	587	?	76 - 78	

10

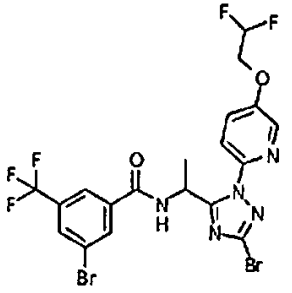
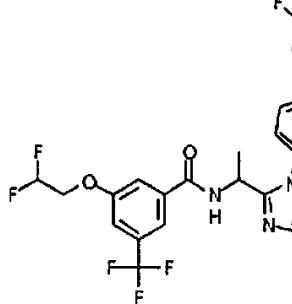
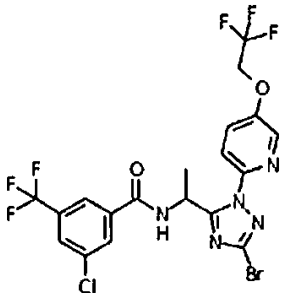
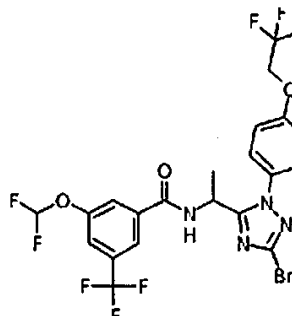
20

30

40

50

【表 1 2 - 9】

P35	3-ブromo-N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					175 177	-
P36	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					143 145	-
P37	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					114 116	-
P38	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					111 113	-

10

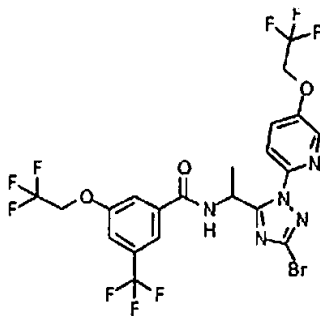
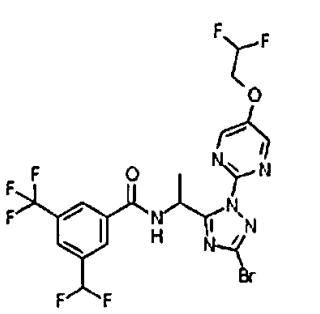
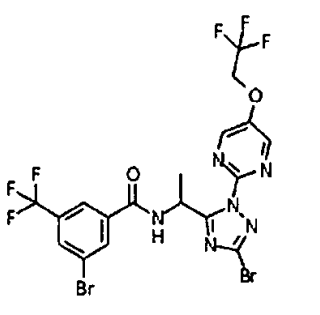
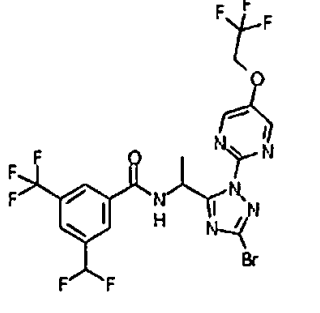
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 0】

P39	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					70 - 72
P40	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.07	572	3	99 - 101
P41	3-ブromo- <i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.14	619	3	103 - 105
P42	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.10	590	3	96 - 98

【表 1 2 - 1 1】

P43	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.14	575	3	99 101	-
P44	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.15	608	3	100 102	-
P45	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.13	606	3	161 163	-
P46	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)ピリミジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.16	638	3	94 - 96	-

10

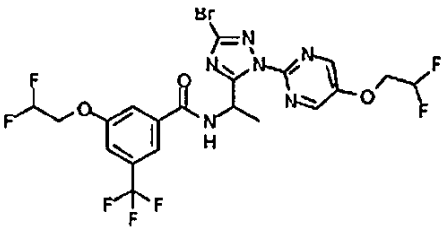
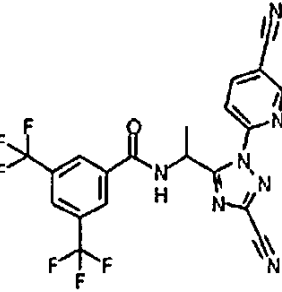
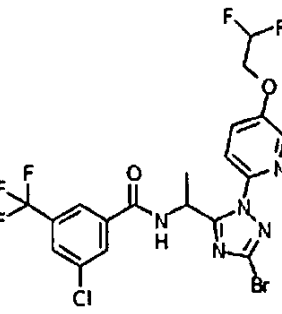
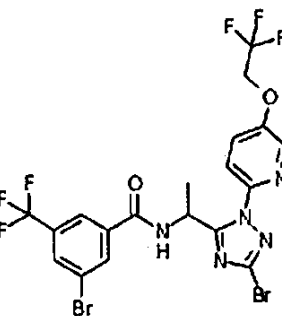
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 2】

P47	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)ピリジン-2-イル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.06	603	1	
P48	<i>N</i> -[1-[5-シアノ-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]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.87	480	2	
P49	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					160 - 162
P50	3-ブromo- <i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.65	618	?	129 - 131

10

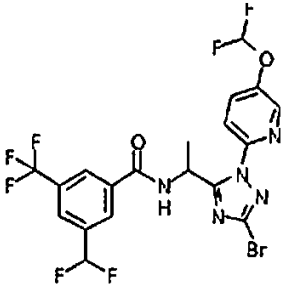
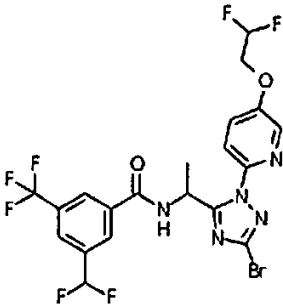
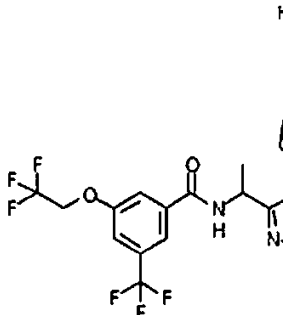
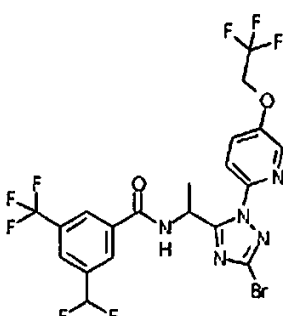
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 3】

P51	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(ジフルオロメトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.59	557	?	68 - 70
P52	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					167 - 169
P53	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2-ジフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					155 - 157
P54	N-[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(ジフルオロメチル)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					116 - 118

10

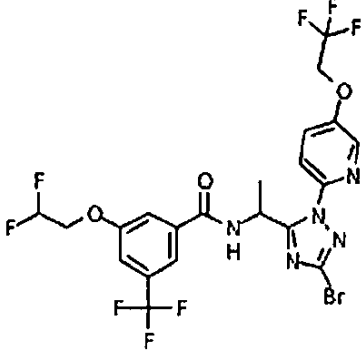
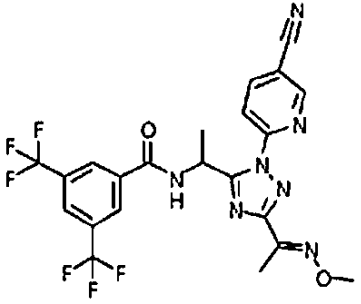
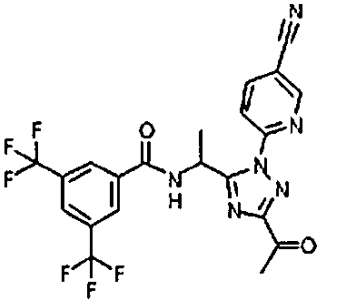
20

30

40

50

【表 1 2 - 1 4】

P55	<i>N</i> -[1-[5-ブromo-2-[5-(2,2,2-トリフルオロエトキシ)-2-ピリジル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3-(2,2-ジフルオロエトキシ)-5-(トリフルオロメチル)ベンズアミド					78 - 80
P56	<i>N</i> -[1-[2-(5-シアノ-2-ピリジル)-5-[(<i>E</i>)- <i>N</i> -メトキシ- <i>C</i> -メチル-カルボンイミドイル]-1,2,4-トリアゾール-3-イル]エチル]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.16	526	1	259 - 260
P57	<i>N</i> -[1-[5-アセチル-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]-3,5-ビス(トリフルオロメチル)ベンズアミド		1.08	497	1	177 - 178

【 0 5 4 4 】

10

20

30

40

50

【表 1 3】

表 I: 中間体の表

項目	IUPAC 名	構造	RT (分)	[M+H] (実測値)	方法	MP °C	NMR
I1	6-(3-ブromo-5-エチル-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-カルボニトリル		0.93	280	1	-	1)
I2	6-[3-ブromo-5-(1-ブromoエチル)-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリル		1.02	356-358-360	1	-	2)
I3	6-[5-(1-アミノエチル)-3-ブromo-1,2,4-トリアゾール-1-イル]ピリジン-3-カルボニトリル;臭化水素酸塩		0.66	293	1	-	

1) ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 1.43 (t, J = 7.34 Hz, 3 H) 3.37 (q, J = 7.58 Hz, 2 H) 8.07 – 8.12 (m, 1 H) 8.12 – 8.19 (m, 1 H) 8.76 – 8.83 (m, 1 H).

2) ¹H NMR (400 MHz, クロロホルム-d) δ ppm: 2.22 (d, J = 6.97 Hz, 3 H) 6.37 (q, J = 6.97 Hz, 1 H) 8.08 – 8.14 (m, 1 H) 8.16 – 8.23 (m, 1 H) 8.84 (d, J=1.47 Hz, 1 H).

【0 5 4 5】

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。

【0 5 4 6】

10

20

30

40

50

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。

【0547】

式 I の化合物と有効成分との以下の混合物が好ましい（ここで、略記「TX」は、「表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P において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）（628）+ TX からな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、アフィドピロペン+TX、アフォキサ
 ラナル+TX、アラニカルブ+TX、アレトリン+TX、 - シペルメトリン+TX、
 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、ベンズピリモキサン+TX、 シフルト
 リン+TX、 - シペルメトリン+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、ピオアレトリンS）- シクロペンチルア
 イソマー+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、CAS 番号：1472050 - 04 - 6 + TX、CAS 番号：1
 632218 - 00 - 8 + TX、CAS 番号：1808115 - 49 - 2 + TX、CAS
 番号：2032403 - 97 - 5 + TX、CAS 番号：2044701 - 44 - 0 + TX
 、CAS 番号：2128706 - 05 - 6 + TX、CAS 番号：2249718 - 27 -
 0 + 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（
 CPMC）+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、シクロキサプリド+TX、シエノピラフェン+TX、シエトプラフェン（
 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、シペルメトリン+TX、シフェノトリン+TX、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
 、ジブロム+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、ジメプロピリダズ+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+TX、エムペントリン+TX、
 - モンフルオロトリン+TX、 - 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、フェンプロパトリン+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、フルエンシルホン+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、フルペンチオフェノクス+TX、フルピラジフロン+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

10

20

30

40

50

ゼート+TX、 - シハロトリン+TX、Gossypure(商標)+TX、グアジ
 ピル+TX、ハロフェノジド+TX、ハロフェノジド+TX、ハロフェンブロックス+TX
 X、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、インドキサカルブ+
 TX、ヨードメタン+TX、イブロジオン+TX、イソシクロセラム+TX、イソチオエ
 ート+TX、イベルメクチン+TX、 - ビフェントリン+TX、 - テフルトリン+TX
 X、ラムダ-シハロトリン+TX、レピメクチン+TX、ルフェヌロン+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、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、ニクロシアミド+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、オキサゾスフィル
 +TX、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、多角体ウイルス+TX、プラレトリン+TX、プロフェノホス+TX、プロフェ
 ノホス+TX、プロフルトリン+TX、プロバルギット+TX、プロペタムホス+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、ピリモス
 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
 、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
 X、スピノサド+TX、スピロジクロフェン+TX、スピロメシフェン+TX、スピロピ
 ジオン+TX、スピロテトラマト+TX、スルホキサフロル+TX、テブフェノジド+TX
 X、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、テトラナクチン+TX、テトラニリプロール+TX、
 - シペルメトリン+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、チオキサザフェン+TX、トルフェンピラド+TX、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、トリクロロホン+TX、トリ
 フルメゾピリン+TX、チクロピラゾフロル+TX、 - シペルメトリン+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
 X及び鉄+TX、アザジラクチン+TX、バチルス・アイザワイ(Bacillus a
 izawai)+TX、バチルス・キチノスポルス(Bacillus chitino
 sporus)AQ746(NRRL受入番号B-21618)+TX、バチルス・フ
 ィルムス(Bacillus firmus)+TX、バチルス・クルスターキ(Bac
 illus kurstaki)+TX、バチルス・マイコイデス(Bacillus m
 ycoides)AQ726(NRRL受入番号B-21664)+TX、バチルス・プ
 ミルス(Bacillus pumilus)(NRRL受入番号B-30087)+T
 X、バチルス・プミルス(Bacillus pumilus)AQ717(NRRL受
 入番号B-21662)+TX、バチルス属の種(Bacillus sp.)AQ17
 8(ATCC受入番号53522)+TX、バチルス属の種(Bacillus sp.
)AQ175(ATCC受入番号55608)+TX、バチルス属の種(Bacillu
 s sp.)AQ177(ATCC受入番号55609)+TX、バチルス・サブチリス
 (Bacillus subtilis)不特定の+TX、バチルス・サブチリス(Ba
 cillus subtilis)AQ153(ATCC受入番号55614)+TX、
 バチルス・サブチリス(Bacillus subtilis)AQ30002(NRR

