

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2016-527208

(P2016-527208A)

(43) 公表日 平成28年9月8日 (2016.9.8)

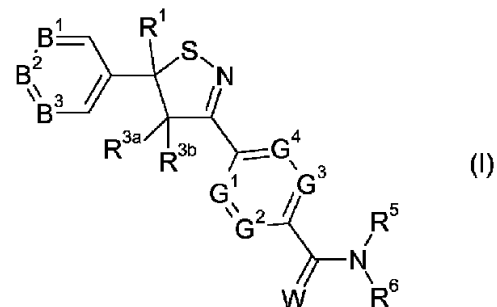
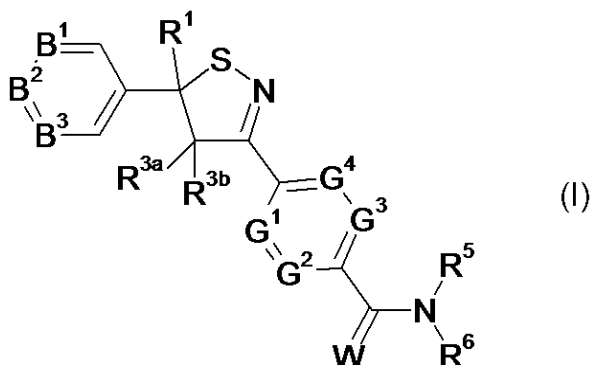
(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C O 7 D 275/02 (2006.01)	C O 7 D 275/02 C S P	4 C O 3 3
C O 7 D 417/10 (2006.01)	C O 7 D 417/10	4 C O 6 3
A 6 1 K 31/427 (2006.01)	A 6 1 K 31/427	4 C O 7 1
A 6 1 K 31/454 (2006.01)	A 6 1 K 31/454	4 C O 8 6
A 6 1 K 31/496 (2006.01)	A 6 1 K 31/496	4 H O 1 1
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 158 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2016-522423 (P2016-522423)	(71) 出願人	515136856 メリアル インコーポレイテッド アメリカ合衆国 ジョージア州 3009 6 ダルース サテライトブルーバード 3239
(86) (22) 出願日	平成26年6月23日 (2014.6.23)	(74) 代理人	100086771 弁理士 西島 孝喜
(85) 翻訳文提出日	平成28年2月24日 (2016.2.24)	(74) 代理人	100088694 弁理士 弟子丸 健
(86) 国際出願番号	PCT/EP2014/063106	(74) 代理人	100094569 弁理士 田中 伸一郎
(87) 国際公開番号	W02014/206911	(74) 代理人	100084663 弁理士 箱田 篤
(87) 国際公開日	平成26年12月31日 (2014.12.31)	(74) 代理人	100093300 弁理士 浅井 賢治
(31) 優先権主張番号	61/838,370	最終頁に続く	
(32) 優先日	平成25年6月24日 (2013.6.24)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		
(31) 優先権主張番号	61/896,137	最終頁に続く	
(32) 優先日	平成25年10月28日 (2013.10.28)		
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

(54) 【発明の名称】 無脊椎有害生物を駆除するためのイソチアゾリン化合物

(57) 【要約】

本発明は、可変基が特許請求の範囲及び記載において定義されている通りである、式 I のイソチアゾリン化合物に関する。この化合物は、無脊椎有害生物、特に節足有害生物及び線虫を駆除又は防除するのに有用である。本発明はまた、これらの化合物を使用することにより無脊椎有害生物を防除する方法、並びに前記化合物を含む植物繁殖材料、並びに前記化合物を含む農業用組成物及び獣医用組成物に関する。

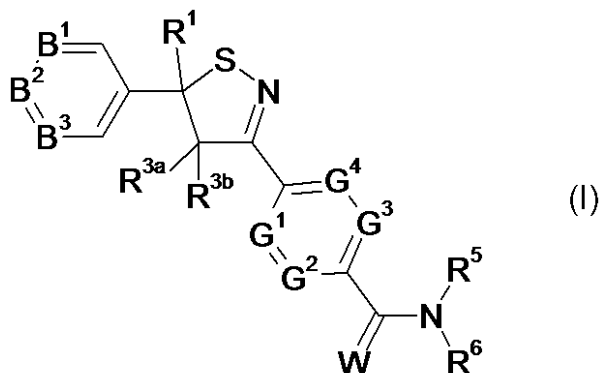


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I のイソチアゾリン化合物

【化 1】



10

[式中、

B¹、B²及びB³は、N及びC R²からなる群からそれぞれ独立して選択されるが、ただし最大でもB¹、B²及びB³の2つがNであり、

G¹、G²、G³及びG⁴は、N及びC R⁴からなる群からそれぞれ独立して選択されるが、ただし最大でも、G¹、G²、G³及びG⁴の2つがNであり、

Wは、O又はSであり、

20

R¹は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₂-C₄-ハロアルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル及び-C(=O)OR¹⁵からなる群から選択され、

R²の各々は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、-SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基R⁸により置換されていてもよい）、

30

-Si(R¹²)₃、-OR⁹、-S(O)_nR⁹、-NR^{10a}R^{10b}、

フェニル（1、2、3、4又は5つの基R¹¹により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9又は10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環からなる群から独立して選択され、この複素単環式環又は複素二環式環は、1つ又は複数の基R¹¹により置換されていてもよく、

R^{3a}、R^{3b}は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、-CO₂R^{3d}、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₂-C₃-アルケニル、C₂-C₃-アルキニル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルチオ、C₁-C₃-ハロアルキルチオ、C₁-C₃-アルキルスルホニル及びC₁-C₃-ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択されるか、又はR^{3a}及びR^{3b}は一緒になって、基=O、=C(R^{3c})₂、=NOH若しくは=NOCH₃を形成し、

40

R^{3c}の各々は、水素、ハロゲン、CH₃及びCF₃からなる群から独立して選択され、

R^{3d}は、水素、C₁-C₆-アルキル及びC₁-C₃-アルキルオキシ-C₁-C₃-アルキル-からなる群から選択され、

R⁴の各々は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、-SF₅、C₁-C₆-アルキル（部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基R⁸により置換されていてもよい）、C₃-C₈-シクロアルキル（部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基R⁸により置換されていてもよい）、C₂-C₆-アルケニル（部分的若しくは完全にハロゲン化されて

50

いてもよく、且つ / 又は 1 つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい)、 $C_2 - C_6$ -アルキニル (部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は 1 つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい)、

- $Si(R^{12})_3$ 、- OR^9 、- $S(O)_n R^9$ 、- $NR^{10a} R^{10b}$ 、

フェニル (1、2、3、4 又は 5 つの基 R^{11} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO_2 から選択される 1、2、3 又は 4 個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9 又は 10 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環からなる群から独立して選択され、この複素単環式環又は複素二環式環は、1 つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよく、

R^5 及び R^6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7、8、9 若しくは 10 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環を形成し、この環は、環員として、O、S、N、NH、SO 及び SO_2 から選択される 1、2、3 若しくは 4 個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基をさらに含有していてもよく、この複素環式環は、1、2、3、4、5、6、7 又は 8 つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、

R^7 の各々は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、- SCN 、- SF_5 、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル (言及した最後の 4 つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は 1 つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい)、

- $Si(R^{12})_3$ 、- OR^9 、- $OSO_2 R^9$ 、- $S(O)_n R^9$ 、- $N(R^{10a}) R^{10b}$ 、- $C(=O)N(R^{10a}) R^{10b}$ 、

- $C(=S)N(R^{10a}) R^{10b}$ 、- $C(=O)OR^9$ 、- $C(=O)R^8$ 、

フェニル (1、2、3、4 又は 5 つの基 R^{11} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO_2 から選択される 1、2、3 若しくは 4 個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9 若しくは 10 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環 (この複素単環式環又は複素二環式環は、1 つ又は複数の置換基 R^{11} により置換されていてもよい) からなる群から独立して選択され、追加的に又は代替的に、3、4、5、6、7、8、9 若しくは 10 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環の同一炭素環原子上に存在している 2 つの基 R^7 は、一緒にあって基 = O 又は = S を形成してもよく、

R^8 の各々は、シアノ、アジド、ニトロ、- SCN 、- SF_5 、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル (言及した最後の 2 つの基中の脂環式部分は、1 つ又は複数の基 R^{13} により置換されていてもよい)、

- $Si(R^{12})_3$ 、- OR^9 、- $OSO_2 R^9$ 、- $S(O)_n R^9$ 、- $N(R^{10a}) R^{10b}$ 、- $C(=O)N(R^{10a}) R^{10b}$ 、- $C(=S)N(R^{10a}) R^{10b}$ 、- $C(=O)OR^9$ 、

フェニル (1、2、3、4 又は 5 つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、及び

環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO_2 から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6 若しくは 7 員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1 つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよく、

或いは

アルキル基、アルケニル基、アルキニル基又はシクロアルキル基の同一炭素原子上に存在している 2 つの R^8 は、一緒にあって、基 = O、= $C(R^{13})_2$ 、= S、= $S(O)_m(R^{15})_2$ 、= $S(O)_m R^{15} N(R^{14a}) R^{14b}$ 、= NR^{10a} 、= NOR^9 若しくは = $NN(R^{10a}) R^{10b}$ を形成するか、

又は

2 つの基 R^8 は、それらが結合しているアルキル基、アルケニル基、アルキニル基若しくはシクロアルキル基の炭素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7 若しくは 8 員の飽和若しくは部分不飽和の炭素環式環若しくは複素環式環を形成し、この複素環式環は、環

10

20

30

40

50

員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含み、この炭素環式環若しくは複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

シクロアルキル環上の置換基としてのR⁸は、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-アルキニル及びC₂-C₆-ハロアルキニルからなる群からさらに選択され、これら6つの基中の脂肪族部分は、1つ又は複数の基R¹³により置換されていてもよく、

基-C(=O)R⁸中のR⁸は、水素、ハロゲン、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、及びC₂-C₆-ハロアルキニルからなる群からさらに選択され、言及した最後の6つの基中の脂肪族部分は、1つ又は複数の基R¹³により置換されていてもよく、

R⁹の各々は、水素、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル(言及した最後の9つの基中の脂肪族及び脂環式部分は、1つ又は複数の基R¹³により置換されていてもよい)、

-C₁-C₆-アルキル-C(=O)OR¹⁵、-C₁-C₆-アルキル-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、

-C₁-C₆-アルキル-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}、-C₁-C₆-アルキル-C(=N(R¹⁴)N(R^{14a}))R^{14b}、

-Si(R¹²)₃、-S(O)_nR¹⁵、-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}、-N(R^{10a})R^{10b}、-N=C(R¹³)₂、-C(=O)R¹³、

-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}、-C(=O)OR¹⁵、フェニル(1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよい)、及び

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

基-S(O)_nR⁹及び-O-SO₂R⁹中のR⁹は、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハロアルコキシからなる群からさらに選択され、

R^{10a}、R^{10b}は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル(言及した最後の8つの基中の脂肪族及び脂環式部分は、1つ又は複数の基R¹³によって置換されていてもよい)、