10

20

30

40

50

L 受入番号 B - 50421) + TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ30004 (NRRL 受入番号 B - 50455) + TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ713 (NRRL 受入番号 B - 21661) + TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) AQ743 (NRRL 受入番号 B - 21665) + TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) AQ52 (NRRL 受入番号 B - 21619) + TX、バチルス・チューリングエンシス (*Bacillus thuringiensis*) BD#32 (NRRL 受入番号 B - 21530) + TX、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターキ (*Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*) BMP 123 + TX、ベアウベリア・バッシアナ (*Beauveria bassiana*) + TX、D - リモネン + TX、グラニューロウイルス + TX、ハルピン + TX、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*) 核多核体ウイルス + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多核体ウイルス + TX、ニセアメリカタバコガ (*Heliothis virescens*) 核多核体ウイルス + TX、ヘリオチス・プンクチゲラ (*Heliothis punctigera*) 核多核体ウイルス + TX、メタリジウム属の種 (*Metarhizium* spp.) + TX、ムスコドル・アルブス (*Muscodora albus*) 620 (NRRL 受入番号 30547) + TX、ムスコドル・ロセウス (*Muscodora roseus*) A3 - 5 (NRRL 受入番号 30548) + TX、ニーム・ツリー (*Neem tree*) 系生成物 + TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、パエシロマイセス・リラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) + TX、パスツリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、パスツリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*) + TX、パスツリア・ラモサ (*Pasteuria ramosa*) + TX、パスツリア・ソルネイ (*Pasteuria thornei*) + TX、パスツリア・ウスガエ (*Pasteuria usgae*) + TX、P - シメン + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) グラニューロシスウイルス + TX、コナガ (*Plutella xylostella*) 核多核体ウイルス + TX、多角体ウイルス + TX、ジョチュウギク + TX、QRD 420 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD 452 (テルペノイドブレンド) + TX、QRD 460 (テルペノイドブレンド) + TX、キラヤ・サボナリア (*Quillaja saponaria*) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rhodococcus globulus*) AQ719 (NRRL 受入番号 B - 21663) + TX、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugiperda*) 核多核体ウイルス + TX、ストレプトマイセス・ガルブス (*Streptomyces galbus*) (NRRL 受入番号 30232) + TX、ストレプトマイセス属の種 (*Streptomyces* spp.) (NRRL 受入番号 B - 30145) + TX、テルペノイドブレンド + TX 及びベルチシリウム属の種 (*Verticillium* spp.) から選択される昆虫防除有効物質
 ベトキサジン [CCN] + TX、ニオクタノン酸銅 (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、キノンアミド (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 からなる物質群から選択される殺菌剤、
 アバメクチン (1) + TX、クルホメート (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、エピリノメクチン (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からなる物質群から選択される駆虫薬、

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）及びストリキニン（745）+TXからなる物質群から選択される殺鳥剤、

1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン（IUPAC名）（1222）+TX、4-（キノキサリン-2-イルアミノ）ベンゼンスルホンアミド（IUPAC名）（748）+TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン（446）+TX、プロノポール（97）+TX、ニオクタノン酸銅（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、ドジチン（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、カスガマイシンヒドロクロリド水和物（483）+TX、ニッケルピス（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、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム（446）+TX、プロベナゾール（658）+TX、ストレプトマイシン（744）+TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート（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・ラジオブクター（*Agrobacterium radiobacter*）（代替名）（13）+TX、アムブリセイウス属の一種（*Amblyseius spp.*）（代替名）（19）+TX、アナグラファ・ファルシフェラ（*Anagrapta falcifera* NPV）（代替名）（28）+TX、アングルス・アトムス（*Anagrus atomus*）（代替名）（29）+TX、アブラコバチ（*Aphelinus abdominalis*）（代替名）（33）+TX、コレマンアブラバチ（*Aphidius colemani*）（代替名）（34）+TX、ショクガタマバエ（*Aphidoletes aphidimyza*）（代替名）（35）+TX、オートグラファ・カリホルニカ（*Autographa californica* NPV）（代替名）（38）+TX、バチルス・フィルムス（*Bacillus firmus*）（代替名）（48）+TX、バチルス・スファエリクス（*Bacillus sphaericus* Neide）

（学名）（49）+TX、バチルス・チューリングゲンシス（*Bacillus thuringiensis*）ベルリネル（*Berliner*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス・アイザワイ（*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス・イスラエレンシス（*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*）（学名）（51）+TX、バチルス・チューリングゲンシス・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・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・テネブリオニス（*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*）（学名）（51）+TX、ベアウベリア・バッシアナ（*Beauveria bassiana*）（代替名）（53）+TX、ベアウベリア・ブロングニアルチイ（*Beauveria brongniartii*）（代替名）（54）+TX、ヤマトクサカゲロウ（*Chrysoperla carnea*）（代替名）（151）+TX、ツマアカオオヒメテントウ（*Cryptolaemus montrouzieri*）（代替名）（178）+TX、コドリ

ンガ（*Cydia pomonella* GV）（代替名）（191）+TX、ハモグリコ

10

20

30

40

50

マコバチ (*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、
 ヘテロルハブジチス・バクテリオホラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) 及び H. メギジス (*H. megidis*) (代替名) (433) +
 TX、ヒポダミア・コンベルゲンス (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、フジコナヒゲナガトビコバチ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリジノサス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ
 (Mamestra brassicae NPV) (代替名) (494) + TX、メタフ
 イクス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522)
 + TX、メタリジウム・アニソプリアエ・アクリズム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウム・
 アニソプリアエ・アニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer* NPV) 及び N. レコンテイ (*N. lecontei* NPV) (代替名) (575) + TX、ヒメハナカメムシ属の種 (*Orius* spp.) (代替名) (596) + TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチ
 モジヨトウ (*Spodoptera exigua*) マルチカブシド核多角体ウイルス (学名) (741) + TX、ステイネルネマ・ビビオニス (*Steinernema bionis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ・カルボカブサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、ステイネル
 ネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ・グラセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ・リオブラビス (*Steinernema riobravis*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ・スカ
 ブテリスキ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、ステイネルネマ属の種 (*Steinernema* spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラマ属の種 (*Trichogramma* spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オクシデンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) (代替名) (844) 及びベルチシリウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) (代替名) (848) + TX からなる物質群から
 選択される生物剤、
 ヨードメタン (IUPAC 名) (542) 及び臭化メチル (537) + TX からなる物質
 群から選択される土壌不毛剤、
 アホレート [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) [C
 CN] + TX、ヘメル [CCN] + TX、ヘムパ [CCN] + TX、メテパ [CCN] +
 TX、メチオテパ [CCN] + TX、メチルアホレート [CCN] + TX、モルジド [C
 CN] + TX、ペンフルロン (代替名) [CCN] + TX、テパ [CCN] + TX、チオ
 ヘムパ (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 からなる物質群から選択
 される不妊化剤、
 (E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセレートと (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC 名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセレート (

10

20

30

40

50

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-エン-1-イルアセテート(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)-イコス-13-エン-10-オン(IUPAC名)(448)+TX、(Z)-テトラデカ-7-エン-1-アル(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+4-メチルノナン-5-オン(IUPAC名)(544)+TX、
 - ムルチストリアチン(代替名)[CCN]+TX、ブレビコミン(代替名)[CCN]+TX、コドレルレ(代替名)[CCN]+TX、コドレモン(代替名)(167)+TX、クエルレ(代替名)(179)+TX、ジスパールア(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、エチル4-メチルオクタノエート(IUPAC名)(317)+TX、オイゲノール(代替名)[CCN]+TX、フロントリン(代替名)[CCN]+TX、ゴシッブルア(代替名)(420)+TX、グランドルア(421)+TX、グランドルアI(代替名)(421)+TX、グランドルアII(代替名)(421)+TX、グランドルア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、オルフルアルア(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-イルアセテート(IUPAC名)(785)+TX、トリメドルア(839)+TX、トリメドルアA(代替名)(839)+TX、トリメドルアB₁(代替名)(839)+TX、トリメドルアB₂(代替名)(839)+TX、トリメドルアC(代替名)(839)及びトランク-コール(trunc-call)(代替名)[CCN]+TXからなる物質群から選択される昆虫フェロモン、
 2-(オクチルチオ)エタノール(IUPAC名)(591)+TX、ブタピロノキシル(933)+TX、プトキシ(ポリプロピレングリコール)(936)+TX、ジブチルアジペート(IUPAC名)(1046)+TX、フタル酸ジブチル(1047)+TX、ジブチルコハク酸塩(IUPAC名)(1048)+TX、ジエチルトルアミド[CCN]+TX、ジメチルカルベート[CCN]+TX、ジメチルフタレート[CCN]+TX、エチルヘキサンジオール(1137)+TX、ヘキサミド[CCN]+TX、メトキン-ブチル(1276)+TX、メチルネオデカンアミド[CCN]+TX、オキサメート[CCN]及びピカリジン[CCN]+TXからなる物質群から選択される昆虫忌避剤、

10

20

30

40

50

ビス(トリブチルスズ)オキシド(IUPAC名)(913)+TX、ブロモアセタミド
 [CCN]+TX、ヒ酸カルシウム[CCN]+TX、クロエトカルブ(999)+TX
 、アセト亜ヒ酸銅[CCN]+TX、硫酸銅(172)+TX、フェンチン(347)+
 TX、第二鉄リン酸塩(IUPAC名)(352)+TX、メタアルデヒド(518)+
 TX、メチオカルブ(530)+TX、ニクロスアミド(576)+TX、ニクロスアミ
 ド-オラミン(576)+TX、ペンタクロロフェノール(623)+TX、ペンタクロ
 ロフェノキシドナトリウム塩(623)+TX、チオナジン(1412)+TX、チオジ
 カルブ(799)+TX、酸化トリブチルスズ(913)+TX、トリフェンモルフ(1
 454)+TX、トリメタカルブ(840)+TX、酢酸トリフェニルスズ(IUPAC
 名)(347)及び水酸化トリフェニルスズ(IUPAC名)(347)+TX、ピリブ
 ロール[394730-71-3]+TXからなる物質群から選択される殺軟体動物剤、
 AKD-3088(化合物コード)+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン(I
 UPAC/Chemical Abstracts名)(1045)+TX、1,2-ジ
 クロロプロパン(IUPAC/Chemical Abstracts名)(1062)
 +TX、1,2-ジクロロプロパン+1,3-ジクロロプロペン(IUPAC名)(10
 63)+TX、1,3-ジクロロプロペン(233)+TX、3,4-ジクロロテトラヒ
 ドロチオフェン1,1-ジオキシド(IUPAC/Chemical Abstract
 s名)(1065)+TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルロダニン(IUP
 AC名)(980)+TX、5-メチル-6-チオキソ-1,3,5-チアジアジナン-
 3-イル酢酸(IUPAC名)(1286)+TX、6-イソペンテニルアミノプリン(20
 代替名)(210)+TX、アバメクチン(1)+TX、アセトプロール[CCN]+TX
 、アラニカルブ(15)+TX、アルジカルブ(16)+TX、アルドキシカルブ(8
 63)+TX、AZ60541(化合物コード)+TX、ベンクロチアズ[CCN]+TX
 、ベノミル(62)+TX、ブチルピリダベン(代替名)+TX、カズサホス(109
)+TX、カルボフラン(118)+TX、二硫化炭素(945)+TX、カルボスルフ
 ザン(119)+TX、クロルピクリン(141)+TX、クロルピリホス(145)+
 TX、クロエトカルブ(999)+TX、シクロブトリフルラム+TX、サイトカイニン
 (代替名)(210)+TX、ダゾメット(216)+TX、DBCP(1045)+TX
 、DCIP(218)+TX、ジアミダホス(1044)+TX、ジクロロフェンチオ
 ン(1051)+TX、ジクリホス(代替名)+TX、ジメトエート(262)+TX、
 ドラメクチン(代替名)[CCN]+TX、エマメクチン(291)+TX、エマメクチ
 ン安息香酸塩(291)+TX、エピリノメクチン(代替名)[CCN]+TX、エトブ
 ロホス(312)+TX、エチレンジブromid(316)+TX、フェナミホス(326
)+TX、フェンピラド(代替名)+TX、フェンスルホチオン(1158)+TX、ホ
 スチアゼート(408)+TX、ホスチエタン(1196)+TX、ルフラール(代替名
) [CCN]+TX、GY-81(開発コード)(423)+TX、ヘテロホス[CCN
]+TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542)+TX、イサミドホス(1230)
 +TX、イサゾホス(1231)+TX、イベルメクチン(代替名)[CCN]+TX、
 カイネチン(代替名)(210)+TX、メカルホン(1258)+TX、メタム(51
 9)+TX、メタム-カリウム(代替名)(519)+TX、メタム-ナトリウム(51
 9)+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)[C
 CN]+TX、ミロテシウム・ベルカリア(Myrothecium verrucar
 ia)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/Chemical Abs
 tracts名)(1422)+TX、チアフェノクス(代替名)+TX、チオナジン(40
 1434)+TX、トリアゾホス(820)+TX、トリアズロン(代替名)+TX、キ

10

20

30

40

50

シレノルス [C C N] + T X、Y I - 5 3 0 2 (化合物コード) 及びゼアチン (代替名) (2 1 0) + T X、フルエンシルホン [3 1 8 2 9 0 - 9 8 - 1] + T X、フルオピラム + T X からなる物質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 [C C N] 及びニトラピリン (5 8 0) + T X からなる物質群から選択される硝化阻害剤、

アシベンゾラル (6) + T X、アシベンゾラル - S - メチル (6) + T X、プロベナゾール (6 5 8) 及びオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (7 2 0) + T X からなる物質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 (I U P A C 名) (1 2 4 6) + T X、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンシルホンアミド (I U P A C 名) (7 4 8) + T X、

- クロロヒドリル [C C N] + T X、リン化アルミニウム (6 4 0) + T X、アンツ (8 8 0) + T X、三酸化ヒ素 (8 8 2) + T X、炭酸バリウム (8 9 1) + T X、