-C₁-C₆-アルキル-C(=O)OR¹⁵、-C₁-C₆-アルキル-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、-C₁-C₆-アルキル-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、

C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、

-S(O)_nR¹⁵、-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}、-C(=O)R¹³、-C(=O)OR¹⁵、-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、-C(=S)R¹³、-C(=S)SR¹⁵、-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}、-C(=NR¹⁴)R¹³、

フェニル(1、2、3又は4つの置換基R¹⁶により置換されていてもよい)、及び

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環からなる群から互いに独立して選択され、この複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

或いは

R^{10a}及びR^{10b}は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7若しくは8員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環を形成し、この複素環式環は、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは

10

20

30

40

50

2 個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基をさらに含有していてもよく、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、フェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環（この複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} を有していてもよい）から選択される1つ又は複数の置換基を有していてもよい、

又は R^{10a} 及び R^{10b} は一緒になって、基 = $C(R^{13})_2$ 、= $S(O)_m(R^{15})_2$ 、= $S(O)_m R^{15} N(R^{14a}) R^{14b}$ 、= NR^{14} 、若しくは = NOR^{15} を形成し、 R^{11} は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、-SF₅、 $C_1 - C_{10}$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_{10}$ -アルケニル、 $C_2 - C_{10}$ -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、-OR⁹、-NR^{10a}R^{10b}、-S(O)_nR⁹、-Si(R¹²)₃、フェニル（ R^{16} から独立して選択される1、2、3、4又は5つの置換基により置換されていてもよい）、及び

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の芳香族複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、 R^{16} から独立して選択される1つ又は複数の置換基により置換されていてもよく、

又は、不飽和若しくは部分不飽和の複素環式環の同一環炭素原子上に存在している2つの R^{11} が一緒になって、基 = O、= $C(R^{13})_2$ 、= S、= $S(O)_m(R^{15})_2$ 、= $S(O)_m R^{15} N(R^{14a}) R^{14b}$ 、= NR^{14} 、= NOR^{15} 若しくは = $NN(R^{14a}) R^{14b}$ を形成してもよく、

又は、隣接環原子上に結合している2つの R^{11} は、それらが結合している環原子と一緒に、3、4、5、6、7、8若しくは9員の飽和環を形成し、この環は、環員として、O、S、N、NR¹⁴、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基、並びに/又はC=O、C=S及びC=NR¹⁴から選択される1つ若しくは2つの基を含有していてもよく、この環は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、フェニル（1、2、3、4又は5つの基 R^{16} により置換されていてもよい）、

及び、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環（この複素環式環は、1つ又は複数の基 R^{16} により置換されていてもよい）からなる群から選択される1つ又は複数の基により置換されていてもよく、

R^{12} の各々は、水素、ハロゲン、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル、及びフェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい）からなる群から独立して選択され、

10

20

30

40

50

R^{13} の各々は、シアノ、ニトロ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、トリメチルシリル、トリエチルシリル、*tert*-ブチルジメチルシリル、

C_3-C_8 -シクロアルキル（非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は C_1-C_4 -アルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ及びオキソから選択される1つ若しくは2つの基を有していてもよい）、フェニル、ベンジル、フェノキシ（言及した最後の3つの基中のフェニル部分は非置換であるか、又は1、2、3、4若しくは5つの置換基 R^{16} を有していてもよい）、並びに環員として、 N 、 O 、 S 、 NO 、 SO 及び SO_2 から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1、2又は3つの置換基 R^{16} により置換されていてもよく、

又は

アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、又はシクロアルキル基の同一炭素原子上に存在している2つの R^{13} は、一緒になって、 $=O$ 、 $=CH$ （ C_1-C_4 -アルキル）、 $=C$ （ C_1-C_4 -アルキル） C_1-C_4 -アルキル、 $=N$ （ C_1-C_6 -アルキル）若しくは $=NO$ （ C_1-C_6 -アルキル）となってもよく、

シクロアルキル環上の置換基としての R^{13} は、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル及び C_2-C_6 -アルキニルからなる群からさらに選択され、言及した最後の3つの脂肪族基は非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は CN 、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ及びオキソから選択される1つ若しくは2つの置換基を有していてもよく、

基 $=C(R^{13})_2$ 、 $-N=C(R^{13})_2$ 、 $-C(=O)R^{13}$ 、 $-C(=S)R^{13}$ 及び $-C(=NR^{14})R^{13}$ 中の R^{13} は、水素、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル及び C_2-C_6 -アルキニルからなる群からさらに選択され、言及した最後の3つの脂肪族基は非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は CN 、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ及びオキソから選択される1つ若しくは2つの基を有していてもよく、

R^{14} の各々は、水素、シアノ、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_1-C_6 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルフィニル、 C_1-C_6 -アルキルスルホニル、 C_1-C_6 -ハロアルキルスルホニル、トリメチルシリル、トリエチルシリル、*tert*-ブチルジメチルシリル、

C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル（言及した最後の3つの脂肪族基は非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は CN 、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_3-C_4 -シクロアルキル（ハロゲン及びシアノから選択される1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい）、及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい）、

C_3-C_8 -シクロアルキル（非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は C_1-C_4 -アルキル、 C_1-C_4 -アルコキシ、 C_1-C_4 -ハロアルコキシ、 C_1-C_4 -アルキルチオ、 C_1-C_4 -アルキルスルフィニル、 C_1-C_4 -アルキルスルホニル、 C_3-C_4 -シクロアルキル、 C_3-C_4 -シクロアルキル- C_1-C_4 -アルキル（言及した最後の2つの基中のシクロアルキル部分は、ハロゲン及びシアノから選択される1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい）、及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有している）、

フェニル、ベンジル、ピリジル、フェノキシ（言及した最後の4つの基中の環式部分は非置換であつてもよく、又はハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、

10

20

30

40

50

$C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、及び ($C_1 - C_6$ - アルコキシ) カルボニルから選択される 1、2 又は 3 つの置換基を有していてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO_2 から選択される 1 若しくは 2 個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5 若しくは 6 員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1 つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよく、

R^{14a} 及び R^{14b} は、互いに独立して、 R^{14} に関して与えられている意味の 1 つを有するか、又は

R^{14a} 及び R^{14b} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6 若しくは 7 員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環を形成し、この複素環式環はさらに、環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO_2 から選択される 1 個若しくは 2 個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有していてもよく、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及び $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシから選択される 1 つ又は複数の置換基を有していてもよい、

又は

基 - $C(=NR^{14})N(R^{14a})R^{14b}$ 中の、 R^{14a} 及び R^{14b} 若しくは R^{14b} 及び R^{14} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6 若しくは 7 員の部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環を形成し、この複素環式環はさらに、環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO_2 から選択される 1 個若しくは 2 個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有していてもよく、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及び $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシから選択される 1 つ又は複数の置換基を有していてもよく、

R^{15} の各々は、水素、シアノ、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert - ブチルジメチルシリル、

$C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル (言及した最後の 3 つの脂肪族基は非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル及びオキソから選択される 1 つ若しくは 2 つの基を有していてもよい)、

$C_3 - C_8$ - シクロアルキル (非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル及びオキソから選択される 1 つ若しくは 2 つの基を有していてもよい)、

フェニル、ベンジル、ピリジル、及びフェノキシ (言及した最後の 4 つの基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ及び ($C_1 - C_6$ - アルコキシ) カルボニルから選択される 1、2 若しくは 3 つの置換基を有している) からなる群から独立して選択され、

R^{16} の各々は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、-OH、-SH、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert - ブチルジメチルシリル、

$C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル (言及した最後の 3 つの脂肪族基は非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、及びオキソから選択される 1 つ若しくは 2 つの基を有していてもよい)、

$C_3 - C_8$ - シクロアルキル (非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - ア

10

20

30

40

50

ルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、及びオキソから選択される 1 つ又は 2 つの基を有していてもよい)、

フェニル、ベンジル、ピリジル、及びフェノキシ(言及した最後の 4 つの基は非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ及び($C_1 - C_6$ - アルコキシ)カルボニルから選択される 1、2 若しくは 3 つの置換基を有している)からなる群から独立して選択されるか、

或いは

不飽和又は部分不飽和の環の同一原子上に一緒に存在している 2 つの R^{16} は、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N$ ($C_1 - C_6$ - アルキル)、 $=NO$ ($C_1 - C_6$ - アルキル)、 $=CH$ ($C_1 - C_4$ - アルキル)、又は $=C$ ($C_1 - C_4$ - アルキル) $C_1 - C_4$ - アルキルであってもよく、

又は

2 つの隣接炭素原子上の 2 つの R^{16} は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、4、5、6、7 若しくは 8 員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の環を形成し、この環は、環員として、 N 、 O 、 S 、 NO 、 SO 及び SO_2 から選択される 1 個若しくは 2 個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有していてもよく、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及び $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシから選択される 1 つ又は複数の置換基を有していてもよく、

n の各々は、独立して 0、1 又は 2 であり、及び

m の各々は、独立して 0 又は 1 である]

並びに、それらの N - オキシド、立体異性体、及び農業的に又は獣医学的に許容される塩(ただし、 B^1 及び B^3 が $C - Cl$ であり、同時に B^2 が $C - H$ であり、 G^1 、 G^3 及び G^4 が $C - H$ であり、 G^2 が $C - F$ 、 $C - Cl$ 、 $C - CH_3$ 又は $C - SCH_3$ であり、 W が O であり、 R^1 が CF_3 であり、 R^{3a} 及び R^{3b} が H であり、 R^5 及び R^6 が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、アジリジン - 1 - イル、アゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、チアゾリジン - 3 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1 - オキソ - 1, 4 - チアジナン - 4 - イル及び 1, 1 - ジオキソ - 1, 4 - チアジナン - 4 - イルから選択される環を形成する化合物 I を除く)。

【請求項 2】

R^5 及び R^6 がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7、8、9 若しくは 10 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環を形成し、この環がさらに、環員として、 O 、 S 、 N 、 NH 、 SO 及び SO_2 から選択される 1、2、3 若しくは 4 個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素単環式環が、1、2、3、4、5、6、7 又は 8 つの置換基 R^7 により置換されており、複素二環式環が、1、2、3、4、5、6、7 又は 8 つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 が請求項 1 に定義されている通りである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^5 及び R^6 がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5 若しくは 6 員の飽和複素単環式環を形成し、この環がさらに、環員として、 O 、 S 、 SO 、 SO_2 及び NH から選択される 1 個若しくは 2 個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素単環式環が、1、2、3、4、5 又は 6 つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 が請求項 1 に定義されている通りである、請求項 1 又は 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4】

R^5 及び R^6 がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5 若しくは 6 員の飽和複素単環式環を形成し、この環がさらに、環員として、 O 及び NH から選択される 1 個若しくは 2 個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素単環式環が、1、2、3、4、5 又は 6 つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 が請求項 1 に定義されている通りである、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^5 及び R^6 がそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、7、8、9 又は 10 員の飽和複素二環式環を形成し、この環がさらに、環員として、O、S、SO、SO₂ 及び NH から選択される 1 個若しくは 2 個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素二環式環は、1、2、3、4、5 又は 6 つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 が請求項 1 に定義されている通りである、請求項 1 又は 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