ビスチオセミ (9 1 2) + T X、プロジファクム (8 9) + T X、プロマジオロン (9 1) + T X、プロメタリン (9 2) + T X、シアン化カルシウム (4 4 4) + T X、クロ

ラロース (1 2 7) + T X、クロロファシノン (1 4 0) + T X、コレカルシフェロール (代替名) (8 5 0) + T X、クマクロル (1 0 0 4) + T X、クマフリル (1 0 0 5) + T X、

クマテトラリル (1 7 5) + T X、クリミジン (1 0 0 9) + T X、ジフェナクム (2 4 6) + T X、ジフェチアロン (2 4 9) + T X、ジファシノン (2 7 3) + T X、

エルゴカルシフェロール (3 0 1) + T X、フロクマフェン (3 5 7) + T X、フルオロアセタミド (3 7 9) + T X、フルプロパジン (1 1 8 3) + T X、フルプロパジンヒ

ドロクロリド (1 1 8 3) + T X、- H C H (4 3 0) + T X、H C H (4 3 0) + T X、シアン化水素 (4 4 4) + T X、ヨードメタン (I U P A C 名) (5 4 2) + T X、

リンダン (4 3 0) + T X、リン化マグネシウム (I U P A C 名) (6 4 0) + T X、臭化メチル (5 3 7) + T X、ノルボルミド (1 3 1 8) + T X、ホスアセチム (1 3 3 6) + T X、

ホスフィン (I U P A C 名) (6 4 0) + T X、リン [C C N] + T X、ピンドン (1 3 4 1) + T X、亜ヒ酸カリウム [C C N] + T X、ピリヌロン (1 3 7 1) + T X、

シリロシド (1 3 9 0) + T X、亜ヒ酸ナトリウム [C C N] + T X、シアン化ナトリウム (4 4 4) + T X、フルオロ酢酸ナトリウム (7 3 5) + T X、ストリキニン (7 4 5) + T X、

硫酸タリウム [C C N] + T X、ワルファリン (8 5 1) 及び亜鉛ホスフィド (6 4 0) + T X からなる物質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 (I U P A C 名) (9 3 4) + 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 (I U P A C 名) (9 0 3) + T X、ファルネソール + ネロリドール (代替名) (3 2 4) + T X、M B - 5 9 9 (開発コード) (4 9 8) + T X、M G K 2 6 4 (開発コード) (2 9 6) + T X、

ピペロニルブトキシド (6 4 9) + T X、ピプロタル (1 3 4 3) + T X、プロピル異性体 (1 3 5 8) + T X、S 4 2 1 (開発コード) (7 2 4) + T X、

セサメックス (1 3 9 3) + T X、セサスモリン (1 3 9 4) 及びスルホキシド (1 4 0 6) + T X からなる物質群から選択される共力剤、

アントラキノ (3 2) + T X、クロラロース (1 2 7) + T X、ナフテン酸銅 [C C N] + T X、オキシ塩化銅 (1 7 1) + T X、ダイアジノン (2 2 7) + T X、ジシクロペン

タジエン (化学名) (1 0 6 9) + T X、グアザチン (4 2 2) + T X、グアザチン酢酸塩 (4 2 2) + T X、メチオカルブ (5 3 0) + T X、ピリジン - 4 - アミン (I U P A C 名) (2 3) + T X、

チラム (8 0 4) + T X、トリメタカルブ (8 4 0) + T X、ナフテン酸亜鉛 [C C N] 及びジラム (8 5 6) + T X からなる物質群から選択される動物忌避剤、

イマニン (代替名) [C C N] 及びリバピリン (代替名) [C C N] + T X からなる物質群から選択される抗ウイルス剤、

酸化水銀 (I I) (5 1 2) + T X、オクチリノン (5 9 0) 及びチオフアネート - メチル (8 0 2) + T X からなる物質群から選択される創傷保護剤、

1 , 1 - ビス (4 - クロロフェニル) - 2 - エトキシエタノール + T X、2 , 4 - ジクロ

10

20

30

40

50

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
 X、ベンジル安息香酸塩+TX、ビキサフェン+TX、プロフェンバレレート+TX、ブ
 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
 X、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、クロルフェンゾン+TX、クロロフェンスルフィド+TX、クロロベンジラ
 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、シネリンス+TX
 X、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
 X、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
 X、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、ドフェナピン+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、フェンゾン+TX、フェントリファニル+TX
 X、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、FMC1137+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、-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
 X、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
 ホス+TX、モルホチオン+TX、モキシデクチン+TX、ナレド+TX、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+TX、ニフルリジド+TX、ニッコマイシン+TX、ニト
 リラカルブ+TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体+TX、オメトエート+TX、オ
 キシデプロホス+TX、オキシジスルホトン+TX、pp'-DDT+TX、パラチオン+
 TX、ベルメトリン+TX、フェンカプトン+TX、ホサロン+TX、ホスホラン+TX
 、ホスファミドン+TX、ポリクロロテルペン+TX、ポリナクチン+TX、プロクロノ
 ール+TX、プロマシル+TX、プロボキスル+TX、プロチダチオン+TX、プロトエ
 ート+TX、ピレトリンI+TX、ピレトリンII+TX、ピレトリン+TX、ピリダフ
 ェンチオン+TX、ピリミテート+TX、キナルホス+TX、キンチオホス+TX、R-
 1492+TX、ホスグリシン+TX、ロテノン+TX、シュラダン+TX、セブホス+
 TX、セラメクチン+TX、ソファミド+TX、SSI-121+TX、スルフィラム+
 TX、スルフラミド+TX、スルホテブ+TX、硫黄+TX、ジフロピダジン+TX、
 -フルバリネート+TX、TEPP+TX、テルバム+TX、テトラジホン+TX、テト
 ラスル+TX、チアフェノクス+TX、チオカルボキシム+TX、チオファノックス+T

10

20

30

40

50

X、チオメトン+TX、チオキノックス+TX、ツリンギエンシン+TX、トリアミホス+TX、トリアラテン+TX、トリアゾホス+TX、トリアズロン+TX、トリフェノホス+TX、トリナクチン+TX、バミドチオン+TX、バニリブロール+TX、ベトキサジン+TX、ニオクタノン酸銅+TX、硫酸銅+TX、シブトリン+TX、ジクロン+TX、ジクロロフェン+TX、エンドタール+TX、フェンチン+TX、消石灰+TX、ナーバム+TX、キノクラミン+TX、キノンアミド+TX、シマジン+TX、酢酸トリフェニルスズ+TX、水酸化トリフェニルスズ+TX、クルホメート+TX、ピペラジン+TX、チオファネート+TX、クロラロース+TX、フェンチオン+TX、ピリジン-4-アミン+TX、ストリキニン+TX、1-ヒドロキシ-1H-ピリジン-2-チオン+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+TX、8-硫酸ヒドロキシキノリン+TX、プロノポール+TX、水酸化銅+TX、クレゾール+TX、ジピリチオン+TX、ドジチン+TX、フェナミノスルフ+TX、ホルムアルデヒド+TX、ヒドラルガフェン+TX、カスガマイシン+TX、カスガマイシンヒドロクロリド水和物+TX、ニッケルビス(ジメチルジチオカルバメート)+TX、ニトラピリン+TX、オクチリノン+TX、オキシリン酸+TX、オキシテトラサイクリン+TX、硫酸ヒドロキシキノリンカリウム+TX、プロベナゾール+TX、ストレプトマイシン+TX、ストレプトマイシンセスキスルフェート+TX、テクロフタラム+TX、チオメルサル+TX、リンゴコカクモンハマキ(*Adoxophyes orana*)GV+TX、アグロバクテリウム・ラジオバクター(*Agrobacterium radiobacter*)+TX、アムブリセイウス属の種(*Amblyseius spp.*)+TX、アナグラファ・ファルシフェラ(*Anagrapta falcifera*)NPV+TX、アングルス・アトムス(*Anagrus atomus*)+TX、アブラコバチ(*Aphelinus abdominalis*)+TX、コレマンアブラバチ(*Aphidius colemani*)+TX、ショクガタマバエ(*Aphidoletes aphidimyza*)+TX、オートグラファ・カリホルニカ(*Autographa californica*)NPV+TX、バチルス・スファエリクス(*Bacillus sphaericus* Neide)+TX、ベアウベリア・ブロングニアルチイ(*Beauveria brongniartii*)+TX、ヤマトクサカゲロウ(*Chrysoperla carnea*)+TX、ツマアカオオヒメテントウ(*Cryptolaemus montrouzieri*)+TX、コドリングア(*Cydia pomonella*)GV+TX、ハモグリコマコバチ(*Dacnusa sibirica*)+TX、イサエアヒメコバチ(*Diglyphus isaea*)+TX、オンシツツヤコバチ(*Encarsia formosa*)+TX、サバクツヤコバチ(*Eretmocerus eremicus*)+TX、ヘテロルハブジチス・バクテリオホラ(*Heterorhabditis bacteriophora*)及びH. メギジス(*H. megidis*)+TX、ヒポダミア・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ヅム(*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 anisopliae* 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、パエシロマイセス・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・カルポカブサエ(*Steinernema carpocapsae*)+TX、ステイネルネマ・フェルチアエ(*Steinernema feltiae*)

10

20

30

40

50

+TX、ステイネルネマ・グラセリ (*Steinernema glaseri*) +TX、
 ステイネルネマ・リオブラベ (*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 (*Steinernema scapterisci*) +TX、ステイネルネマ属の種 (*Steinernema spp.*) +TX、トリコ
 グラム属の種 (*Trichogramma spp.*) +TX、チフロドロムス・オクシ
 デンタリス (*Typhlodromus occidentalis*) +TX、ベルチシ
 リウム・レカニイ (*Verticillium lecanii*) +TX、アホレート+
 TX、ピサジル+TX、プスルファン+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+TX、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+(
 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-エナール+TX、(Z)-ヘ
 キサデカ-11-エン-1-イルアセテート+TX、(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+T
 X、(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、(9Z,12E)-テトラデ
 カ-9,12-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+4-メチルノナン-5-オン+TX、-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
 ルア+TX、イプスジエノール+TX、イプセノール+TX、ジャボニルア+TX、リネ
 アチン+TX、リトルア+TX、ルーブルア+TX、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、オリクタールア+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-11-エン-1-イルアセテート+TX
 、トリメドルア+TX、トリメドルアA+TX、トリメドルアB₁+TX、トリメドルアB
 2+TX、トリメドルアC+TX、トランク-コール (*trunc-call*) +TX、2-
 -(オクチルチオ)エタノール+TX、ブタピロノキシル+TX、ブトキシ(ポリプロピ
 レングリコール)+TX、ジブチルアジペート+TX、フタル酸ジブチル+TX、ジブチ
 ルコハク酸塩+TX、ジエチルトルアミド+TX、ジメチルカルベート+TX、ジメチル
 フタレート+TX、エチルヘキサシジオール+TX、ヘキサミド+TX、メトキン-ブチ
 ル+TX、メチルネオデカンアミド+TX、オキサメート+TX、ピカリジン+TX、1-
 -ジクロロ-1-ニトロエタン+TX、1,1-ジクロロ-2,2-ビス(4-エチルフ
 ェニル)エタン+TX、1,2-ジクロロプロパン+1,3-ジクロロプロペン+TX、
 1-ブromo-2-クロロエタン+TX、2,2,2-トリクロロ-1-(3,4-ジクロ
 ロフェニル)酢酸エチル+TX、2,2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチル
 メチルリン酸塩+TX、2-(1,3-ジチオラン-2-イル)フェニルジメチルカルバ
 メート+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルチオシアネート+TX、2-(4,
 5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニルメチルカルバメート+TX、

10

20

30

40

50

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、 - 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、 バチル
 ス・チューリングシス (*Bacillus thuringiensis*) 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、 -
 シフルトリン + T X、 - 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
 、 ブロムフェンピンホス + 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、 ブトネート + 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、 クロルブラゾ
 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、 ジメチルピンホス + 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、 エチオフエンカル
 ブ + T X、 ギ酸エチル + T X、 エチレンジブロミド + 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 + 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、 テトラチオカルボン酸ナトリウム +
 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 II + T X、 幼虫ホルモン III + 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、 メチルクロロホルム + 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 +