R^7 が、ハロゲン、シアノ、オキソ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル（言及した最後の 4 つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ / 又は 1 つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、 $-C(=O)R^8$ 、フェニル（1、2、3、4 又は 5 つの置換基 R^{11} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO₂ から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5 若しくは 6 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環から選択され、複素単環式環は、1 つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよく、 n 、 R^8 、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{11} が、請求項 1 に定義されている通りである、請求項 1 から 5 までのいずれかに記載の化合物。

10

20

【請求項 7】

R^7 が、ハロゲン、シアノ、オキソ、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル（言及した最後の 8 つの置換基は、基 R^8 を有していてもよい）、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、及び $-C(=O)R^8$ から選択され、 R^8 、 R^{10a} 及び R^{10b} が、請求項 1 に定義されている通りである、請求項 6 に記載の化合物。

30

【請求項 8】

脂肪族又は脂環式基上の置換基としての R^8 が、シアノ、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル（CN、メチル及びオキソから選択される 1 つ又は 2 つの置換基により置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、フェニル（1、2、3、4 又は 5 つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO₂ から選択される 1、2 若しくは 3 個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6 若しくは 7 員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環から選択され、複素環式環は、1 つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよく、基 $-C(=O)R^8$ 中の R^8 が、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、CN 基を有する $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル - 、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル - （言及した最後の 4 つの基中のシクロアルキル部分は、CN 基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から選択され、

40

R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} が、請求項 1 に定義されている通りである、請求項 6 及び 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

脂肪族又は脂環式基上の置換基としての R^8 が、シアノ、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル（

50

CN、メチル及びオキソから選択される、1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい)、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、及び $-OR^9$ から選択され、
 基 $-C(=O)R^8$ 中の R^8 が、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル(言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から、特に $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から選択され、
 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} が、請求項1に定義されている通りである、
 請求項8に記載の化合物。

10

【請求項10】

R^7 が、ハロゲン、シアノ、オキソ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル(言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、及び $-C(=O)R^8$ から、特にハロゲン、シアノ、オキソ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、及び $-C(=O)R^8$ から選択され、 R^8 が、請求項1、8及び9のいずれかに定義されている通りであり、 R^{10a} 及び R^{10b} が請求項1に定義されている通りである、請求項7から9までのいずれかに記載の化合物。

20

【請求項11】

R^9 が、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環(複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよい)から、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル及び $C_1 - C_6$ -ハロアルキルから選択され、

30

R^{16} の各々が、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル及び $C_2 - C_4$ -ハロアルキニルからなる群から独立して選択されるか、又は飽和環の同一炭素原子上に存在している2つの R^{16} が、一緒になって、 $=O$ 又は $=S$ を形成してもよく、

40

R^9 が具体的には、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル及び $C_1 - C_6$ -ハロアルキルから選択される、請求項6から9までのいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

R^{10a} 及び R^{10b} が、互いに独立して、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル(言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、

50

C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、- C(=O)R¹³、- C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基R¹⁶により置換されているもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環から選択され、複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されているもよく、R¹³、R^{14a}、R^{14b}及びR¹⁶が、請求項1に定義されている通りである、請求項6から10までのいずれかに記載の化合物。

【請求項13】

R^{10a}が、水素又はメチル、好ましくは水素であり、R^{10b}が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、CN基を有するC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - 、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有しているもよい)、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、- C(=O)R¹³、- C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基R¹⁶により置換されているもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環(複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されているもよい)から、好ましくは、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、CN基を有するC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - 、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - から選択され、言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基、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、- C(=O)R¹³及び- C(=O)N(R^{14a})R^{14b}を有しているもよく、

R¹³が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されているもよい)、CN基により置換されているC₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ及びC₁ - C₄ - ハロアルコキシから選択され、

R^{14a}が、水素及びC₁ - C₆ - アルキルから選択され、

R^{14b}が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されているもよい)、及びCN基により置換されているC₁ - C₆ - アルキルから選択され、

R¹⁶が請求項11に定義されている通りである、

請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

R^{10a}が、水素又はメチル、好ましくは水素であり、R^{10b}が、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、CN基を有するC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - 、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有しているもよい)、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、- C(=O)R¹³、- C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基R¹⁶により置換されているもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、

5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環（複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよい）から、好ましくは、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-から選択され、言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル及び $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルを有していてもよく、

R^{13} が、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）、及びシアノ基により置換されている $C_1 - C_6$ -アルキルから選択され、

R^{14a} が、水素及び $C_1 - C_6$ アルキルから選択され、

R^{14b} が、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）、及びCN基により置換されている $C_1 - C_6$ -アルキルから選択され、

R^{16} が請求項11に定義されている通りである、

請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

R^{10a} が水素又はメチル、好ましくは水素であり、 R^{10b} が、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $-C(=O)R^{13}$ 、及び $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ から選択され、

R^{13} が、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル（言及した最後の2つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択され、

R^{14a} が、水素及び $C_1 - C_6$ アルキルから選択され、

R^{14b} が、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、及び $C_1 - C_6$ -ハロアルキルから選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項16】

WがOである、請求項1から15までのいずれかに記載の化合物。

【請求項17】

B^1 、 B^2 及び B^3 が CR^2 である、請求項1から16までのいずれかに記載の化合物。

【請求項18】

B^1 及び B^3 が CR^2 であり、 R^2 が水素ではなく、 B^2 が CR^2 であり、 R^2 が、請求項1において与えられている意味の1つを有する、請求項17に記載の化合物。

【請求項19】

B^1 が CR^2 であり、 R^2 が水素ではなく、 B^2 及び B^3 が CR^2 であり、 R^2 が、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 及び $-NR^{10a}R^{10b}$ から選択され、

n 、 R^8 、 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} が、請求項1、8、9、及び11から14のいずれかに定義されている通りである、

10

20

30

40

50

請求項 1 から 18 までのいずれかに記載の化合物。

【請求項 20】

R^2 が、水素、ハロゲン及び $C_1 - C_2$ - ハロアルキルから、好ましくは水素、F、Cl、Br 及び CF_3 から選択される、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

B^1 及び B^3 が C - Cl であり、 B^2 が C - F であるか、又は B^1 及び B^3 が C - CF_3 であり、 B^2 が C - H であるか、又は B^1 及び B^3 が C - Br であり、 B^2 が C - F であるか、又は B^1 、 B^2 及び B^3 が C - Cl であるか、又は B^1 が C - Cl であり、 B^2 が C - H であり、 B^3 が C - CF_3 であるか、又は B^1 が C - Br であり、 B^2 が C - H であり、 B^3 が C - CF_3 であり、好ましくは、 B^1 及び B^3 が C - Cl であり、 B^2 が C - F である、請求項 18 から 20 までのいずれかに記載の化合物。

10

【請求項 22】

G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 が CR^4 であるか、又は G^1 、 G^3 及び G^4 が CR^4 であり、 G^2 が N であるか、又は G^2 、 G^3 及び G^4 が CR^4 であり、 G^1 が N であり、 R^4 が請求項 1 に与えられている意味の 1 つを有する、請求項 1 から 21 までのいずれかに記載の化合物。

【請求項 23】

G^1 、 G^3 及び G^4 が CH であり、 G^2 が CR^4 であり、 R^4 が請求項 1 において与えられている意味の 1 つを有する、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

R^4 が、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_5$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_5$ - ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ及び $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオから、好ましくは水素、ハロゲン及びメチルから選択される、請求項 1 から 23 までのいずれかに記載の化合物。

20

【請求項 25】

R^1 が、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル及び - C(=O)OR¹⁵ から選択され、 R^{15} が $C_1 - C_4$ - アルキルであり、 R^1 が好ましくは CF_3 である、請求項 1 から 24 までのいずれかに記載の化合物。

【請求項 26】

R^{3a} 及び R^{3b} が、互いに独立して、水素及びハロゲン、好ましくは水素及びフッ素から選択され、特に水素である、請求項 1 から 25 までのいずれかに記載の化合物。

30

【請求項 27】

請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の農業的に許容されるその塩と、少なくとも 1 種の農業的に許容される不活性な液状担体及び / 又は固体担体とを含む農業用組成物。

【請求項 28】

請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の獣医学的に許容されるその塩と、少なくとも 1 種の獣医学的に許容される不活性な液状担体及び / 又は固体担体とを含む獣医用組成物。

40

【請求項 29】

無脊椎有害生物を駆除するための、請求項 1 から 26 のいずれかに記載の化合物、その立体異性体及び / 又はその農業的に若しくは獣医学的に許容される塩の使用。

【請求項 30】

無脊椎有害生物に侵襲され若しくは感染している動物を処置し、又は無脊椎有害生物による侵襲若しくは感染から動物を保護するため、特に、無脊椎有害生物に侵襲され若しくは感染している動物を処置し、又は無脊椎有害生物による侵襲若しくは感染から動物を保護する医薬を製造するための、請求項 1 から 26 までのいずれかに記載の化合物、その立体異性体、及び / 又は獣医学的に許容される塩の使用。

【請求項 31】

50

無脊椎有害生物を防除する方法であって、有害生物、その餌供給源、その生息地若しくはその繁殖地、又は有害生物が成長中であるか若しくは成長し得る植物、植物繁殖材料、土壌、区域、資材若しくは環境、又は無脊椎有害生物の攻撃若しくは侵襲から保護すべき資材、植物、植物繁殖材料、土壌、表面若しくは空間を、請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I のイミン化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の農業的に許容されるその塩の殺有害生物有効量で処理するステップを含む方法。

【請求項 32】

請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の農業的に許容されるその塩の殺有害生物有効量で植物を処理するステップを含む、無脊椎有害生物による攻撃又は侵襲から植物を保護するための、請求項 31 に記載の方法。

10

【請求項 33】

請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の農業的に許容されるその塩の殺有害生物有効量で植物繁殖材料を処理するステップを含む、無脊椎有害生物による攻撃又は侵襲から、植物繁殖材料及び / 又はそれから生長する植物を保護するための、請求項 32 に記載の方法。

【請求項 34】

請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の農業的に許容されるその塩を含む植物繁殖材料。

【請求項 35】

無脊椎有害生物に侵襲され若しくは感染している動物を処置し、又は無脊椎有害生物による侵襲若しくは感染から動物を保護するための方法であって、請求項 1 から 26 のいずれかに記載の少なくとも 1 種の式 I の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 種の獣医学的に許容されるその塩の殺有害生物有効量と動物を接触させるステップを含む方法。

20

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、無脊椎有害生物、特に節足有害生物及び線虫を駆除又は防除するのに有用なイソチアゾリン化合物に関する。本発明はまた、これらの化合物を使用することにより無脊椎有害生物を防除する方法、並びに前記化合物を含む植物繁殖材料、並びに前記化合物を含む農業用組成物及び獣医用組成物に関する。