10

20

30

40

50

TX、ニチアジン+TX、ノルニコチン+TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニル
 O-エチルエチルホスホノチオエート+TX、O、O-ジエチルO-4-メチル-2-オ
 キソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオネート+TX、O、O-ジエチルO-6-
 メチル-2-プロピルピリミジン-4-イルホスホロチオネート+TX、O、O、O'、O'
 ' -テトラプロピルジチオピロホスフェート+TX、オレイン酸+TX、パラ-ジクロロベン
 ゼン+TX、パラチオン-メチル+TX、ペンタクロロフェノール+TX、
 ラウリン酸ペンタクロロフェニル+TX、PH60-38+TX、フェンカプトン+TX
 、ホスニクロル+TX、ホスフィン+TX、ホキシム-メチル+TX、ピリメタホス+TX
 X、ポリクロロジシクロペンタジエン異性体+TX、亜ヒ酸カリウム+TX、カリウムチ
 オシアネート+TX、プレコセンI+TX、プレコセンII+TX、プレコセンIII+TX、
 X、ピリミドホス+TX、プロフルトリン+TX、プロメカルブ+TX、プロチオホス
 +TX、ピラゾホス+TX、ピレスメトリン+TX、カッシア+TX、キナルホス-メチ
 ル+TX、キノチオン+TX、ラホキサニド+TX、レスメスリン+TX、ロテノン+TX
 X、カデトリン+TX、リアニア+TX、リアノジン+TX、サバジラ)+TX、シュラ
 ダン+TX、セブホス+TX、SI-0009+TX、チアプロニル+TX、亜ヒ酸ナト
 リウム+TX、シアン化ナトリウム+TX、ナトリウムフッ化物+TX、ヘキサフルオロ
 ケイ酸ナトリウム+TX、ペンタクロロフェノキシドナトリウム塩+TX、セレン酸ナト
 リウム+TX、チオシアン酸ナトリウム+TX、スルコフロン+TX、スルコフロン-ナ
 トリウム+TX、スルフリルフッ化物+TX、スルプロホス+TX、タール油+TX、チ
 オナジン+TX、TDE+TX、テブピリムホス+TX、テメホス+TX、テラレスリン
 +TX、テトラクロロエタン+TX、チクロホス+TX、チオシクラム+TX、チオシク
 ラム水素オキサレート+TX、チオナジン+TX、チオスルタップ+TX、チオスルタッ
 プ-ナトリウム+TX、トラロメトリン+TX、トランスパーメトリン+TX、トリアザ
 メート+TX、トリクロルメタホス-3+TX、トリクロロナト+TX、トリメタカルブ
 +TX、トルプロカルブ+TX、トリクロピリカルブ+TX、トリブレン+TX、ベラト
 リジン+TX、ベラトリン+TX、XMC+TX、メトリン+TX、亜鉛ホスフィド+
 TX、ゾラプロホス+TX及びメペルフルトリン+TX、テトラメチルフルトリン+TX
 、ビス(トリブチルスズ)オキシド+TX、プロモアセタミド+TX、第二鉄リン酸塩+
 TX、ニクロシアミド-オラミン+TX、酸化トリブチルスズ+TX、ピリモルフ+TX
 、トリフェンモルフ+TX、1,2-ジブromo-3-クロロプロパン+TX、1,3-ジ
 クロロプロペン+TX、3,4-ジクロロテトラヒドロチオフエン1,1-ジオキシド+
 TX、3-(4-クロロフェニル)-5-メチルロダニン+TX、5-メチル-6-チオ
 キソ-1,3,5-チアジアジナン-3-イル酢酸+TX、6-イソペンテニルアミノプ
 リン+TX、2-フルオロ-N-(3-メトキシフェニル)-9H-プリン-6-アミン
 +TX、ベンクロチアズ+TX、サイトカイニン+TX、DCIP+TX、ルフラール+
 TX、イサミドホス+TX、カイネチン+TX、ミロテシウム・ベルカリア(*Myrothe-
 cium verrucaria*)組成物+TX、テトラクロロチオフエン+TX、
 キシレノルス+TX、ゼアチン+TX、エチルキサントゲン酸カリウム+TX、アシベン
 ゾラル+TX、アシベンゾラル-S-メチル+TX、オオイタドリ(*Reynoutria
 sachalinensis*)抽出物+TX、クロロヒドリン+TX、アンツ+TX、
 炭酸バリウム+TX、ビスチオセミ+TX、プロジファクム+TX、プロマジオロ
 ン+TX、プロメタリン+TX、クロロファシノン+TX、コレカルシフェロール+TX
 、クマクロル+TX、クマフリル+TX、クマテトラリル+TX、クリミジン+TX、ジ
 フェナクム+TX、ジフェチアロン+TX、ジファシノン+TX、エルゴカルシフェロー
 ル+TX、フロクマフェン+TX、フルオロアセタミド+TX、フルプロパジン+TX、
 フルプロパジンヒドロクロリド+TX、ノルボルミド+TX、ホスアセチム+TX、リン
 +TX、ピンドン+TX、ピリヌロン+TX、シリロシド+TX、フルオロ酢酸ナトリウ
 ム+TX、硫酸タリウム+TX、ワルファリン+TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エ
 チルピペロニレート+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+TX、ファルネソール+ネロリドール+TX、ベルブチ

10

20

30

40

50

ン+TX、MGK 264+TX、ピペロニルブトキシド+TX、ピプロタル+TX、
 プロピル異性体+TX、S421+TX、セサメックス+TX、セサスモリン+TX、ス
 ルホキシド+TX、アントラキノン+TX、ナフテン酸銅+TX、オキシ塩化銅+TX、
 ジシクロペンタジエン+TX、チラム+TX、ナフテン酸亜鉛+TX、ジラム+TX、イ
 マニン+TX、リバピリン+TX、酸化水銀(II)+TX、チオファネート-メチル+
 TX、アザコナゾール+TX、ビテルタノール+TX、ブロムコナゾール+TX、シプロ
 コナゾール+TX、ジフェノコナゾール+TX、ジニコナゾール+TX、エポキシコナゾ
 ール+TX、フェンブコナゾール+TX、フルキンコナゾール+TX、フルシラゾール+
 TX、フルトリアホル+TX、フラメトピル+TX、ヘキサコナゾール+TX、イマザ
 リル+TX、イミベンコナゾール+TX、イブコナゾール+TX、メトコナゾール+TX
 、ミクロブタニル+TX、パクロブトラゾール+TX、ペフラゾエート+TX、ペンコナ
 ザール+TX、プロチオコナゾール+TX、ピリフェノックス+TX、プロクロラズ+TX
 X、プロピコナゾール+TX、ピリソキサゾール+TX、シメコナゾール+TX、テブコ
 ナゾール+TX、テトラコナゾール+TX、トリアジメホン+TX、トリアジメノール+
 TX、トリフルミゾール+TX、トリチコナゾール+TX、アンシミドール+TX、フェ
 ナリモル+TX、ヌアリモル+TX、ブピリメート+TX、ジメチリモール+TX、エチ
 リモール+TX、ドデモルフ+TX、フェンブプロピジン+TX、フェンブプロピモルフ+TX
 X、スピロキサミン+TX、トリデモルフ+TX、シプロジニル+TX、メパニピリム+
 TX、ピリメタニル+TX、フェンピクロニル+TX、フルジオキソニル+TX、ベナラ
 キシル+TX、フララキシル+TX、メタラキシル+TX、R-メタラキシル+TX、オ
 フレース+TX、オキサジキシル+TX、カルベンダジム+TX、デバカルブ+TX、フ
 ベリダゾール+TX、チアベンダゾール+TX、クロゾリネート+TX、ジクロゾリン+
 TX、ミクロゾリン+TX、プロシミドン+TX、ピンクロゾリン+TX、ボスカリド+
 TX、カルボキシシン+TX、フェンフラム+TX、フルトラニル+TX、メプロニル+TX
 X、オキシカルボキシシン+TX、ペンチオピラド+TX、チフルザミド+TX、ドジン+
 TX、イミノクタジン+TX、アゾキシストロビン+TX、ジモキシストロビン+TX、
 エネストロブリン+TX、フェナミンストロビン+TX、フルフェノキシストロビン+TX
 X、フルオキサストロビン+TX、クレソキシム-メチル+TX、メトミノストロビン+
 TX、トリフロキシストロビン+TX、オリザストロビン+TX、ピコキシストロビン+
 TX、ピラクロストロビン+TX、ピラメトストロビン+TX、ピラオキシストロビン+
 TX、フェルバム+TX、マンコゼブ+TX、マンネブ+TX、メチラム+TX、プロピ
 ネブ+TX、ジネブ+TX、カブタホル+TX、キャブタン+TX、フルオロイミド+
 TX、ホルベット+TX、トリルフルアニド+TX、ボルドー液+TX、酸化銅+TX、
 マンカップー+TX、オキシシン銅+TX、ニトロタル-イソプロピル+TX、エディフェ
 ンホス+TX、イプロベンホス+TX、ホスジフェン+TX、トルコホス-メチル+TX
 、アニラジン+TX、ベンチアバリカルブ+TX、プラストサイジン-S+TX、クロロ
 ネブ+TX、クロロタロニル+TX、シフルフェナミド+TX、シモキサニル+TX、シ
 クロブトリフルラム+TX、ジクロシメット+TX、ジクロメジン+TX、ジクロラン+
 TX、ジエトフェンカルブ+TX、ジメトモルフ+TX、フルモルフ+TX、ジチアノン
 +TX、エタボキサム+TX、エトリジアゾール+TX、ファモキサドン+TX、フェン
 アミドン+TX、フェノキサニル+TX、フェリムゾン+TX、フルアジナム+TX、フ
 ルオピコリド+TX、フルスルファミド+TX、フルキサピロキサド+TX、フェンヘキ
 サミド+TX、ホセチル-アルミニウム+TX、ヒメキサゾール+TX、イプロバリカル
 ブ+TX、シアゾファミド+TX、メタスルホカルブ+TX、メトラフェノン+TX、ペ
 ンシクロン+TX、フタリド+TX、ポリオキシシン+TX、プロパモカルブ+TX、ピリ
 ベンカルブ+TX、プロキナジド+TX、ピロキロン+TX、ピリオフェノン+TX、キ
 ノキシフェン+TX、キントゼン+TX、チアジニル+TX、トリアゾキシド+TX、ト
 リシクラゾール+TX、トリホリン+TX、バリダマイシン+TX、バリフェナレート+
 TX、ゾキサミド+TX、マンジプロパミド+TX、フルベンテラム+TX、イソピラザ
 ム+TX、セダキサニ+TX、ベンゾピンジフルピル+TX、ピジフルメトフェン+TX

10

20

30

40

50

、 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、イソフルシプラム + T X、イソチアニル + T X、ジピメチトロニル + 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 - ブロモ - 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 - ブロモ - 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、インピルフルキサム + 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 - フェニル] 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] ピラゾール - 4 - カルボキサミド + T X、 1 - [2 - [[1 - (4 - クロロフェニル) ピラゾール - 3 - イル] オキシメチル] - 3 - メチル - フェニル] - 4 - メチル - テトラゾール - 5 - オン + T X、 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] テトラゾール - 5 - オン + T X、アミノピリフェン + T X、アメトクトラジン + T X、アミスルプロム + T X、ペンフルフェン + T X、 (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 + T X、フロリルピコキサミド + T X、フェンピコキサミド + T X、テブフロキン + T X、イブプルフェノキン + T X、キノフメリン + T X、イソフェタミド + T X、 N - [2 - [2 , 4 - ジクロロ - 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 + T X、 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 + T X、ベンゾチオストロピン + T X、フェナマクリル + T X、 5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - チオール亜鉛塩 (2 : 1) + T X、フルオピラム + T X、フルチアニル + T X、フルオピモミド + T X、ピラプロポイン + T X、ピカルブトラ

10

20

30

40

50

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
 -((3R)-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-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-((3R)-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、-(1,1-ジメチルエチル)-[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、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(z h
 o n g s h e n g m y c i n)+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; N'-[5-ブromo-2-メチル-6
 -((1S)-1-メチル-2-プロポキシ-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romo-2-メチル-6-[(1R)
 -1-メチル-2-プロポキシ-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romo-2-メチル-6-(1-メチル-2-プロ
 ポキシ-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-プロポキシ-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romo-2
 -メチル-6-(1-メチル-2-プロポキシ-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
 /155075号に記載の方法から調製され得る); N'-[5-ブromo-2-メチル-6
 -(2-プロポキシプロポキシ)-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、I P C O M 0 0 0 2 4 9 8 7 6 Dに記載の方法から調製さ
 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
 号に記載の方法から調製され得る); 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号に記載の方法から調製さ
 れ得る); 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-3,3,3-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-[(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-[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-(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-1,3-ジメ

10

20

30

40

50

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 - (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 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 号に記載の方法から調製され得る) ; 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。本段落における化合物は、国際公開第 2017/055473 号、国際公開第 2017/055469 号、国際公開第 2017/093348 号及び国際公開第 2017/118689 号に記載の方法から調製され得る ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2017/029179 号に記載の方法から調製され得る) ; 2 - [6 - (4 - ブロモフェノキシ) - 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2017/029179 号に記載の方法から調製され得る

10

20

30

40

50

) ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 2 9 0 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 1 5 6 2 9 0 号に記載の方法から調製され得る) ; (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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 4 / 0 0 6 9 4 5 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 1 / 1 3 8 2 8 1 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX ; 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 + TX ; (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 - ペンタ - 3 - エンアミド + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 1 5 3 7 0 7 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 6 / 2 0 2 7 4 2 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 4 / 0 9 5 6 7 5 号に記載の方法から調製され得る) ; (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 + TX、(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 + TX (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 7 / 2 2 0 4 8 5 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 0 6 5 4 1 4 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX (この化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 1 5 8 3 6 5 号に記載の方法から調製され得る) ; 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 + TX、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 + TX、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 + TX、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 + TX (これらの化合物は、国際公開第 2 0 1 8 / 2 0 2 4 2 8 号に記載の方法から調製され得る) から選択される生物学的に有効な物質 ;

以下を含む微生物 : アシネトバクター・ルオフィイ (*Acinetobacter lwoffii*) + TX、アクレモニウム・アルテルナタム (*Acremonium alternatum*) + TX + TX、アクレモニウム・セファロスפורウム (*Acremonium cephalosporium*) + TX + TX、アクレモニウム・ジオスピリ (*Acremonium diospyri*) + TX、アクレモニウム・オブカラバタム (*Acremonium obclavatum*) + TX、アドキソフィス・オラナ・グラヌロヴィルス (*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 (