30

【背景技術】

【0002】

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

関連する殺虫性アリアルイソチアゾリン化合物が、WO2013/037626 に記載されている。しかし、この文献は、本発明において特許請求されている特有の置換基及び置換基の配置を有する化合物を記載していない。関連する殺虫性アリアルイソチアゾリン化合物がさらに、WO2011/092287、WO2011/073444、WO2010/090344、WO2009/112275 及び WO97/23212 に記載されている。これらの文献も、本発明において特許請求されている特有の置換基及び置換基の配置を有する化合物を記載していない。

40

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

本発明の目的は、良好な殺有害生物(pesticidal)活性、特に殺虫(insecticidal)活性を

50

有し、且つ多くの様々な無脊椎有害生物、とりわけ、防除が困難な節足有害生物及び／又は線虫に対する広い活性スペクトルを示す化合物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

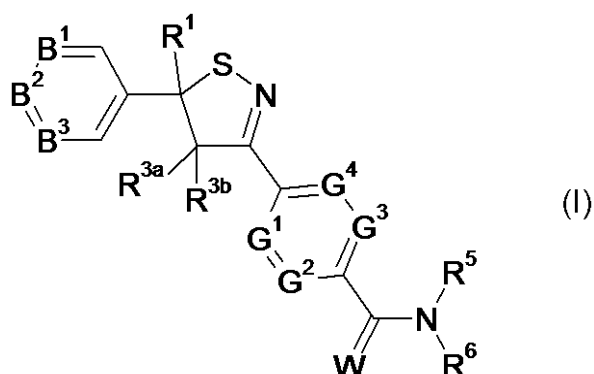
【0004】

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

【0005】

したがって、第 1 の態様では、本発明は、式 I のイソチアゾリン化合物であって、

【化 1】



10

20

[式中、

B¹、B²及びB³は、N及びC R²からなる群からそれぞれ独立して選択されるが、ただし最大でもB¹、B²及びB³の2つがNであり、

G¹、G²、G³及びG⁴は、N及びC R⁴からなる群からそれぞれ独立して選択されるが、ただし最大でも、G¹、G²、G³及びG⁴の2つがNであり、

Wは、O又はSであり、

R¹は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₁-C₄-ハロアルコキシ-C₁-C₄-アルキル-、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₂-C₄-ハロアルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル及び-C(=O)OR¹⁵からなる群から選択され、

30

【0006】

R²の各々は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、-SF₅、C₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は1つ若しくは複数の基R⁸により置換されていてもよい）、

-Si(R¹²)₃、-OR⁹、-S(O)_nR⁹、-NR^{10a}R^{10b}、

フェニル（1、2、3、4又は5つの基R¹¹により置換されていてもよい）、及び環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環からなる群から独立して選択され、この複素単環式環又は複素二環式環は、1つ又は複数の基R¹¹により置換されていてもよく、

40

【0007】

R^{3a}、R^{3b}は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、-CO₂R^{3d}、C₁-C₃-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₂-C₃-アルケニル、C₂-C₃-アルキニル、C₁-C₃-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₃-アルキルチオ、C₁-C₃-ハロアルキルチオ、C₁-C₃-アルキルスルホニル及びC₁-C₃-ハロアルキルスルホニルからなる群からそれぞれ独立して選択されるか、又は

R^{3a}及びR^{3b}は一緒になって、基=O、=C(R^{3c})₂、=NOH若しくは=NOCH₃を

50

形成し、

R^{3c} の各々は、水素、ハロゲン、 CH_3 及び CF_3 からなる群から独立して選択され、

R^{3d} は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル及び $C_1 - C_3$ -アルキルオキシ- $C_1 - C_3$ -アルキル-からなる群から選択され、

【0008】

R^4 の各々は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $C_1 - C_6$ -アルキル（部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル（部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルキニル（部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、

$-Si(R^{12})_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-NR^{10a}R^{10b}$ 、

フェニル（1、2、3、4又は5つの基 R^{11} により置換されていてもよい）、及び環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環からなる群から独立して選択され、この複素単環式環又は複素二環式環は、1つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよく、

【0009】

R^5 及び R^6 は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環〔この環は、当然ながら、この窒素原子を介して基 $C(=W)$ に結合している〕を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、N、NH、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素環式環は、1、2、3、4、5、6、7又は8つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、

R^7 の各々は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、

$-Si(R^{12})_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-OSO_2R^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、

$-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、 $-C(=O)R^8$ 、フェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{11} により置換されていてもよい）、及び

環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環（複素単環式環又は複素二環式環は、1つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよい）からなる群から独立して選択され、追加的に又は代替的に、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環の同一炭素原子上に存在している2つの基 R^7 は、一緒になって基 $=O$ （これは、オキソ置換基とも呼ばれる）又は $=S$ を形成していてもよく、

【0010】

R^8 の各々は、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル（言及した最後の2つの基中の脂環式部分は、1つ又は複数の基 R^{13} により置換されていてもよい）、

$-Si(R^{12})_3$ 、 $-OR^9$ 、 $-OSO_2R^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、

10

20

30

40

50

- C(=S)N(R^{10a})R^{10b}、- C(=O)OR⁹、
 フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基R¹⁶により置換されていてもよい)、及び
 環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘ
 テロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和
 又は最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1つ
 又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

又は

【0011】

アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基の同一炭素原子上に存在してい
 る2つのR⁸が一緒になって、基=O、=C(R¹³)₂、=S、=S(O)_m(R¹⁵)₂、=
 S(O)_mR¹⁵N(R^{14a})R^{14b}、=NR^{10a}、=NOR⁹若しくは=NN(R^{10a})R^{10b}
 を形成するか、

10

又は

【0012】

2つの基R⁸は、それらが結合しているアルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロア
 ルキル基の炭素原子と一緒に、3、4、5、6、7若しくは8員の飽和若しくは部
 分不飽和の炭素環式環又は複素環式環を形成し、この複素環式環は、環員として、N、O
 、S、NO、SO及びSO₂から独立して選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原
 子若しくはヘテロ原子基を含み、これらの炭素環式環又は複素環式環は、1つ又は複数の
 置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

20

シクロアルキル環上の置換基としてのR⁸は、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-アルキニル及びC
₂-C₆-ハロアルキニルからなる群からさらに選択され、これらの6つの基中の脂肪族部
 分は、1つ又は複数の基R¹³により置換されていてもよく、

基-C(=O)R⁸中のR⁸は、水素、ハロゲン、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-アルキニル及び
 C₂-C₆-ハロアルキニルからなる群からさらに選択され、言及した最後の6つの基中の
 脂肪族部分は、1つ又は複数の基R¹³により置換されていてもよく、

【0013】

R⁹の各々は、水素、シアノ、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈
 -シクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-、C₃-C₈-ハロ
 シクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキ
 ニル、C₂-C₆-ハロアルキニル(言及した最後の9つの基中の脂肪族及び脂環式部分は
 、1つ又は複数の基R¹³により置換されていてもよい)、-C₁-C₆-アルキル-C(=O)
 OR¹⁵、-C₁-C₆-アルキル-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、-C₁-C₆-アルキ
 ル-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}、-C₁-C₆-アルキル-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})
 R^{14b}、-Si(R¹²)₃、-S(O)_nR¹⁵、-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}、-N(R^{10a})
 R^{10b}、-N=C(R¹³)₂、-C(=O)R¹³、-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、-
 C(=S)N(R^{14a})R^{14b}、-C(=O)OR¹⁵、フェニル(1つ又は複数の置換基R¹⁶
 により置換されていてもよい)、及び

30

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘ
 テロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和
 又は最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1つ
 又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

40

基-S(O)_nR⁹及び-O-SO₂R⁹中のR⁹は、C₁-C₆-アルコキシ及びC₁-C₆-ハ
 ロアルコキシからなる群からさらに選択され、

【0014】

R^{10a}、R^{10b}は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₃-C₈-シク
 ロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロア
 ルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル(言及した最後の8つの基

50

中の脂肪族及び脂環式部分は、1つ又は複数の基 R^{13} により置換されていてもよい)、
 $-C_1-C_6$ -アルキル- $C(=O)OR^{15}$ 、 $-C_1-C_6$ -アルキル- $C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、 $-C_1-C_6$ -アルキル- $C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$ 、 $-C_1-C_6$ -アルキル- $C(=NR^{14})N(R^{14a})R^{14b}$ 、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 $-S(O)_nR^{15}$ 、 $-S(O)_nN(R^{14a})R^{14b}$ 、 $-C(=O)R^{13}$ 、 $-C(=O)OR^{15}$ 、 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、 $-C(=S)R^{13}$ 、 $-C(=S)SR^{15}$ 、 $-C(=S)N(R^{14a})R^{14b}$ 、 $-C(=NR^{14})R^{13}$ ；フェニル(1、2、3又は4つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、及び

環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環からなる群から互いに独立して選択され、この複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよく、

又は

【0015】

R^{10a} 及び R^{10b} は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7若しくは8員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環を形成し、この複素環式環は、環員としてN、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含有していてもよく、この複素環式環は、ハロゲン、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、 C_1-C_6 -アルコキシ、 C_1-C_6 -ハロアルコキシ、 C_1-C_6 -アルキルチオ、 C_1-C_6 -ハロアルキルチオ、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_3-C_8 -ハロシクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -ハロアルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_2-C_6 -ハロアルキニル、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、及び環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} を有していてもよい)から選択される1つ又は複数の置換基を有していてもよく、

又は、 R^{10a} 及び R^{10b} は一緒にあって、基 = $C(R^{13})_2$ 、= $S(O)_m(R^{15})_2$ 、= $S(O)_mR^{15}N(R^{14a})R^{14b}$ 、= NR^{14} 若しくは= NOR^{15} を形成し、

【0016】

R^{11} は、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 C_1-C_{10} -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_2-C_{10} -アルケニル、 C_2-C_{10} -アルキニル(言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい)、

$-OR^9$ 、 $-NR^{10a}R^{10b}$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-Si(R^{12})_3$ 、

フェニル(R^{16} から独立して選択される、1、2、3、4又は5つの置換基により置換されていてもよい)、及び

環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の芳香族複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、 R^{16} から独立して選択される1つ又は複数の置換基により置換されていてもよく、又は、

不飽和若しくは部分不飽和の複素環式環の同一環炭素原子上に存在している2つの R^{11} が一緒にあって、基 = O、= $C(R^{13})_2$ 、= S、= $S(O)_m(R^{15})_2$ 、= $S(O)_mR^{15}N(R^{14a})R^{14b}$ 、= NR^{14} 、= NOR^{15} 若しくは= $NN(R^{14a})R^{14b}$ を形成していてもよく、

【0017】

又は、

隣接する環原子に結合している2つの R^{11} は、それらが結合している環原子と一緒になっ

10

20

30

40

50

て、3、4、5、6、7、8又は9員の飽和環を形成し、この環は、環員として、O、S、N、NR¹⁴、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子基、及び/或いはC=O、C=S及びC=NR¹⁴から選択される1つ又は2つの基を含有していてもよく、且つこの環は、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、フェニル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁶により置換されていてよい)、及び環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の基R¹⁶により置換されていてよい)からなる群から選択される1つ又は複数の基により置換されていてよく、

10

【0018】

R¹²の各々は、水素、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、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-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ-C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ-C₁-C₆-アルキル、及びフェニル(1、2、3、4又は5つの置換基R¹⁶により置換されていてよい)からなる群から独立して選択され、

20

R¹³の各々は、シアノ、ニトロ、-OH、-SH、-SCN、-SF₅、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert-ブチルジメチルシリル、C₃-C₈-シクロアルキル(非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてよく、且つ/又はC₁-C₄-アルキル、C₃-C₄-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい)、フェニル、ベンジル、フェノキシ(言及した最後の3つの基中のフェニル部分は、非置換であるか、又は1、2、3、4若しくは5つの置換基R¹⁶を有していてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1、2又は3つの置換基R¹⁶により置換されていてよく、

30

又は

【0019】

アルキル、アルケニル、アルキニル又はシクロアルキル基の同一炭素原子上に存在している2つのR¹³は一緒になって、=O、=CH(C₁-C₄-アルキル)、=C(C₁-C₄-アルキル)C₁-C₄-アルキル、=N(C₁-C₆-アルキル)若しくは=NO(C₁-C₆-アルキル)であってもよく、

40

シクロアルキル環上の置換基としてのR¹³は、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル及びC₂-C₆-アルキニルからなる群からさらに選択され、言及した最後の3つの脂肪族基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてよく、且つ/又はCN、C₃-C₄-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ及びオキソから選択される、1つ又は2つの置換基を有していてもよく、

基=C(R¹³)₂、-N=C(R¹³)₂、-C(=O)R¹³、-C(=S)R¹³及び-C(=NR¹⁴)R¹³におけるR¹³は、水素、ハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル及びC₂-C₆-アルキニルからなる群からさらに選択され、言及した最後の3つの脂肪族基は、非置換であるか部分的若しくは完全にハロゲン化されていてよく、且つ/又はCN、C₃-C₄-シクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキ

50

シ及びオキソから選択される、1つ又は2つの基を有していてもよく、

【0020】

R¹⁴の各々は、水素、シアノ、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₁-C₆-アルキルチオ、C₁-C₆-ハロアルキルチオ、C₁-C₆-アルキルスルフィニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₆-アルキルスルホニル、C₁-C₆-ハロアルキルスルホニル、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert-ブチルジメチルシリル、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル（言及した最後の3つの脂肪族基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又はCN、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₃-C₄-シクロアルキル（ハロゲン及びシアノから選択される1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい）、及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい）、

10

【0021】

C₃-C₈-シクロアルキル（非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又はC₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₃-C₄-シクロアルキル、C₃-C₄-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル（言及した最後の2つの基中のシクロアルキル部分は、ハロゲン及びシアノから選択される1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい）、及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい）、

20

フェニル、ベンジル、ピリジル、フェノキシ（言及した最後の4つの基中の環式部分は、非置換であってもよく、又はハロゲン、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルコキシ、及び（C₁-C₆-アルコキシ）カルボニルから選択される1、2若しくは3つの置換基を有している）、並びに環員としてN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1若しくは2個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5若しくは6員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環からなる群から独立して選択され、この複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

R^{14a}及びR^{14b}は、互いに独立して、R¹⁴に関して与えられている意味の1つを有しているか、

30

又は、

【0022】

R^{14a}及びR^{14b}は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環を形成し、この複素環式環は、環員としてN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含有していてもよく、この複素環式環は、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシから選択される1つ又は複数の置換基を有していてもよく、

40

又は

基-C(=NR¹⁴)N(R^{14a})R^{14b}中の、R^{14a}及びR¹⁴若しくはR^{14b}及びR¹⁴は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6若しくは7員の部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環を形成し、この複素環式環は、環員としてN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子基をさらに含有していてもよく、この複素環式環は、ハロゲン、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシから選択される1つ又は複数の置換基を有していてもよく、

【0023】

R¹⁵の各々は、水素、シアノ、トリメチルシリル、トリエチルシリル、tert-ブチルジメチルシリル、

50

$C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル（言及した最後の3つの脂肪族基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル及びオキソから選択される、1つ又は2つの基を有していてもよい）、

$C_3 - C_8$ - シクロアルキル（非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい）、

フェニル、ベンジル、ピリジル及びフェノキシ（言及した最後の4つの基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ及び（ $C_1 - C_6$ - アルコキシ）カルボニルから選択される1、2若しくは3つの置換基を有している）からなる群から独立して選択され、

【0024】

R^{16} の各々は、ハロゲン、ニトロ、シアノ、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル、トリメチルシリル、トリエチルシリル、*tert*-ブチルジメチルシリル； $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル（言及した最後の3つの脂肪族基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい）、

$C_3 - C_8$ - シクロアルキル（非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ、 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ及びオキソから選択される1つ又は2つの基を有していてもよい）、

【0025】

フェニル、ベンジル、ピリジル及びフェノキシ（言及した最後の4つの基は、非置換であるか、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ／又は $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ及び（ $C_1 - C_6$ - アルコキシ）カルボニルから選択される1、2若しくは3つの置換基を有している）からなる群から独立して選択されるか、

又は

不飽和又は部分不飽和環の同一原子上に一緒に存在している2つの R^{16} は、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N$ （ $C_1 - C_6$ - アルキル）、 $=NO$ （ $C_1 - C_6$ - アルキル）、 $=CH$ （ $C_1 - C_4$ - アルキル）若しくは $=C$ （ $C_1 - C_4$ - アルキル） $C_1 - C_4$ - アルキルであってもよく、

又は

【0026】

2つの隣接炭素原子上の2つの R^{16} は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、4、5、6、7若しくは8員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の環を形成し、この環は、環員としてN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有していてもよく、この環は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及び $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシから選択される1つ又は複数の置換基を有していてもよく、

n の各々は、独立して0、1又は2であり、及び

m の各々は、独立して0又は1である」、

B^1 及び B^3 がC - C1であり、同時に B^2 がC - Hであり、 G^1 、 G^3 及び G^4 がC - Hであ

10

20

30

40

50

り、 G^2 がC - F、C - Cl、C - CH₃又はC - SCH₃であり、WがOであり、 R^1 がF₃であり、 R^{3a} 及び R^{3b} がHであり、 R^5 及び R^6 が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、アジリジン - 1 - イル、アゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、チアゾリジン - 3 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1 - オキソ - 1, 4 - チアジナン - 4 - イル及び1, 1 - ジオキソ - 1, 4 - チアジナン - 4 - イルから選択される環を形成する化合物1を除外する、イソチアゾリン化合物、並びに、それらのN - オキシド、立体異性体、及び農業的に又は獣医学的に許容される塩に関する。

【0027】

本発明はまた、本明細書で定義されている少なくとも1種の式Iの化合物及び/又は農業的に許容されるその塩と、少なくとも1種の農業的に許容される液状担体及び/又は固体担体とを含む農業用組成物を提供する。

本発明はまた、本明細書で定義されている少なくとも1種の式Iの化合物及び/又は獣医学的に許容されるその塩と、少なくとも1種の獣医学的に許容される液状担体及び/又は固体担体とを含む獣医用組成物を提供する。

本発明はまた、無脊椎有害生物を防除する方法であって、有害生物、その餌供給源、その生息地若しくはその繁殖地、又は有害生物が成長中であるか若しくは成長し得る栽培植物、植物繁殖材料(種子など)、土壌、区域、資材若しくは環境、又は無脊椎有害生物の攻撃若しくは侵襲から保護すべき資材、栽培植物、植物繁殖材料(種子など)、土壌、表面若しくは空間を、本明細書で定義されている式Iの化合物又はその塩の殺有害生物有効量で処理するステップを含む方法を提供する。

本発明はまた、本明細書で定義されている少なくとも1種の式Iの化合物及び/又は農業的に許容されるその塩を含む植物繁殖材料、特に種子に関する。

本発明はさらに、寄生生物に侵襲され若しくは感染している動物を処置し、又は寄生生物による侵襲若しくは感染から動物を保護する方法であって、本明細書で定義されている式Iの化合物又は獣医学的に許容されるその塩の殺寄生生物有効量と動物を接触させるステップを含む方法に関する。「動物を本発明の化合物I、その塩又は獣医用組成物と接触させる」とは、それを動物に施用又は投与することを意味する。

【発明を実施するための形態】

【0028】

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

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

【0029】

用語N - オキシドは、少なくとも1つの窒素原子が酸化形態(NOとして)で存在している、化合物Iの形態に関する。より正確には、N - オキシドは、N - オキシド部分に酸化されている少なくとも1個の第三級窒素原子を有する、本発明の任意の化合物に関する。化合物IのN - オキシドは、特に、例えばイソチアゾリン部分の環窒素原子、及び/又は G^1 、 G^2 、 G^3 若しくは G^4 がNである場合、この窒素原子、及び/又は R^5 と R^6 とにより形成される環の窒素原子を、ペルオキシカルボン酸又は他の過酸化物などの適切な酸化剤により酸化することにより調製することができる。当業者は、本発明の化合物がN - オキシドを形成し得るか、及びどの位置にN - オキシドを形成し得るかを認識している。

【0030】

本発明の化合物は非晶質であってもよく、又は1つ又は複数の異なる結晶状態（多形体）で存在していてもよく、この結晶状態は、異なる巨視的特性（安定性など）を有するか、又は異なる生物的特性（活性など）を示すことがある。本発明には、式Iの非結晶性化合物と結晶性化合物の両方、結晶状態が異なるそれぞれの化合物Iの混合物、及びその非結晶性又は結晶性の塩が含まれる。

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

10

【0031】

適切な農業的に許容される塩は、とりわけ、これらの陽イオンの塩又はそれらの酸の酸付加塩であり、その陽イオン及び陰イオンは、それぞれ、本発明による化合物の作用に対していかなる悪影響も及ぼすものではない。適切な陽イオンは特に、アルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウムのイオン、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウム及びバリウムのイオン、並びに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン、並びにアンモニウム（ NH_4^{+} ）及び置換アンモニウム（1～4個の水素原子が C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ヒドロキシアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヒドロキシ- C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル又はベンジルにより置きかえられている）である。置換アンモニウムイオンの例には、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム、ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-（2-ヒドロキシエトキシ）エチルアンモニウム、ビス（2-ヒドロキシエチル）アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム、及びベンジルトリエチルアンモニウム、さらにはホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ（ C_1 - C_4 -アルキル）スルホニウム、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ（ C_1 - C_4 -アルキル）スルホキソニウムが含まれる。