10

20

30

40

50

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*
alternate) + TX、アルテルナリア・カッシア (*Alternaria ca*
ssia) + TX、アルテルナリア・デストルエンシ (*Alternaria dest*
ruens) (*Smolder* (登録商標)) + TX、アムペロマイセス・キスクアリス
(*Ampelomyces quisqualis*) (*AQ10* (登録商標)) + TX、
アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) *AF36* (*AF3*
6 (登録商標)) + TX、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus fla*
vus) *NRRL 21882* (*Aflaguard* (登録商標)) + TX、アスペルギ
ルス属の種 (*Aspergillus spp.*) + TX、アウレオバシジウム・プルラ
ンス (*Aureobasidium pullulans*) + TX、アゾスピリルム属 (*Azospirillum*) + TX、(*MicroAZ* (登録商標)) + TX、*TAZO*
B (登録商標)) + TX、アゾトバクター (*Azotobacter*) + TX、アゾトバ
クター・クロオクカム (*Azotobacter chroococcum*) (*Azot*
omeal (登録商標)) + TX、アゾトバクター・シスツ (*Azotobacter*
cysts) (*Bionatural Blooming Blossoms* (登録商標))
+ TX、バチルス・アミロリケファシエンシ (*Bacillus amyloliqu*
efaciens) + TX、バチルス・セレウス (*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 chitinosp*
orus) 菌株 *AQ746* + TX、バチルス・リケニホルミス (*Bacillus li*
cheniformis) 菌株 *HB-2* (*Biostart* (商標) *Rhizoboost*
t (登録商標)) + TX、バチルス・リケニホルミス (*Bacillus lichen*
iformis) 菌株 *3086* (*EcoGuard* (登録商標)) + TX、*Green R*
eleaf (登録商標)) + TX、バチルス・シルクランス (*Bacillus cir*
culans) + TX、バチルス・フィルムス (*Bacillus firmus*) (*B*
ioSafe (登録商標)) + TX、*BioNem-WP* (登録商標)) + TX、*VOTiV*
O (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・マリスモルツイ (*Bacillus marismortui*) + T
X、バチルス・メガテリウム (*Bacillus megaterium*) + TX、バチ
ルス・マイコイデス (*Bacillus mycoides*) 菌株 *AQ726* + TX、バ
チルス・パピラエ (*Bacillus papillae*) (*Milky Spore P*
owder (登録商標)) + TX、バチルス・プミルス属の種 (*Bacillus pu*
milus 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 (*B*
acillus pumilus) 菌株 *QST 2808* (*Sonata* (登録商標)) + T
X、*Ballad Plus* (登録商標)) + TX、バチルス・スパヘリクス (*Baci*
llus spahericus) (*VectoLex* (登録商標)) + TX、バチルス
属の種 (*Bacillus spp.*) + TX、バチルス属の種 (*Bacillus sp*
p.) 菌株 *AQ175* + TX、バチルス属の種 (*Bacillus spp.*) 菌株 *AQ*
177 + TX、バチルス属の種 (*Bacillus spp.*) 菌株 *AQ178* + TX、
バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌株 *QST 713* (*CE*
ASE (登録商標)) + TX、*Serenade* (登録商標)) + TX、*Rhapsody* (
登録商標)) + TX、バチルス・サブチリス (*Bacillus subtilis*) 菌
株 *QST 714* (*JAZZ* (登録商標)) + TX、バチルス・サブチリス (*Bacil*
lus subtilis) 菌株 *AQ153* + TX、バチルス・サブチリス (*Bacil*
lus subtilis) 菌株 *AQ743* + TX、バチルス・サブチリス (*Bacil*
lus subtilis) 菌株 *QST3002* + TX、バチルス・サブチリス (*Bac*

10

20

30

40

50

illus subtilis) 菌株 QST3004+TX、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. amyloliquefaciens) 菌株 FZB24 (Taegro (登録商標)+TX、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) Cry 1Ab+TX、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)+TX、Aquabac (登録商標)+TX、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)+TX、Deliver (登録商標)+TX、CryMax (登録商標)+TX、Bonide (登録商標)+TX、Scutella WP (登録商標)+TX、Turilav WP (登録商標)+TX、Astuto (登録商標)+TX、Dipel WP (登録商標)+TX、Biobit (登録商標)+TX、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 (Bioprotec-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)+TX、Dipel (登録商標))+TX、バクテリア属の種 (bacteria spp.) (GROWMEND (登録商標)+TX、GROWSWEET (登録商標)+TX、Shootup (登録商標))+TX、クラビバクター・ミシガンシス (Clavipacter michiganensis) のバクテリオファージ (AgriPhage (登録商標))+TX、Bakflor (登録商標)+TX、ベアウベリア・バッシアナ (Beauveria bassiana) (Beaugenic (登録商標)+TX、Brocaril WP (登録商標))+TX、ベアウベリアバッシアナGHA (Beauveria bassiana GHA) (Mycotrol ES (登録商標)+TX、Mycotrol O (登録商標)+TX、BotaniGuard (登録商標))+TX、ベアウベリア・ブロングニアルチイ (Beauveria brongniartii) (Engerlingspilz (登録商標)+TX、Schweizer Beauveria (登録商標)+TX、Melocont (登録商標))+TX、ボーベリア属の種 (Beauveria spp.)+TX、ボトリチス・シネリア (Botrytis cineria)+TX、ダイズ根粒菌 (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)+TX、Intercept (登録商標)+TX、Blue Circle (登録商標))+TX、バークホルデリア・グラジイ (Burkholderia gladii)+TX、バークホルデリア・グラジオリ (Burkholderia gladioli)+TX、バークホルデリア属の種 (Burkholderia spp.)+TX、カナディアン・チスル・ファンガス (Canadian thistle fungus) (CBH Canadian Bioherbicide (登録商標))+TX、カンジダ・ブチリ (Candida

butyri) + TX、カンジダ・ファマタ (Candida famata) + TX、
 カンジダ・フルクツス (Candida fructus) + TX、カンジダ・グラブラ
 タ (Candida glabrata) + TX、カンジダ・グイリエルモンディ (Ca
 ndida guilliermondii) + TX、カンジダ・メリビオシカ (Can
 dida melibiosica) + TX、カンジダ・オレフィラ (Candida o
 leophila) 菌株 O + TX、カンジダ・パラプシロシス (Candida par
 apsiosis) + TX、カンジダ・ペリクロサ (Candida pellicu
 losa) + TX、カンジダ・プルケリマ (Candida pulcherrima)
 + TX、カンジダ・レウカウフィイ (Candida reukaufii) + TX、カン
 ジダ・サイトアナ (Candida saitoana) (Bio-Coat (登録商
 標) + TX、Biocure (登録商標) + TX、カンジダ・サケ (Candida
 sake) + TX、カンジダ属の種 (Candida spp.) + TX、カンジダ・テ
 ニウス (Candida tenuis) + TX、セデセア・ドラビスエ (Cedecea
 dravisae) + TX、セルモナス・フラビゲナ (Cellulomonas fl
 avigena) + TX、カエトミウム・コクリオデス (Chaetomium coc
 hliodes) (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・サブツガエ (Chromobacterium subts
 ugae) 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 ox
 ysporum) + TX、クラドスポリウム・クロロセファルム (Cladospori
 um chlorocephalum) + TX、クラドスポリウム属の種 (Clados
 porium spp.) + TX、クラドスポリウム・テヌイシマム (Cladospo
 rium tenuissimum) + TX、クロノスタキス・ロゼア (Clonost
 achys rosea) (EndoFine (登録商標) + TX、コレトトリカム・
 アクタタム (Colletotrichum acutatum) + TX、コニオチリウ
 ム・ミニタンス (Coniothyrium minitans) (Cotans WG (登
 録商標) + TX、コニオチリウム属の種 (Coniothyrium spp.) +
 TX、クリプトコッカス・アルビダス (Cryptococcus albidus) (Y
 IELDPLUS (登録商標) + TX、クリプトコッカス・フミコラ (Crypto
 coccus humicola) + TX、クリプトコッカス・インフィルモ・ミニアツ
 ス (Cryptococcus infirmo-miniatum) + TX、クリプト
 コッカス・ラウレンチイ (Cryptococcus laurentii) + TX、ク
 リプトフレビ・アロイコトレタ・グラニュロウイルス (Cryptophlebia l
 eucotreta granulovirus) (Cryptex (登録商標) + TX、
 クプリアビダス・カムピネンシス (Cupriavidus campinensi
 s) + TX、シジア・ポモネラ・グラニュロウイルス (Cydia pomonella
 granulovirus) (CYD-X (登録商標) + TX、シジア・ポモネラ・グ
 ラニュロウイルス (Cydia pomonella granulovirus) (Ma
 dex (登録商標) + TX、Madex Plus (登録商標) + TX、Madex Ma
 x / Carpovirusine (登録商標) + TX、エピコウヤクタケ (Cylind
 robasidium laeve) (Stumpout (登録商標) + TX、シリ
 ンドロクラジウム属 (Cylindrocladium) + TX、デバリオマイセス・ハ
 ンセニイ (Debaryomyces hansenii) + TX、ドレックスレラ・ハ
 ワイイネンシス (Drechslera hawaiiensis) + TX、エンテロ
 バクター・クロアカ (Enterobacter cloacae) + TX、エンテロバ
 クターイアカ (Enterobacteriaceae) + TX、エントモフトラ・ヴィ
 ルレンタ (Entomophthora virulenta) (Vektor (登録商標
)) + TX、エピコッカ・ムニグラム (Epicoccum nigrum) + TX、エ

10

20

30

40

50

ピコッカム・ブルプラセンス (*Epicoccum purpurascens*) + TX
 、エピコッカム属の種 (*Epicoccum spp.*) + TX、フィロバシジウム・フ
 ロリホルメ (*Filobasidium floriforme*) + TX、フザリウム・
 アクミナタム (*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・プラリフェラタム (*Fu*
sarium proliferatum) + TX、フザリウム属の種 (*Fusarium*
spp.) + TX、グララクトマイセス・ゲオトリクム (*Galactomyces ge*
otrichum) + TX、グリオクラジウム・カテナラタム (*Gliocladium*
catenulatum) (*Primastop* (登録商標) + TX、*Presto*
p (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ロセウム (*Gliocladium ro*
seum) + TX、グリオクラジウム属の種 (*Gliocladium spp.*) (*S*
oil Gard (登録商標)) + TX、グリオクラジウム・ビレンス (*Glioclad*
ium virens) (*Soilgard* (登録商標)) + TX、グラニュロウイルス
 (*Granulovirus*) (*Granupom* (登録商標)) + TX、ハロバシルス
 ・ハロフィルス (*Halobacillus halophilus*) + TX、ハロバシ
 ルス・リトラリス (*Halobacillus litoralis*) + TX、ハロバシ
 ルス・トルエペリ (*Halobacillus trueperi*) + TX、ハロモナス
 属の種 (*Halomonas spp.*) + TX、ハロモナス・スブグラシエスコラ (*H*
alomonas subglaciescola) + TX、ハロビブリオ・バリアビ
 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 (*Helico*
verpa armigera) 核多核体ウイルス (*Helicovex* (登録商標))
 + TX、アメリカタバコガ (*Helicoverpa zea*) 核多角体病ウイルス (*G*
emstar (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・アピクラタ (*Kloeckera apicula*
ta) + TX、クロエケラ属の種 (*Kloeckera spp.*) + TX、ラゲニジウ
 ム・ギガンテウム (*Lagenidium giganteum*) (*Laginex* (登
 録商標)) + TX、オンシツコナジラミ (*Lecanicillium longisp*
orum) (*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 (*Lymantria dispar*) 核多角体病ウイルス (*D*
isparvirus (登録商標)) + TX、マリノコッカス・ハロフィルス (*Mari*
nococcus halophilus) + TX、メイラ・ゲウラコニギイ (*Meira*
geulakonigii) + TX、メタリジウム・アニソプリアエ (*Metarhiz*
ium anisopliae) (*Met52* (登録商標)) + TX、メタリジウム・ア
 ニソプリアエ (*Metarhizium anisopliae*) (*Destruxin*
WP (登録商標)) + TX、メチニコピア・フルチコラ (*Metschnikowia*
fruticola) (*Shemer* (登録商標)) + TX、メチニコピア・ブルケリマ
 (*Metschnikowia pulcherrima*) + TX、ミクロドキウム・ジ
 メルム (*Microdochium dimerum*) (*Antibot* (登録商標))
 + TX、ミクロモノスポラ・コエルレア (*Micromonospora coerul*
ea) + TX、ミクロスファエロプシス・オクラセア (*Microsphaeropsi*
s ochracea) + TX、ムスコドル・アルプス (*Muscodor albus*)
 620 (*Muscudor* (登録商標)) + TX、ムスコドル・ロセウス (*Muscod*
or roseus) 菌株 A3 - 5 + TX、
 ミコルヒザエ属の種 (*Mycorrhizae spp.*) (*AMykor* (登録商標)
 + TX、*Root Maximizer* (登録商標)) + TX、ミロテシウム・ベルカリ
 ア (*Myrothecium verrucaria*) 菌株 AARC - 0255 (*DiT*

10

20

30

40

50

era (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 piliferum*) 菌株 D97 (*Sylvanex* (登録商標)) + TX、パエシロマイセス・ファリノス (*Paecilomyces farinosus*) + TX、パエシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (PFR-97 (登録商標)) + TX、PreFeRal (登録商標)) + TX、パエシロマイセス・リナシヌス (*Paecilomyces linacinus*) (Biostat WP (登録商標)) + TX、パエシロマイセスリ・ラシヌス (*Paecilomyces lilacinus*) 菌株 251 (MeloCon WG (登録商標)) + TX、パエニバチルス・ポリミクサ (*Paenibacillus polymyxa*) + TX、パントエア・アグロメラン (*Pantoea agglomerans*) (BlightBan C9-1 (登録商標)) + TX、パントエア属の種 (*Pantoea* spp.) + TX、パストリア属の種 (*Pasteuria* spp.) (Econem (登録商標)) + TX、パストリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、ペニシリウム・オーランチオグリュセウム (*Penicillium aurantiogriseum*) + TX、ペニシリウム・ビライ (*Penicillium billai*) (Jumpstart (登録商標)) + TX、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・フレクエンタンス (*Penicillium frequentans*) + TX、ペニシリウム・グリセオフルバム (*Penicillium griseofulvum*) + TX、ペニシリウム・プルプロゲナム (*Penicillium purpurogenum*) + TX、ペニシリウム属の種 (*Penicillium* spp.) + TX、ペニシリウム・ビリディカタム (*Penicillium viridicatum*) + TX、フレビオプシス・ギガンテアン (*Phlebiopsis gigantea*) (Rotstop (登録商標)) + TX、リン溶解菌 (*Phosphomeal* (登録商標)) + TX、フィトフトラ・クリプトギア (*Phytophthora cryptogea*) + TX、フィトフトラ・パルミボラ (*Phytophthora palmivora*) (Devine (登録商標)) + TX、ピチア・アノマラ (*Pichia anomala*) + TX、ピチア・グイレルモンディイ (*Pichia guilhermondii*) + TX、ピチア・メンブランファイエンス (*Pichia membranaefaciens*) + TX、ピチア・オニキス (*Pichia onychis*) + TX、ピチア・スチピテス (*Pichia stipites*) + TX、緑膿菌 (*Pseudomonas aeruginosa*) + TX、シュードモナス・アウレオフアシエンス (*Pseudomonas aureofasciens*) (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・コルゲート (*Pseudomonas corrugate*) + TX、シュードモナス・フルオレッセンス (*Pseudomonas fluorescens*) 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・リアクタンス (*Pseudomonas reactans*) + TX、シュードモナス属の種 (*Pseudomonas* spp.) + TX、シュードモナス・シリングア (*Pseudomonas 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 (*Pseudomonas fluorescens*) (Zequanox (登録商標)) + TX、シュードジマ・フロクロッサ (*Pseudozyma flocculosa*) 菌株 PF-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・トラスペオス (*Puccinia thlaspeos*) (Wood Warrior (登録商標)) + TX、ピシウム・パロ

10

20

30

40

50

エカンドルム (*Pythium paroecandrum*) + TX、ピシウム・オリ
 ガンドラム (*Pythium oligandrum*) (*Polygandron* (登録
 商標) + TX、*Polyversum* (登録商標)) + TX、ピシウム・ペリプロクム (*Pythium periplocum*) + TX、ラネラ・アクアチリス (*Rhanel
 la aquatilis*) + TX、ラネラ属の種 (*Rhanelia spp.*) + TX
 、根粒菌 (*Dormal* (登録商標) + TX、*Vault* (登録商標)) + TX、リゾク
 トニア属の種 (*Rhizoctonia*) + TX、ロドコッカス・グロベルルス (*Rho
 dococcus 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、ロドトルラ属の種 (*Rhodotorula spp.*) + TX、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・ムシラグノサ
 (*Rhodotorula mucilagnosa*) + TX、ロドトルラ・ルブラ (*R
 hodotorula rubra*) + TX、サッカロマイセス・セレビスエ (*Sacc
 haromyces cerevisiae*) + TX、サリノコッカス・ロセウス (*Sal
 linococcus roseus*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclero
 tinia minor*) + TX、スクレロチニア・ミノル (*Sclerotinia m
 inor*) (*SARRITOR* (登録商標)) + TX、シタリジウム属の種 (*Scyta
 lidium spp.*) + TX、シタリジウム・ウレジニコラ (*Scytalidium
 uredinicola*) + TX、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exi
 gua*) 核多角体病ウイルス (*Spod-X* (登録商標) + TX、*Spexit* (登録商
 標)) + TX、セラチア・マルセセンス (*Serratia marcescens*) +
 TX、セラチア・プリムシカ (*Serratia plymuthica*) + TX、セラ
 チア属の種 (*Serratia spp.*) + TX、ソルダリア・フィミコラ (*Sord
 aria fimicola*) + TX、エジプトヨトウ (*Spodoptera litt
 oralis*) 核多核体ウイルス (*Littovir* (登録商標)) + TX、スポロボロ
 ミセス・ロセウス (*Sporobolomyces roseus*) + TX、ステノトロ
 ホモナス・マルトフィリア (*Stenotrophomonas maltophili
 a*) + TX、ストレプトマイセス・アヒグロスコピクス (*Streptomyces a
 hygrosopicus*) + TX、ストレプトマイセス・アルバドンカス (*Stre
 ptomyces albaduncus*) + TX、ストレプトマイセス・エクサホリア
 テス (*Streptomyces exfoliates*) + TX、ストレプトマイセス
 ・ガルブス (*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 griseovi
 ridis*) (*Mycostop* (登録商標)) + TX、ストレプトマイセス・リディク
 ス (*Streptomyces lydicus*) (*Actinovate* (登録商標)
) + TX、ストレプトマイセス・リディクス (*Streptomyces lydicu
 s*) 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
 プシス・ミノル (*Tillettiosis minor*) + TX、チレチオプシス属の
 種 (*Tillettiosis spp.*) + TX、トリコデルマ・アスペレルム (*Tr
 ichoderma asperellum*) (*T34 Biocontrol* (登録商標
)) + TX、トリコデルマ・ガムシイ (*Trichoderma gamsii*) (*Te
 net* (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
 マツム (*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 (*Trichod*

10

20

30

40

50

erma harzianum) T - 22 (Trianium - P (登録商標) + TX、PlantShield HC (登録商標) + TX、RootShield (登録商標) + TX、Trianium - G (登録商標) + TX、トリコデルマ・ハルジアヌム (Trichoderma harzianum) T - 39 (Trichodex (登録商標) + TX、トリコデルマ・インハマツム (Trichoderma inhamatum) + TX、トリコデルマ・コニングイ (Trichoderma koningii) + TX、トリコデルマ属の種 (Trichoderma spp.) LC 52 (Sentinel (登録商標) + TX、トリコデルマ・リグノルム (Trichoderma lignorum) + TX、トリコデルマ・ロンギブラキアツム (Trichoderma longibrachiatum) + TX、トリコデルマ・ポリスボルム (Trichoderma polysporum) (Binab T (登録商標) + TX、トリコデルマ・タクシ (Trichoderma taxi) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) + TX、トリコデルマ・ビレンス (Trichoderma virens) (旧名グリオクラジウム・ビレンス (Gliocladium virens) GL - 21) (SoilGuard (登録商標) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) + TX、トリコデルマ・ビリデ (Trichoderma viride) 菌株 ICC 080 (Remedier (登録商標) + TX、トリコスポロン・プルランス (Trichosporon pullulans) + TX、トリコスポロン属の種 (Trichosporon spp.) + TX、トリコテシウム属の種 (Trichothecium spp.) + TX、トリコテシウム・ロセウム (Trichothecium roseum) + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94670 + TX、アカエガマノホタケ (Typhula phacorrhiza) 菌株 94671 + TX、ウロクラディウム・アトラム (Ulocladium atrum) + TX、ウロクラディウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansii) (Botry - Zen (登録商標) + TX、ウスチラゴ・マイディス (Ustilago maydis) + TX、様々な細菌及び補助微量栄養素 (Natural II (登録商標) + TX、様々な真菌 (Millennium Microbes (登録商標) + TX、ベルチシリウム・クラミドスポリウム (Verticillium chlamydosporium) + TX、ベルチシリウム・レカニイ (Verticillium lecanii) (Mycotal (登録商標) + TX、Vertalec (登録商標) + TX、Vip3Aa20 (VIPtera (登録商標) + TX、ビルギバクリルス・マリスモルツイ (Virgibacillus marismortui) + TX、キサントモナス・カムベストリス pv. ポアエ (Xanthomonas campestris pv. Poae) (Camperico (登録商標) + TX、ゼノラブダス・ボビエニイ (Xenorhabdus bovienii) + TX、ゼノラブダス・ネマトフィルス (Xenorhabdus nematophilus) ; 以下を含む植物抽出物 : 松油 (Retenol (登録商標) + TX、アザジラクチン (Plasma Neem Oil (登録商標) + TX、AzaGuard (登録商標) + TX、MeemAzaal (登録商標) + TX、Molt - X (登録商標) + TX、植物性の昆虫成長制御剤 (Botanical IGR) (Neemazad (登録商標) + TX、Neemix (登録商標) + TX、ナタネ油 (Lilly Miller Vegol (登録商標) + TX、アメリカアリタソウ (Chenopodium ambrosioides near ambrosioides) (Requiem (登録商標) + TX、キク属 (Chrysanthemum) 抽出物 (Crisant (登録商標) + TX、ニーム油の抽出物 (Trilogy (登録商標) + TX、シソ科植物 (Labiatae) の精油 (Botania (登録商標) + TX、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 (Garden insect killer (登録商標) + TX、グリシンベタイン (Greenstim (登録商標) + TX、ニンニク + TX、レモングラス油 (GreenMatch (登録商標) + TX、ニーム油 + TX、イヌハ

10

20

30

40

50

ッカ (*Nepeta cataria*) (キャットニップ油) + TX、イヌハッカ (*Nepeta catarina*) + 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)) + TX、*Sakalia* (登録商標)) + TX、ロテノン (*Eco Roten* (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、ティーツリー油 (*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ニ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)) ;
 以下のものを含むフェロモン : クロネハイロヒメハマキ (*blackheaded 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、*Musc amone* (*Snip7 Fly Bait* (登録商標)) + TX、*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、(E + TX, Z + TX, Z) - 3 + TX、8 + TX、11 テトラデカトリエニルアセテート + TX、(Z + TX, Z + TX, E) - 7 + TX、11 + TX、13 - ヘキサデカトリエナール + TX、(E + TX, Z) - 7 + TX、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、*Bio lure* (登録商標) + TX、*Check - Mate* (登録商標) + TX、ラバンズリルセネシオアート (*Lavandulyl senecioate*) ;
 以下を含む生物 : アブラコバチ (*Aphelinus abdominalis*) + TX、エルビアブラバチ (*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)) + TX、*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)) + TX、*Spical* (登録商標)) + TX、アンブ

10

20

30

40

50

リセイウス・ククメリス (Amblyseius cucumeris) (Thriplex (登録商標) + TX、Bugline cucumeris (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、スワルスキーカブリダニ (Amblyseius swirskii) (Bugline swirskii (登録商標) + TX、Swirskii-Mite (登録商標) + TX、ケナガカブリダニ (Amblyseius womersleyi) (WomerMite (登録商標) + TX、アミツス・ヘスペリヅム (Amitus hesperidum) + 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 loeckii + TX、アナギルス・シュードコッカス (Anagyrus pseudococci) (Citripar (登録商標) + TX、アニセツス・ベネフィクス (Anicetus benefices) + TX、ゾウムシコガネコバチ (Anisopteromalus calandrae) + TX、アントコリス・ネモラリス (Anthocoris nemoralis) (Anthocoris-System (登録商標) + TX、アブラコバチ (Aphelinus abdominalis) (Apheline (登録商標) + TX、Aphiline (登録商標) + TX、アフエリヌス・アシキス (Aphelinus asychis) + TX、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (Ahipar (登録商標) + TX、エルビアブラバチ (Aphidius ervi) (Ervipar (登録商標) + TX、アフィジウス・ギフエンシス (Aphidius gifuenssis) + TX、アフィジウス・マトリカリアエ (Aphidius matricariae) (Ahipar-M (登録商標) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidend (登録商標) + TX、アフィドレテス・アフィディマイザ (Aphidoletes aphidimyza) (Aphidoline (登録商標) + TX、アフィチス・リングナネンシス (Aphytis lingnanensis) + TX、アフィチス・メリヌス (Aphytis melinus) + TX、アプロストセツス・ヘゲノウイ (Aprostocetus hagenowii) + TX、アセタ・コリアリア (Atheta coriaria) (Staphyline (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) (Natupol Beehive (登録商標) + TX、セイヨウオオマルハナバチ (Bombus terrestris) (Beeline (登録商標) + TX、Tripol (登録商標) + TX、セファロノミア・ステファノデリス (Cephalonomia stephanoderis) + TX、チノコルス・ニグリツス (Chilocorus nigritus) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla carnea) (Chrysoline (登録商標) + TX、ヤマトクサカゲロウ (Chrysoperla 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・インゲヌウス (Cirrospilus ingenuus) + TX、シロスピルス・クアドリストリアツス (Cirrospilus quadristriatus) + TX、シトロスチクス・フィロクニストイデス (Citrostichus phyllocnistoides) + TX、クロステロセルス・カマエレオン (Closterocherus chamaeleon) + TX、クロステロセルス属 (Closterocherus spp.) + TX、コシドキセノイデス・ペルミヌツス (Coccidoxenoides 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 (Cotesia plutellae) + TX、ツマアカオオテントウムシ

10

20

30

40

50

(Cryptolaemus montrouzieri) (Cryptobug (登録商標) + TX、Cryptoline (登録商標) + TX、キムネタマキスイ (Cybocephalus nipponicus) + TX、ハモグリコマコバチ (Dacnusa sibirica) + TX、ハモグリコマコバチ (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・プシルス (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) + TX、Digline (登録商標) + TX、ハモグリコマコバチ (Dacnusa sibirica) (DacDigline (登録商標) + TX、Minex (登録商標) + TX、ディベルシネルブス属 (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) + TX、Encarline (登録商標) + TX、En-Strip (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmoceris 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・ハントイエンス (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、エルトモセリス・カリフォルニクス (Eretmoceris californicus) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmoceris eremicus) (Ercal (登録商標) + TX、Eretline e (登録商標) + TX、サバクツヤコバチ (Eretmoceris eremicus) (Bemimix (登録商標) + TX、エルトモセリス・ハヤチ (Eretmoceris hayati) + TX、エルトモセリス・ムンヅス (Eretmoceris mundus) (Bemipar (登録商標) + TX、Eretline m (登録商標) + TX、エルトモセリス・シフォニニ (Eretmoceris 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 ceratitivorius) + TX、ホルモノネチン (Wireless Beehome (登録商標) + TX、アリガタシマアザミウマ (Franklinothrips vespiformis) (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、シマメイガコマコバチ (Habrobracon hebetor) + TX、ナミテントウ (Harmonia axyridis) (HarmoBee tle (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) + TX、Nemaseek (登録商標) + TX、Terranem - Nam (登録商標) + TX、Terranem (登録商標) + TX