20

【0032】

有用な酸付加塩の陰イオンは、主として塩化物イオン、臭化物イオン、フッ化物イオン、硫酸水素イオン、硫酸イオン、リン酸二水素イオン、リン酸水素イオン、リン酸イオン、硝酸イオン、炭酸水素イオン、炭酸イオン、ヘキサフルオロケイ酸イオン、ヘキサフルオロリン酸イオン、安息香酸イオン、並びに C_1 - C_4 -アルカン酸の陰イオン、好ましくはギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオン及び酪酸イオンである。それらは、式Iの化合物を、対応する陰イオンの酸、好ましくは塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸又は硝酸と反応させることによって形成することができる。

30

「獣医学的に許容される塩」という用語は、獣医学的に使用するための塩の形成に関して当分野で公知であり且つ許容されている陽イオン又は陰イオンの塩を意味する。例えば、塩基性窒素原子（例えばアミノ基）を含有する式Iの化合物によって形成される適切な酸付加塩には、無機酸との塩、例えば、塩酸塩（hydrochlorids）、硫酸塩、リン酸塩及び硝酸塩、並びに有機酸の塩、例えば、酢酸、マレイン酸、二マレイン酸、フマル酸、二フマル酸、メタンスルフェン酸、メタンスルホン酸及びコハク酸の塩が含まれる。

40

【0033】

本明細書で使用する「無脊椎有害生物」という用語は、植物を攻撃し、これにより攻撃を受けた植物に実質的な被害をもたらす得る昆虫、クモ形類及び線虫などの動物集団、並びに動物、特に、例えば哺乳動物若しくは鳥類などの温血動物又は爬虫類、両生類若しくは魚類などの他の高等動物を侵襲し、これにより侵襲された動物に実質的な被害をもたらす得る外部寄生生物を包含する。

【0034】

50

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

「植物」という用語は、「非栽培植物」を含む任意の種類の植物、特に「栽培植物」を含む。

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

【0035】

用語「栽培植物」は、育種、突然変異誘発又は遺伝子工学によって修飾された植物を含むものとして理解されたい（上市されているか又は開発中の生物工学的農産物を含むが、これに限定されない）（http://www.bio.org/speeches/pubs/er/agri_products.aspを参照されたい）。遺伝子組換え植物は、自然環境下においては交雑育種、突然変異又は自然組換えによっては容易に得ることができない組換えDNA技術の使用により、遺伝物質が上記のように修飾されている植物である。通常、植物のある種の特性を改善するため、1つ又は複数の遺伝子が、遺伝子組換え植物の遺伝物質に組み込まれている。こうした遺伝的修飾には、以下に限定されないが、例えばグリコシル化による、又はプレニル化、アセチル化若しくはファルネシル化部位若しくはPEG部位などのポリマー付加による、タンパク質、オリゴペプチド又はポリペプチドの標的化翻訳後修飾も含まれる。

【0036】

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

10

20

30

40

50

国)、Cultivance(登録商標)(イミダゾリノン耐性、BASF SE、ドイツ)、及びLibertyLink(登録商標)(グルホシネート耐性、Bayer Crop Science、ドイツ)という商標下で市販されている。

【0037】

さらに、組換えDNA技術を使用することにより、1種又は複数の殺虫性タンパク質、とりわけ、バチルス(*Bacillus*)属細菌(特に、バチルス・チューリングエンシス(*Bacillus thuringiensis*))由来として知られているもの(-エンドトキシン、例えばCryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)又はCry9cなど)、植物性の殺虫性タンパク質(VIP)(例えばVIP1、VIP2、VIP3又はVIP3A)、線虫にコロニーを形成する細菌の殺虫性タンパク質(例えばフォトラブドゥス属の種(*Photorhabdus* spp.)又はゼノラブドゥス属の種(*Xenorhabdus* spp.))、動物によって産生される毒素(サソリ毒、クモ毒、ハチ毒、又は他の昆虫特異的神経毒など)、菌類によって産生される毒素(こうしたストレプトマイセス(*Streptomyces*)毒、植物レクチン(エンドウレクチン又はオオムギレクチンなど)、アグルチニン、プロテイナーゼ阻害剤(トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン又はババイン阻害剤など)、リボソーム不活化タンパク質(RIP)(リシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフイン、サボリン又はプリオジンなど)、ステロイド代謝酵素(3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-IDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤又はHMG-CoA-レダクターゼなど)、イオンチャネル遮断剤(ナトリウムチャネル又はカルシウムチャネル遮断剤など)、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿ホルモン受容体(ヘリコキニン受容体)、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ又はグルカナーゼを合成することができる植物も含まれる。本発明の文脈において、これらの殺虫性タンパク質又は毒素は、プレトキシン、ハイブリッドタンパク質、切断されているか又はそうでなければ修飾されているタンパク質としても明確に理解されるべきである。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新しい組合せによって特徴付けられるものである(例えば、WO02/015701を参照されたい)。こうした毒素、又はこうした毒素を合成することができる遺伝子組換え植物のさらなる例は、例えば、欧州特許出願公開第374753号、WO93/007278、WO95/34656、欧州特許出願公開第427529号、欧州特許出願公開第451878号、WO03/18810及びWO03/52073に開示されている。こうした遺伝子組換え植物を生成する方法は、一般に当業者に公知であり、例えば上記の刊行物に記載されている。

【0038】

遺伝子組換え植物に含有されるこれらの殺虫性タンパク質は、これらのタンパク質を産生する植物に、節足動物のすべての分類学的グループに由来する有害な有害生物、とりわけ甲虫(甲虫目(*Coeloptera*))、双翅目昆虫(双翅目(*Diptera*))、及び蛾(鱗翅目(*Lepidoptera*))、並びに線虫(線形動物門(*Nematoda*))に対する耐性を付与する。1種又は複数の殺虫性タンパク質を合成することができる遺伝子組換え植物は、例えば上記の刊行物に記載されており、それらの一部は、YieldGard(登録商標)(Cry1Ab毒素を産生するトウモロコシ品種)、YieldGard(登録商標)Plus(Cry1Ab及びCry3Bb1毒素を産生するトウモロコシ品種)、Starlink(登録商標)(Cry9c毒素を産生するトウモロコシ品種)、Herculex(登録商標)RW(Cry34Ab1、Cry35Ab1及び酵素ホスフィノトリシン-N-アセチルトランスフェラーゼ[PAT]を産生するトウモロコシ品種)、NuCOTN(登録商標)33B(Cry1Ac毒素を産生するワタ品種)、Bollgard(登録商標)I(Cry1Ac毒素を産生するワタ品種)、Bollgard(登録商標)II(Cry1Ac及びCry2Ab2毒素を産生するワタ品種)、VIPCOT(登録商標)(VIP毒素を産生するワタ品種)、New Lea

f (登録商標) (Cry 3 A 毒素を産生するジャガイモ品種) ; Bt - Xtra (登録商標)、Nature Gard (登録商標)、Knock Out (登録商標)、Bite Gard (登録商標)、Protecta (登録商標)、Syngenta Seeds SAS、フランスからのBt 11 (例えば、AgriSure (登録商標) CB) 及びBt 176 (Cry 1 Ab 毒素及びPAT 酵素を産生するトウモロコシ品種)、Syngenta Seeds SAS、フランスからのMIR 604 (Cry 3 A 毒素の改変型を産生するトウモロコシ品種、WO 03 / 018810 を参照されたい)、Monsanto Europe S.A.、ベルギーからのMON 863 (Cry 3 Bb 1 毒素を産生するトウモロコシ品種)、Monsanto Europe S.A.、ベルギーからのIPC 531 (Cry 1 Ac 毒素の改変型を産生するワタ品種)、並びにPioneer Overseas Corporation、ベルギーからの1507 (Cry 1 F 毒素及びPAT 酵素を産生するトウモロコシ品種) などが市販されている。

10

20

30

40

50

【0039】

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

【0040】

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

【0041】

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

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

【0042】

可変基(variable)の上の定義において言及されている有機部分は、用語「ハロゲン」と同様に、個々の基のメンバーの個別のリストの総称用語である。接頭語 $C_n - C_m$ は、各場合において、その基中の可能な炭素原子数を示す。

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

アルコキシ、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルカルボニル、アルコシカルボニルなどのアルキル部分における、本明細書で使用する用語「アルキル」とは、1~2個(「 $C_1 - C_2$ -アルキル」)、1~3個(「 $C_1 - C_3$ -アルキル」)、1~4個(「 $C_1 - C_4$ -アルキル」)、1~6個(「 $C_1 - C_6$ -アルキル」)

、1～8個（「 $C_1 - C_8$ - アルキル」）、又は1～10個（「 $C_1 - C_{10}$ - アルキル」）の炭素原子を有する、直鎖又は分岐の飽和炭化水素基を指す。 $C_1 - C_2$ - アルキルは、メチル又はエチルである。 $C_1 - C_3$ - アルキルはさらに、プロピル及びイソプロピルである。 $C_1 - C_4$ - アルキルはさらに、ブチル、1 - メチルプロピル（sec - ブチル）、2 - メチルプロピル（イソブチル）、又は1, 1 - ジメチルエチル（tert - ブチル）である。 $C_1 - C_6$ - アルキルはさらに、例えば、ペンチル、1 - メチルブチル、2 - メチルブチル、3 - メチルブチル、2, 2 - ジメチルプロピル、1 - エチルプロピル、1, 1 - ジメチルプロピル、1, 2 - ジメチルプロピル、ヘキシル、1 - メチルペンチル、2 - メチルペンチル、3 - メチルペンチル、4 - メチルペンチル、1, 1 - ジメチルブチル、1, 2 - ジメチルブチル、1, 3 - ジメチルブチル、2, 2 - ジメチルブチル、2, 3 - ジメチルブチル、3, 3 - ジメチルブチル、1 - エチルブチル、2 - エチルブチル、1, 1, 2 - トリメチルプロピル、1, 2, 2 - トリメチルプロピル、1 - エチル - 1 - メチルプロピル、又は1 - エチル - 2 - メチルプロピルでもある。 $C_1 - C_8$ - アルキルはさらに、例えば、ヘプチル、オクチル、2 - エチルヘキシル、及びそれらの位置異性体でもある。 $C_1 - C_{10}$ - アルキルはさらに、例えば、ノニル、デシル、及びそれらの位置異性体でもある。

10

【0043】

本明細書で使用する用語「ハロアルキル」は、「部分的又は完全にハロゲン化されているアルキル」としても表され、1～2個（「 $C_1 - C_2$ - ハロアルキル」）、1～3個（「 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル」）、1～4個（「 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル」）、1～6個（「 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル」）、1～8個（「 $C_1 - C_8$ - ハロアルキル」）、又は1～10個（「 $C_1 - C_{10}$ - ハロアルキル」）の炭素原子を有する、直鎖又は分岐アルキル基（上記の通り）であって、これらの基における水素原子の一部又はすべてが、上記のハロゲン原子により置きかえられている、アルキル基を指し、特にクロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1 - クロロエチル、1 - ブロモエチル、1 - フルオロエチル、2 - フルオロエチル、2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2, 2 - トリフルオロエチル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチル、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチル、2, 2, 2 - トリクロロエチル又はペンタフルオロエチルなどの $C_1 - C_2$ - ハロアルキルである。 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルはさらに、例えば、1 - フルオロプロピル、2 - フルオロプロピル、3 - フルオロプロピル、1, 1 - ジフルオロプロピル、2, 2 - ジフルオロプロピル、1, 2 - ジフルオロプロピル、3, 3 - ジフルオロプロピル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピル、ヘプタフルオロプロピル、1, 1, 1 - トリフルオロプロパ - 2 - イル、3 - クロロプロピルなどである。 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルに関する例には、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルに関するものの他に、4 - クロロブチルなどがある。