、Larvanem (登録商標) + TX、B - Green (登録商標) + TX、NemAttack (登録商標) + TX、Nematop (登録商標) + TX、ヘテロラブディ
 ティス・メジディス (Heterorhabditis megidis) (Nemasy
 H (登録商標) + TX、BioNem H (登録商標) + TX、Exhibitline
 hm (登録商標) + TX、Larvanem - M (登録商標) + TX、サカハチ
 テントウ (Hippodamia convergens) + TX、ヒポアスピス・アク
 レイファー (Hypoaspis aculeifer) (Aculeifer - Sys
 tem (登録商標) + TX、Entomite - A (登録商標) + TX、ヒポアスピス
 ・ミルス (Hypoaspis miles) (Hypoline m (登録商標) + TX
 、Entomite - M (登録商標) + TX、ルバリア・レウコスポイデス (Lbal
 ia leucospoides) + TX、レカノイデウス・フロシシムス (Lecan
 oideus floccissimus) + TX、レモファグス・エラブンツス (Le
 mophagus errabundus) + TX、レプトマスチデア・アブノルミス (Le
 ptomastidea abnormis) + TX、レプトマスチクス・ダクチロ
 ピ (Leptomastix dactylopii) (Leptopar (登録商標)
) + TX、レプトマスチクス・エポナ (Leptomastix epona) + TX、
 リンドルス・ロファンタエ (Lindorus lophanthae) + TX、リボレ
 クシス・オレグマエ (Lipolexis oregmae) + TX、ルシリア・カエサ
 ル (Lucilia caesar) (Natufly (登録商標) + TX、リシフレ
 ブス・テストケイペス (Lysiphlebus testaceipes) + TX、マ
 クロロフス・カリギノス (Macrolophus caliginosus) (Mi
 rical - N (登録商標) + TX、Macroline c (登録商標) + TX、Mi
 rical (登録商標) + TX、メソセイウルス・ロンギペス (Mesoseiulu
 s longipes) + TX、メタフィクス・フラプス (Metaphycus fla
 vus) + TX、メタフィクス・ロウンスブリー (Metaphycus lounsb
 uryi) + 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 (Micro
 terys flavus) + TX、ムスシディフラクス・ラポトレルス (Muscid
 ifurax raptorellus) 及びスパランギア・カメロニ (Spalang
 ia cameroni) (Biopar (登録商標) + TX、ネオドリイヌス・チフ
 ロシバエ (Neodryinus typhlocybae) + TX、ミヤコカブリダニ
 (Neoseiulus californicus) + TX、ネオセイウルス・ククメ
 リス (Neoseiulus cucumeris) (THRYPEX (登録商標) +
 TX、ネオセイウルス・ファラシス (Neoseiulus fallacis) + TX
 、ネシディオコリス・テヌイス (Nesideocoris tenuis) (Nesi
 dioBug (登録商標) + TX、Nesibug (登録商標) + TX、オフィラ・ア
 エネセン (Ophyra aenescens) (Biofly (登録商標) + TX
 、シノビハナカメムシ (Orius insidiosus) (Thripor - I (登
 録商標) + TX、Oriline i (登録商標) + TX、エルヒメハナカメムシ (O
 rius laevigatus) (Thripor - L (登録商標) + TX、Oril
 ine l (登録商標) + TX、オリウス・マジュスクルス (Orius majusc
 ulus) (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 junip
 erorum) + TX、ペディオビウス・ホベオレツス (Pediobius fove
 olatus) + TX、ファスマルハブディティス・ヘルマフロディタ (Phasmar
 habditis hermaphrodita) (Nemaslug (登録商標) +
 TX、フィマスチクス・コフエア (Phymastichus coffea) + TX
 、フィトセイウルス・マクロピルス (Phytoseiulus macropilus
) + TX、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) (Sp

10

20

30

40

50

index (登録商標) + TX、*Phytoline p* (登録商標) + TX、ポデイス
 ス・マクリベントリス (*Podisus maculiventris*) (*Podisu*
s (登録商標)) + TX、シューダクテオン・クルバツス (*Pseudacteon c*
urvatus) + TX、シューダクテオン・オブツス (*Pseudacteon o*
btusus) + TX、シューダクテオン・トリクスピス (*Pseudacteon t*
ricuspis) + TX、シューダフィクス・マクリペンニス (*Pseudaphyc*
us 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
 ロル (*Psytalia concolor*) (複合体) + TX、クアドラスティクス 10
 属 (*Quadrastichus spp.*) + TX、リゾビウス・ロファンタエ (*Rh*
yzobius lophanthae) + TX、ベダリアテントウ (*Rodolia c*
ardinalis) + TX、オオクビキレガイ (*Rumina decollate*)
 + TX、セミエラケア・ペティオラツス (*Semielacher petiolatu*
s) + TX、シトピオン・アベナエ (*Sitobion avenae*) (*Erviba*
nk (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) + TX、*Milleniu*
m (登録商標) + TX、*BioNem C* (登録商標) + TX、*NemAttack* (登
 録商標) + TX、*Nemastar* (登録商標) + TX、*Capsanem* (登録商標)
) + TX、スタイナーネマ・フェルティアエ (*Steinernema feltiae* 20
) (*NemaShield* (登録商標) + TX、*Nemasys F* (登録商標) + TX
 、*BioNem F* (登録商標) + TX、*Steinernema - System* (登録
 商標) + TX、*NemAttack* (登録商標) + TX、*Nemaplus* (登録商標)
 + TX、*Exhibitline sf* (登録商標) + TX、*Scia - rid* (登録商
 標) + TX、*Entonem* (登録商標) + TX、スタイナーネマ・クラッセイ (*St*
einernema krausseii) (*Nemasys L* (登録商標) + TX、*Bi*
oNem L (登録商標) + TX、*Exhibitline srb* (登録商標)) + TX
 、スタイナーネマ・リオブラベ (*Steinernema riobrave*) (*Bio*
Vector (登録商標) + TX、*BioVektor* (登録商標)) + TX、スタイ
 ナーネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (*Nema*
tac S (登録商標)) + TX、スタイナーネマ属 (*Steinernema spp.* 30
) + TX、スタイナーネマチド属 (*Steinernematid spp.*) (*Gua*
rdian Nematodes (登録商標)) + TX、ステトルス・プンクチルム (*S*
tethorus 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
 イクス・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 (*Tri*
chogramma brassicae) (*Tricholine b* (登録商標)) +
 TX、タマゴヤドリバチ (*Trichogramma brassicae*) (*Tric*
ho - Strip (登録商標)) + TX、ヨトウタマゴバチ (*Trichogramma*
evanescens) + TX、トリコグラムマ・ミヌツム (*Trichogramma*
minutum) + TX、アワノメイガタマゴバチ (*Trichogramma ost*
riniae) + TX、トリコグラムマ・プラトネリ (*Trichogramma pl*
atneri) + TX、トリコグラムマ・プレチオスム (*Trichogramma p*
retiosum) + TX、キアシキイロヒラタヒメバチ (*Xanthopimpla*
stemmator) ; 及び
 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 purpu*
reum) (*Chontrol Paste* (登録商標)) + TX、コレトトリクム・グ 50

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) (ハーピン) (ProAct (登録商標)) + TX、Ni-HIBIT Gold CST (登録商標)) + TX、リン酸第二鉄 (Ferri-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、ミコレプトジスキス・テレストリス (Mycoleptodiscus 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 (MilStop (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) + TX、Rebell Amarillo (登録商標)) + TX 及びトラップ (Takitrapping y + b (登録商標)) + TX。

【0548】

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において丸括弧中に示される項目番号でその中に記載されており；例えば、「アバメクチン」という化合物は、項目番号 (1) で記載されている。「[CCN]」が、上記において特定の化合物に付加されている場合、該当する化合物は、“Compendium of Pesticide Common Names” に含まれており、それは、インターネット上でアクセス可能であり [A. Wood; 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。

【0549】

上記の有効成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」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ツ名、「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ツ登録番号を意味する。

【0550】

表A-1～A-297及び表Pにおいて定義されている化合物から選択される式Iの化

10

20

30

40

50

合物と、上記の有効成分と有効成分混合物は、表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P において定義されている化合物から選択される 1 種の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。

10

【0551】

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において実施される診断方法を除く。

【0552】

表 A - 1 ~ A - 297 及び表 P において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において、「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及び逐次、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 の化合物及び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。

20

【0553】

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。

30

【0554】

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。

【0555】

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するための組成物の使用が、本発明の他の主題である。典型的な濃度の比率は、0.1 ~ 1000 ppm、好ましくは、0.1 ~ 500 ppm の有効成分である。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 ~ 2000 g の有効成分、特に 10 ~ 1000 g / ha、好ましくは、10 ~ 600 g / ha である。

40

【0556】

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ことにより、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

50

の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

【0557】

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／真菌に依りて決まり、一般に、100kgの種子当たり1～200グラム、好ましくは、100kgの種子当たり5～150グラム（100kgの種子当たり10～100グラムなど）である。

10

【0558】

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、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

【0559】

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、施用方法に依りて、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。一実施形態において、本発明は、式Ⅰの化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これにより、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利用可能になる。

20

【0560】

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、当技術分野において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。

30

【0561】

本発明の化合物は、低施用量での効力がより高いことにより且つ／又は異なる有害生物防除により他の類似の化合物と区別可能であり、これは、必要に依りて、より低い濃度、例えば10ppm、5ppm、2ppm、1ppm若しくは0.2ppm；又は300、200若しくは100mgのAI/m²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。

【0562】

本発明の各態様及び実施形態において、「から基本的になる」及びその語尾変化は、「含む」及びその語尾変化の好ましい形態であり、「からなる」及びその語尾変化は、「から基本的になる」及びその語尾変化の好ましい形態である。

40

【0563】

本出願における開示により、本明細書に開示の実施形態の各々及びすべての組み合わせが利用可能となる。

【0564】

式Ⅰの化合物に係る本明細書における開示は、式Ⅰ*、Ⅰ'a、Ⅰ-A、Ⅰ-A並びに表A-1～A-297及び表Pの各々の化合物についても等しく適用されることに留意すべきである。さらに、式Ⅰ'aの好ましい鏡像異性体は、表A-1～A-297及び表Pの化合物についても適用される。また、式Ⅰ*、Ⅰ'a、Ⅰ-A、Ⅰ-A並びに表A-1～A-

50

297及び表P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/又はN-オキシドが本明細書において利用可能にされる。

【0565】

生物学的実施例：

以下の実施例により本発明を例示する。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り公知の化合物と区別可能であり、これは、実施例において概述されている実験手法を用い、必要に応じて例えば50ppm、24ppm、12.5ppm、6ppm、3ppm、1.5ppm、0.8ppm又は0.2ppmといったより少ない施用量を用いて、当業者により検証可能である。

【0566】

実施例B1：ジアブロチカバルテアタ(Diabrotica balteata)(コーンルートワーム)

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天層上に置いたトウモロコシの芽を、吹付けにより、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液で処理した。乾燥させた後、プレートにL2幼虫を外寄生させた(1ウェル当たり6~10匹)。外寄生の4日後にサンプルを未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

【0567】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方(死亡率又は成長阻害)において少なくとも80%の防除の効果をもたらした：

P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P34、P35、P38、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P48、P49、P51、P52、P54、P57。

【0568】

実施例B2：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、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉にN2若虫を外寄生させた。サンプルを外寄生の5日後に未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

【0569】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方(死亡率又は成長阻害)において少なくとも80%の防除の効果をもたらした：

P12、P26、P40、P52。

【0570】

実施例B3：ミカンキイロアザミウマ(Frankliniella occidentalis)(ミカンキイロアザミウマ(Western flower thrips))
：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フランクリニエラ属(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。

【0571】

実施例B4：ニカメイガ(Chilo suppressalis)(ニカメイチュウ)

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、プレートにL2幼虫を外寄生させた(1ウェル当たり6~8匹)。サンプルを未処理の

10

20

30

40

50

サンプルと比べて外寄生の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。カテゴリ、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害の少なくとも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。

【0572】

以下の化合物は、200ppmの施用量で3つのカテゴリ（死亡率、摂食阻害効果又は成長阻害）の少なくとも1つにおいて少なくとも80%の防除をもたらした：

P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P37、P38、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P48、P49、P50、P51、P52、P53、P54、P57。

10

【0573】

実施例B5：コナガ (*Plutella xylostella*) (コナガ (*Diamond back moth*))

人工餌料の入った24ウェルマイクロタイタープレートと、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、コナガの卵をプラスチック製のステンシル介してゲル吸取り紙上にピペットし、プレートをこれで閉じた。サンプルを外寄生の8日後に未処理のサンプルと比べて死亡率及び成長阻害について評価した。

20

【0574】

以下の化合物は、200ppmの施用量で2つのカテゴリの少なくとも一方（死亡率又は成長阻害）において少なくとも80%の防除の効果をもたらした：

P1、P2、P3、P4、P5、P6、P7、P8、P9、P10、P11、P12、P13、P14、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P22、P23、P24、P25、P26、P27、P28、P29、P30、P31、P32、P33、P34、P35、P36、P37、P38、P39、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P49、P50、P51、P52、P53、P54、P55、P57。

30

【0575】

実施例B6：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))：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ヒマワリの葉片を置き、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアブラムシ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の6日後に死亡率について評価した。

【0576】

以下の化合物は、少なくとも80%の死亡率を200ppmの施用量でもたらした：

P35、P55。

40

【0577】

実施例B7：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))：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マメの実生の根を、10,000ppm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。

【0578】

実施例B8：モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green peach aphid*))：固有活性

10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト化合物を24ウェルマ

50

イクロタイタープレートにピペットにより適用し、スクロース溶液と混合した。プレートを、伸ばした 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。

【0579】

実施例 B 9 : エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ (*Egyptian cotton leaf worm*))

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の上に置き、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べて外寄生の 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。カテゴリ、死亡率、摂食阻害効果及び成長阻害の少なくとも 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エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) の防除がもたらされている。

10

【0580】

以下の化合物は、200 ppm の施用量で 3 つのカテゴリ (死亡率、摂食阻害効果又は成長阻害) の少なくとも 1 つにおいて少なくとも 80 % の防除をもたらした :

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 18、P 19、P 20、P 21、P 22、P 23、P 24、P 25、P 26、P 27、P 28、P 29、P 30、P 31、P 32、P 33、P 34、P 35、P 36、P 37、P 38、P 39、P 40、P 41、P 42、P 43、P 44、P 45、P 46、P 47、P 48、P 49、P 51、P 52、P 54、P 57。

20

【0581】

実施例 B 10 : エジプトヨトウ (*Spodoptera littoralis*) (エジプトヨトウ (*Egyptian cotton leaf worm*))

ピペットにより、テスト化合物を 10,000 ppm の DMSO ストック溶液から 24 ウェルプレートに適用し、寒天と混合した。レタスの種子を寒天の上に置き、マルチウェルプレートを同様に寒天を含む他のプレートで閉じた。7 日後、化合物は、根に吸収され、レタスが蓋プレート中に成長した。次いで、レタスの葉を蓋プレート中に切り取った。スポドプテラ (*Spodoptera*) 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湿らせたゲル吸取り紙上にとり、蓋プレートをこれで閉じた。サンプルを未処理のサンプルと比べて外寄生の 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。

30

【0582】

以下の化合物は、12.5 ppm のテスト割合で 3 つのカテゴリ (死亡率、摂食阻害又は成長阻害) における少なくとも 1 つにおいて少なくとも 80 % の防除の効果をもたらした :

P 12。

40

【0583】

実施例 B 11 : ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*) (タマネギアザミウマ) : 摂食 / 接触活性

ヒマワリの葉片を 24 ウェルマイクロタイタープレート中の寒天の上に置き、10,000 ppm の DMSO ストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のアザミウマ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生の 6 日後に死亡率について評価した。

【0584】

実施例 B 12 : モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) (モモアカアブラムシ (*Green Peach Aphid*))

50

10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト化合物を液体ハンドリングロボットにより96-ウェルマイクロタイタープレート中に適用し、スクロース溶液と混合した。96-ウェルマイクロタイタープレート上にParafilmを伸ばし、96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いた。アブラムシをウェル中のParafilm上に直接ふり分けた。外寄生させたプレートをゲル吸取り用厚紙及び第2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。

【0585】

以下の化合物は、少なくとも80%の死亡率を50ppmの施用量でもたらした：

P23、P43、P47。

10

【0586】

実施例B13：コナガ(Plutella xylostella)(コナガ(Diamondback Moth))

人工餌料を含む96-ウェルマイクロタイタープレートを、液体ハンドリングロボットにより、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液により処理した。乾燥させた後、卵(1ウェル当たり約30個)をネットを付けた蓋に外寄生させ、これを食餌の上方に吊り下げた。卵が付加するとL1幼虫が食餌に降りる。サンプルを外寄生の9日後に死亡率について評価した。

【0587】

以下の化合物は、500ppmの施用量で少なくとも80%の死亡率の効果をもたらした：

20

P1、P3、P4、P8、P12、P13、P15、P16、P17、P18、P19、P20、P21、P23、P27、P28、P29、P30、P31、P35、P36、P40、P41、P42、P43、P44、P45、P46、P47、P49、P52、P53、P56、P57。

【0588】

実施例B14：ナミハダニ(Tetranychus urticae)(ナミハダニ)：摂食/接触活性

24ウェルマイクロタイタープレート中の寒天上のインゲンマメの葉片に、10,000ppmのDMSOストック溶液から調製したテスト水溶液を噴霧した。乾燥させた後、葉片に様々な齢数のダニ個体群を外寄生させた。サンプルを外寄生から8日後に混合個体群(活動期)における死亡率について評価した。

30

【0589】

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：

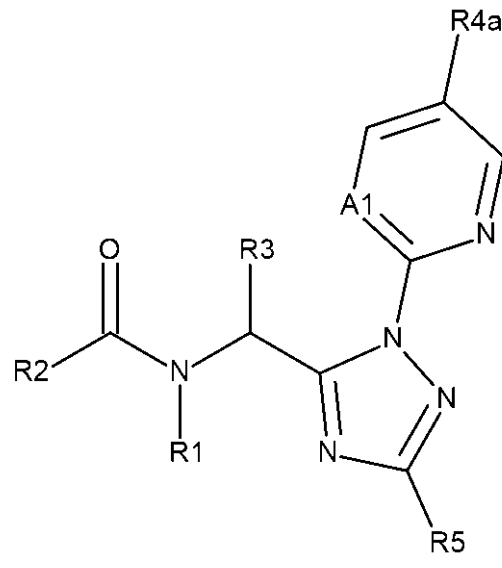
P16。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔1〕式I

—[化1]

40



10

(式中、

R_1 は、 H 、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ シアノアルキル、アミノカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシカルボニル $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ ニトロアルキル、トリメチルシラン $C_1 \sim C_6$ 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、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル $C_1 \sim C_2$ アルキル-、 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル $C_1 \sim C_2$ アルキル-（ここで、前記 $C_3 \sim C_4$ シクロアルキル基は、1又は2個のハロゲン原子で置換されている）、オキセタン-3-イル- CH_2 -、ベンジル又はハロゲン若しくは $C_1 \sim C_6$ ハロアルキルで置換されたベンジルであり；

20

R_2 は、フェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン、ピリダジン並びにそれぞれ1～3個の置換基で置換されているフェニル、ピリジン、ピリミジン、ピラジン及びピリダジンから選択されるが、ただし、前記置換基は、 $C=X$ が結合されている炭素に隣接するいずれの炭素上にもなく、及び各置換基は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキル、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルチオ、 $C_1 \sim C_3$ アルコキシ、 $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシ、ハロ、 SF_5 、 CN 、 $CONH_2$ 及び $C(S)NH_2$ から独立して選択され；

30

R_3 は、 $C_1 \sim C_3$ アルキル又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルキルであり；

A_1 は、 CR_{4b} 又は N であり；

R_{4b} は、水素又はハロゲンであり；

R_{4a} は、シアノ又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシであり；

R_5 は、ハロゲン、アミノ、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル)アミノ、ジ $(C_1 \sim C_3$ アルキル)アミノ、ヒドロキシ、シアノ、 $C_3 \sim C_4$ ハロシクロアルキル、 $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ ハロアルキルスルホニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルファニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルフィニル、 $C_1 \sim C_4$ アルキルスルホニル、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル)スルホニルアミノ、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル)スルホニル $(C_1 \sim C_3$ アルキル)アミノ、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル) $NHC(O)$ 、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル) $_2NHC(O)$ 、 $(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル) $NHC(O)$ 、 $(C_3 \sim C_6$ シクロアルキル) $(C_1 \sim C_3$ アルキル) $NHC(O)$ 、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル) $C(O)(C_1 \sim C_3$ アルキル) N 、 $(C_1 \sim C_3$ アルキル) $C(O)NH$ 、ジフェニルメタンイミン又は $C_1 \sim C_3$ ハロアルコキシである）

40

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。

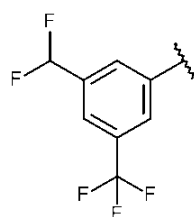
〔2〕 R_3 は、メチルである、前記〔1〕に記載の化合物。

50

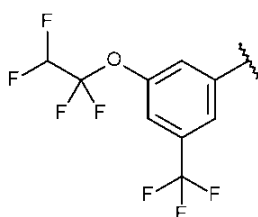
〔 3 〕 R_1 は、水素、メチル、エチル、 n -プロピル、イソブチル、シクロプロピルメチル又は HCH_2CCH_2- である、前記〔 1 〕又は〔 2 〕に記載の化合物。

〔 4 〕 R_2 は、 $M-1 \sim M-12$

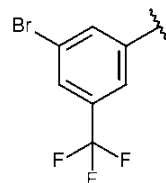
〔化 2〕



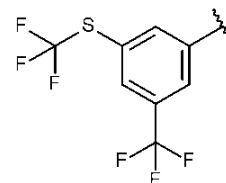
M-1



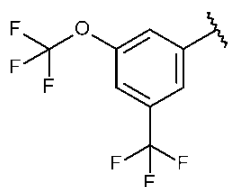
M-2



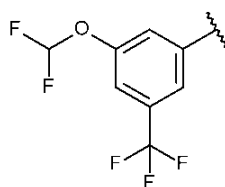
M-3



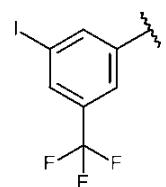
M-4



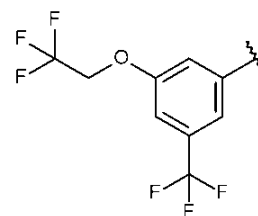
M-5



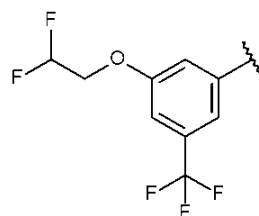
M-6



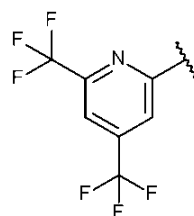
M-7



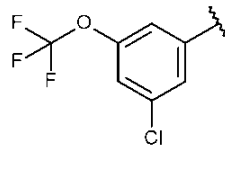
M-8



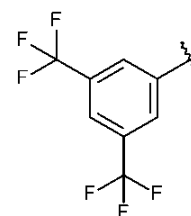
M-9



M-10



M-11



M-12

の 1 つである、前記〔 1 〕～〔 3 〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔 5 〕 R_{4a} は、シアノ又は $C_1 \sim C_3$ フルオロアルコキシである、前記〔 1 〕～〔 4 〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔 6 〕 A_1 は、 N である、前記〔 1 〕～〔 5 〕のいずれか一項に記載の化合物。

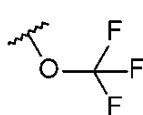
〔 7 〕 A_2 は、 CH である、前記〔 1 〕～〔 5 〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔 8 〕 R_5 は、 $J-1 \sim J-11$

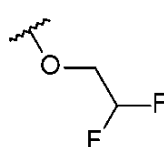
〔化 3〕



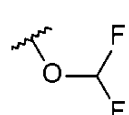
J-1



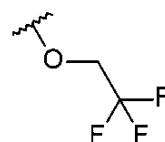
J-2



J-3



J-4



J-5



J-6



J-7



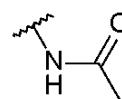
J-8



J-9



J-10



J-11

10

20

30

40

50

から選択される、前記〔１〕～〔７〕のいずれか一項に記載の化合物。

〔９〕前記〔１〕～〔８〕のいずれか一項に記載の化合物と、１種以上の助剤及び希釈剤と、任意に１種以上の他の有効成分とを含む組成物。

〔１０〕（ｉ）昆虫、ダニ類、線虫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、殺線虫的又は殺軟体動物的に有効な量の、前記〔１〕～〔８〕のいずれか一項に記載の化合物又は前記〔９〕に記載の組成物を適用するステップを含む方法；又は

（ｉｉ）昆虫、ダニ類、線虫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、前記〔１〕～〔８〕のいずれか一項に記載の化合物又は前記〔９〕に記載の組成物で処理するステップを含む方法；又は

（ｉｉｉ）寄生虫の防除を、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、前記〔１〕～〔８〕のいずれか一項に記載の化合物又は前記〔９〕に記載の組成物を投与するステップを含む方法。

〔１１〕前記〔１〕～〔８〕のいずれか一項に記載の化合物又は前記〔９〕に記載の組成物を含むか、又はそれで処理されているか、又はそれに付着されている、種子などの植物繁殖材料。

10

20

30

40

50

フロントページの続き

(51)国際特許分類

F I

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	
A 0 1 P	9/00 (2006.01)	A 0 1 P	9/00	
A 0 1 N	43/653 (2006.01)	A 0 1 N	43/653	A
A 0 1 N	47/02 (2006.01)	A 0 1 N	47/02	
A 0 1 M	1/20 (2006.01)	A 0 1 M	1/20	A

(74)代理人 100111796

弁理士 服部 博信

(74)代理人 100136249

弁理士 星野 貴光

(72)発明者 エドマンズ アンドリュウ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 コレス クリーガー アマンディーヌ

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 ビターナ トマス

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 レンドラー セバスチャン

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

(72)発明者 シェッツァー ユルゲン ハリー

スイス 4 3 3 2 シュタイン シャッフハウザーシュトラーセ シンジェンタ クロップ プロテク
ション アクチェンゲゼルシャフト内

審査官 増永 淳司

(56)参考文献 特表 2 0 1 8 - 5 1 7 7 1 6 (J P , A)

特表 2 0 2 2 - 5 2 3 4 3 0 (J P , A)

特表 2 0 2 2 - 5 2 6 7 9 5 (J P , A)

特表 2 0 2 2 - 5 0 5 3 7 6 (J P , A)

特表 2 0 2 1 - 5 2 2 2 3 3 (J P , A)

特表 2 0 2 1 - 5 2 1 1 3 3 (J P , A)

特表 2 0 2 1 - 5 2 1 2 2 3 (J P , A)

特表 2 0 2 1 - 5 2 2 1 8 1 (J P , A)

(58)調査した分野 (Int.Cl., D B 名)

C 0 7 D 4 0 1 / 0 4

C 0 7 D 4 0 3 / 0 4

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6

A 6 1 P 3 3 / 1 4

A 0 1 P 7 / 0 2

A 0 1 P 7 / 0 4

A 0 1 P 9 / 0 0

A 0 1 N 4 3 / 6 5 3

A 0 1 N 4 7 / 0 2

A 0 1 M 1 / 2 0

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