20

30

【0044】

「ハロメチル」とは、1、2又は3個の水素原子がハロゲン原子で置きかえられているメチルである。例には、ブロモメチル、クロロメチル、フルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチルなどがある。

40

【0045】

本明細書で使用する用語「アルケニル」とは、2～3個（「 $C_2 - C_3$ - アルケニル」）、2～4個（「 $C_2 - C_4$ - アルケニル」）、2～6個（「 $C_2 - C_6$ - アルケニル」）、2～8個（「 $C_2 - C_8$ - アルケニル」）、又は2～10個（「 $C_2 - C_{10}$ - アルケニル」）の炭素原子、及び任意の位置に二重結合を有する直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基、例えばエテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル若しくは1 - メチルエテニルなどの $C_2 - C_3$ - アルケニル、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、1 - メチルエテニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - メチル - 1 - プロペニル、2 - メチル - 1 - プロペニル、1 - メチル - 2 - プロペニル若しくは2 - メチル - 2 - プロペニルな

50

どの $C_2 - C_4$ - アルケニル、エテニル、1 - プロペニル、2 - プロペニル、1 - メチルエテニル、1 - ブテニル、2 - ブテニル、3 - ブテニル、1 - メチル - 1 - プロペニル、2 - メチル - 1 - プロペニル、1 - メチル - 2 - プロペニル、2 - メチル - 2 - プロペニル、1 - ペンテニル、2 - ペンテニル、3 - ペンテニル、4 - ペンテニル、1 - メチル - 1 - ブテニル、2 - メチル - 1 - ブテニル、3 - メチル - 1 - ブテニル、1 - メチル - 2 - ブテニル、2 - メチル - 2 - ブテニル、3 - メチル - 2 - ブテニル、1 - メチル - 3 - ブテニル、2 - メチル - 3 - ブテニル、3 - メチル - 3 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 1 - プロペニル、1, 2 - ジメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - プロペニル、1 - エチル - 2 - プロペニル、1 - ヘキセニル、2 - ヘキセニル、3 - ヘキセニル、4 - ヘキセニル、5 - ヘキセニル、1 - メチル - 1 - ペンテニル、2 - メチル - 1 - ペンテニル、3 - メチル - 1 - ペンテニル、4 - メチル - 1 - ペンテニル、1 - メチル - 2 - ペンテニル、2 - メチル - 2 - ペンテニル、3 - メチル - 2 - ペンテニル、4 - メチル - 2 - ペンテニル、1 - メチル - 3 - ペンテニル、2 - メチル - 3 - ペンテニル、3 - メチル - 3 - ペンテニル、4 - メチル - 3 - ペンテニル、1 - メチル - 4 - ペンテニル、2 - メチル - 4 - ペンテニル、3 - メチル - 4 - ペンテニル、4 - メチル - 4 - ペンテニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、2, 3 - ジメチル - 3 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブテニル、3, 3 - ジメチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 1 - ブテニル、1 - エチル - 2 - ブテニル、1 - エチル - 3 - ブテニル、2 - エチル - 1 - ブテニル、2 - エチル - 2 - ブテニル、2 - エチル - 3 - ブテニル、1, 1, 2 - トリメチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロペニル、1 - エチル - 2 - メチル - 1 - プロペニル、1 - エチル - 2 - メチル - 2 - プロペニルなどの $C_2 - C_{10}$ - アルケニル、又は $C_2 - C_6$ - アルケニルに関して言及した基、さらには 1 - ヘプテニル、2 - ヘプテニル、3 - ヘプテニル、1 - オクテニル、2 - オクテニル、3 - オクテニル、4 - オクテニル、1 - ノネニル、2 - ノネニル、3 - ノネニル、4 - ノネニル、1 - デセニル、2 - デセニル、3 - デセニル、4 - デセニル、5 - デセニルなどの $C_2 - C_{10}$ - アルケニル並びにそれらの位置異性体を指す。

10

20

30

【0046】

本明細書で使用する用語「ハロアルケニル」は、「部分的又は完全にハロゲン化されているアルケニル」としても表され、2 ~ 3 個（「 $C_2 - C_3$ - ハロアルケニル」）、2 ~ 4 個（「 $C_2 - C_4$ - ハロアルケニル」）、2 ~ 6 個（「 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル」）、2 ~ 8 個（「 $C_2 - C_8$ - ハロアルケニル」）、又は 2 ~ 10 個（「 $C_2 - C_{10}$ - ハロアルケニル」）の炭素原子、及び任意の位置（上記の通り）に二重結合を有する直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基であって、これらの基の一部又はすべての水素原子が、上記の通りハロゲン原子、特にフッ素、塩素、及び臭素により置きかえられている基（例えば、クロロビニル、クロロアリルなど）を指す。

40

【0047】

本明細書で使用する用語「アルキニル」とは、2 ~ 3 個（「 $C_2 - C_3$ - アルキニル」）、2 ~ 4 個（「 $C_2 - C_4$ - アルキニル」）、2 ~ 6 個（「 $C_2 - C_6$ - アルキニル」）、2 ~ 8 個（「 $C_2 - C_8$ - アルキニル」）、又は 2 ~ 10 個（「 $C_2 - C_{10}$ - アルキニル」）の炭素原子、及び任意の位置に 1 つ又は 2 つの三重結合を有する直鎖又は分岐の炭化水素基、例えばエチニル、1 - プロピニル又は 2 - プロピニルなどの $C_2 - C_3$ - アルキニル、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニルなどの $C_2 - C_4$ - アルキニル、エチニル、1 - プロピニル、2 - プロピニル、1 - ブチニル、2 - ブチニル、3 - ブチニル、1 - メチル - 2 - プロピニル、1 - ペンチニル、2 - ペンチニル、3 - ペンチニル、4 - ペンチニル、1 - メチル - 2 - ブチニル、1 - メチル - 3 - ブチニル、2 - メチル - 3 - ブチニル、3 - メチル

50

- 1 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - プロピニル、1 - エチル - 2 - プロピニル、1 - ヘキシニル、2 - ヘキシニル、3 - ヘキシニル、4 - ヘキシニル、5 - ヘキシニル、1 - メチル - 2 - ペンチニル、1 - メチル - 3 - ペンチニル、1 - メチル - 4 - ペンチニル、2 - メチル - 3 - ペンチニル、2 - メチル - 4 - ペンチニル、3 - メチル - 1 - ペンチニル、3 - メチル - 4 - ペンチニル、4 - メチル - 1 - ペンチニル、4 - メチル - 2 - ペンチニル、1, 1 - ジメチル - 2 - ブチニル、1, 1 - ジメチル - 3 - ブチニル、1, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、2, 2 - ジメチル - 3 - ブチニル、3, 3 - ジメチル - 1 - ブチニル、1 - エチル - 2 - ブチニル、1 - エチル - 3 - ブチニル、2 - エチル - 3 - ブチニル、1 - エチル - 1 - メチル - 2 - プロピニルなどの $C_2 - C_6$ - アルキニルを指す。

【0048】

本明細書で使用する用語「ハロアルキニル」は、「部分的又は完全にハロゲン化されているアルキニル」としても表され、2 ~ 3 個（「 $C_2 - C_3$ - ハロアルキニル」）、2 ~ 4 個（「 $C_2 - C_4$ - ハロアルキニル」）、3 ~ 4 個（「 $C_3 - C_4$ - ハロアルキニル」）、2 ~ 6 個（「 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル」）、2 ~ 8 個（「 $C_2 - C_8$ - ハロアルキニル」）、又は 2 ~ 10 個（「 $C_2 - C_{10}$ - ハロアルキニル」）の炭素原子、及び任意の位置（上記の通り）に 1 つ又は 2 つの三重結合を有する直鎖又は分岐の不飽和炭化水素基であって、これらの基の一部又はすべての水素原子が、上記の通りハロゲン原子、特にフッ素、塩素、及び臭素により置きかえられている基を指す。

【0049】

本明細書で使用する用語「シクロアルキル」とは、3 ~ 8 個（「 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル」）、特に 3 ~ 6 個（「 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル」）又は 3 ~ 5 個（「 $C_3 - C_5$ - シクロアルキル」）又は 3 ~ 4 個（「 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル」）の炭素原子を有する、単環式又は二環式又は多環式の飽和炭化水素基を指す。3 ~ 4 個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル及びシクロブチルを含む。3 ~ 5 個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル、シクロブチル及びシクロペンチルを含む。3 ~ 6 個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルを含む。3 ~ 8 個の炭素原子を有する単環式基の例は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、及びシクロオクチルを含む。7 個又は 8 個の炭素原子を有する二環式基の例は、ビスシクロ[2.2.1]ヘプチル、ビスシクロ[3.1.1]ヘプチル、ビスシクロ[2.2.2]オクチル、及びビスシクロ[3.2.1]オクチルを含む。好ましくは、用語シクロアルキルは、単環式飽和炭化水素基を意味する。

【0050】

本明細書で使用する用語「ハロシクロアルキル」は、「部分的又は完全にハロゲン化されているシクロアルキル」としても表され、3 ~ 8 個（「 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル」）、又は好ましくは 3 ~ 6 個（「 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル」）、又は 3 ~ 5 個（「 $C_3 - C_5$ - ハロシクロアルキル」）、又は 3 ~ 4 個（「 $C_3 - C_4$ - ハロシクロアルキル」）の炭素環員（上記の通り）を有する単環式、若しくは二環式、又は多環式の飽和炭化水素基であって、一部又はすべての水素原子が、上記の通りハロゲン原子、特にフッ素、塩素、及び臭素により置きかえられている基を指す。

【0051】

用語「シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル」とは、上記で定義した $C_3 - C_8$ - シクロアルキル基（「 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル」）、好ましくは $C_3 - C_6$ - シクロアルキル基（「 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル」）、より好ましくは $C_3 - C_4$ - シクロアルキル基（「 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル」）（好ましくは、単環式シクロアルキル基）を指し、上で定義した通り、 $C_1 - C_4$ - アルキル基を介して分子の残部に結合している。 $C_3 - C_4$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキルに関する例はシクロプロピルメチル、シクロプロピルエチル、シクロプロピルプロピル、シクロブチルメチル、シクロブチルエチル、及びシクロブチルプロピルである。 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキルに関する例は、 $C_3 - C_4$ - シクロアル

10

20

30

40

50

キル - $C_1 - C_4$ - アルキルに関して言及したものと別は、シクロペンチルメチル、シクロペンチルエチル、シクロペンチルプロピル、シクロヘキシルメチル、シクロヘキシルエチル及びシクロヘキシルプロピルである。 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキルに関する例は、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキルに関して言及したものと別は、シクロヘプチルメチル、シクロヘプチルエチル、シクロオクチルメチルなどである。

【0052】

用語「 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル」とは、上で定義した通り、 $C_1 - C_4$ - アルキル基を介して分子の残部に結合している、上で定義した通りの $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル基を指す。

本明細書で使用する用語「シクロアルケニル」とは、環中に少なくとも1つのC - C二重結合を有する単環式炭化水素基を指すが、この環は芳香族性ではなく、この炭化水素基は、3 ~ 8個（「 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル」）の炭素原子を有するものである。例は、シクロプロパ - 1 - エニル及びシクロプロパ - 2 - イルなどのシクロプロペニル、シクロブタ - 1 - エニル及びシクロブタ - 2 - エニルなどのシクロブテニル、シクロペンタ - 1 - エニル、シクロペンタ - 2 - エニル及びシクロペンタ - 3 - エニルなどのシクロペンテニル、シクロペンタ - 1, 3 - ジエニル、シクロペンタ (cyclopenta) - 1, 4 - ジエニル及びシクロペンタ (cyclopenta) - 2, 4 - ジエニルなどのシクロペンタジエニル、シクロヘキサ - 1 - エニル、シクロヘキサ - 2 - エニル及びシクロヘキサ - 3 - エニルなどのシクロヘキセニル、シクロヘキサ - 1, 3 - ジエニル、シクロヘキサ - 1, 4 - ジエニル、シクロヘキサ - 1, 5 - ジエニル及びシクロヘキサ - 2, 5 - ジエニルなどのシクロヘキサジエニル、シクロヘプテニル、シクロヘプタジエニル、シクロヘプタトリエニル、シクロオクテニル、シクロオクタジエニル、シクロオクタトリエニル及びシクロオクタテトラエニルである。

【0053】

本明細書で使用する用語「ハロシクロアルケニル」とは、環中に少なくとも1つのC - C二重結合を有する単環式炭化水素基を指すが、この環は芳香族性ではなく、この炭化水素基は、3 ~ 8個（「 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルケニル」）の炭素原子を有しており、且つ水素原子の一部又は全部が、上記のハロゲン原子、特にフッ素、塩素及び臭素により置き換えられているものである。

【0054】

用語「 $C_1 - C_2$ - アルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ - アルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ - アルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ - アルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ - アルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ - アルキル基である。 $C_1 - C_2$ - アルコキシは、メトキシ又はエトキシである。 $C_1 - C_3$ - アルコキシはさらに、例えば、n - プロポキシ及び1 - メチルエトキシ (イソプロポキシ) である。 $C_1 - C_4$ - アルコキシはさらに、例えば、ブトキシ、1 - メチルプロポキシ (sec - ブトキシ)、2 - メチルプロポキシ (イソブトキシ)、又は1, 1 - ジメチルエトキシ (tert - ブトキシ) である。 $C_1 - C_6$ - アルコキシはさらに、例えば、ペントキシ、1 - メチルブトキシ、2 - メチルブトキシ、3 - メチルブトキシ、1, 1 - ジメチルプロポキシ、1, 2 - ジメチルプロポキシ、2, 2 - ジメチルプロポキシ、1 - エチルプロポキシ、ヘキソキシ、1 - メチルペントキシ、2 - メチルペントキシ、3 - メチルペントキシ、4 - メチルペントキシ、1, 1 - ジメチルブトキシ、1, 2 - ジメチルブトキシ、1, 3 - ジメチルブトキシ、2, 2 - ジメチルブトキシ、2, 3 - ジメチルブトキシ、3, 3 - ジメチルブトキシ、1 - エチルブトキシ、2 - エチルブトキシ、1, 1, 2 - トリメチルプロポキシ、1, 2, 2 - トリメチルプロポキシ、1 - エチル - 1 - メチルプロポキシ又は1 - エチル - 2 - メチ

10

20

30

40

50

ルプロボキシである。 $C_1 - C_8$ -アルコキシはさらに、例えばヘプチルオキシ、オクチルオキシ、2-エチルヘキシルオキシ及びそれらの位置異性体である。 $C_1 - C_{10}$ -アルコキシはさらに、例えばノニルオキシ、デシルオキシ及びそれらの位置異性体である。

【0055】

用語「 $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ -ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ -ハロアルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ -ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ -ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ -ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ -ハロアルコキシ」は、酸素原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ -ハロアルキル基である。 $C_1 - C_2$ -ハロアルコキシは、例えば、 OC_2H_5F 、 $OC_2H_5F_2$ 、 OC_2F_3 、 OC_2H_5Cl 、 $OC_2H_5Cl_2$ 、 OC_2Cl_3 、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、又は OC_2F_5 である。 $C_1 - C_3$ -ハロアルコキシはさらに、例えば、2-フルオロプロボキシ、3-フルオロプロボキシ、2,2-ジフルオロプロボキシ、2,3-ジフルオロプロボキシ、2-クロロプロボキシ、3-クロロプロボキシ、2,3-ジクロロプロボキシ、2-ブロモプロボキシ、3-ブロモプロボキシ、3,3,3-トリフルオロプロボキシ、3,3,3-トリクロロプロボキシ、 $OC_3H_7F_5$ 、 $OC_3F_2 - C_2F_5$ 、1-(CH_2F)-2-フルオロエトキシ、1-(CH_2Cl)-2-クロロエトキシ又は1-(CH_2Br)-2-ブロモエトキシである。 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシはさらに、例えば、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブロモブトキシ又はノナフルオロブトキシである。 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシはさらに、例えば、5-フルオロペントキシ、5-クロロペントキシ、5-ブロモペントキシ(bromopentyloxy)、5-ヨードペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロヘキソキシ、6-クロロヘキソキシ、6-ブロモヘキソキシ、6-ヨードヘキソキシ又はドデカフルオロヘキソキシである。

【0056】

本明細書で使用する用語「 $C_1 - C_3$ -アルコキシ- $C_1 - C_3$ -アルキル」とは、上で定義した通り、1~3個の炭素原子を有する、直鎖又は分岐アルキル基であって、上で定義した通り、1個の水素原子が $C_1 - C_3$ -アルコキシ基により置きかえられているアルキル基を指す。本明細書で使用する用語「 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル」とは、上で定義した通り、1~4個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルキル基であって、上で定義した通り、水素原子の1個が $C_1 - C_4$ -アルコキシ基により置きかえられているアルキル基を指す。本明細書で使用する用語「 $C_1 - C_6$ -アルコキシ- $C_1 - C_6$ -アルキル」とは上で定義した通り、1~6個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルキル基であって、上で定義した通り、水素原子の1個が $C_1 - C_6$ -アルコキシ基により置きかえられているアルキル基を指す。例は、メトキシメチル、エトキシメチル、プロボキシメチル、イソプロボキシメチル、n-ブトキシメチル、sec-ブトキシメチル、イソブトキシメチル、tert-ブトキシメチル、1-メトキシエチル、1-エトキシエチル、1-プロボキシエチル、1-イソプロボキシエチル、1-n-ブトキシエチル、1-sec-ブトキシエチル、1-イソブトキシエチル、1-tert-ブトキシエチル、2-メトキシエチル、2-エトキシエチル、2-プロボキシエチル、2-イソプロボキシエチル、2-n-ブトキシエチル、2-sec-ブトキシエチル、2-イソブトキシエチル、2-tert-ブトキシエチル、1-メトキシプロピル、1-エトキシプロピル、1-プロボキシプロピル、1-イソプロボキシプロピル、1-n-ブトキシプロピル、1-sec-ブトキシプロピル、1-イソブトキシプロピル、1-tert-ブトキシプロピル、2-メトキシブ

ロピル、2 - エトキシプロピル、2 - プロポキシプロピル、2 - イソプロポキシプロピル、2 - n - ブトキシプロピル、2 - sec - ブトキシプロピル、2 - イソブトキシプロピル、2 - tert - ブトキシプロピル、3 - メトキシプロピル、3 - エトキシプロピル、3 - プロポキシプロピル、3 - イソプロポキシプロピル、3 - n - ブトキシプロピル、3 - sec - ブトキシプロピル、3 - イソブトキシプロピル、3 - tert - ブトキシプロピルなどである。

【0057】

本明細書で使用する用語「 $C_1 - C_4$ - アルコキシ - メチル」とは、上で定義した通り、1 個の水素原子が $C_1 - C_4$ - アルコキシ基により置きかえられている、メチルを指す。本明細書で使用する用語「 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - メチル」とは、水素原子の 1 個が、上で定義した $C_1 - C_6$ - アルコキシ基により置きかえられているメチルを指す。例は、メトキシメチル、エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、n - ブトキシメチル、sec - ブトキシメチル、イソブトキシメチル、tert - ブトキシメチル、ペンチルオキシメチル、ヘキシルオキシメチルなどである。

【0058】

$C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキルは、1 ~ 6 個、とりわけ 1 ~ 4 個の炭素原子 (= $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキル) を有する直鎖又は分岐アルキル基であって、水素原子の 1 個が $C_1 - C_6$ - アルコキシ基により置きかえられており、且つ少なくとも 1 個、例えば 1、2、3、4 個又は残りの水素原子のすべて (アルコキシ部分中かアルキル部分中のいずれか一方、又はその両方中) がハロゲン原子によって置きかえられているアルキル基である。 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ - $C_1 - C_4$ - アルキルは、1 ~ 4 個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルキル基であって、水素原子の 1 個が $C_1 - C_4$ - アルコキシ基により置きかえられており、且つ少なくとも 1 個、例えば 1、2、3、4 個又は残りの水素原子のすべて (アルコキシ部分中かアルキル部分中のいずれか一方、又はその両方中) がハロゲン原子によって置きかえられているアルキル基である。例は、ジフルオロメトキシメチル (CHF_2OCH_3)、トリフルオロメトキシメチル、1 - ジフルオロメトキシエチル、1 - トリフルオロメトキシエチル、2 - ジフルオロメトキシエチル、2 - トリフルオロメトキシエチル、ジフルオロメトキシメチル (CH_3OCF_2)、1, 1 - ジフルオロ - 2 - メトキシエチル、2, 2 - ジフルオロ - 2 - メトキシエチルなどである。

【0059】

用語「 $C_1 - C_2$ - アルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ - アルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ - アルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ - アルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ - アルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ - アルキル基である。 $C_1 - C_2$ - アルキルチオは、メチルチオ又はエチルチオである。 $C_1 - C_3$ - アルキルチオはさらに、例えば、n - プロピルチオ又は 1 - メチルエチルチオ (イソプロピルチオ) である。 $C_1 - C_4$ - アルキルチオはさらに、例えば、ブチルチオ、1 - メチルプロピルチオ (sec - ブチルチオ)、2 - メチルプロピルチオ (イソブチルチオ)、又は 1, 1 - ジメチルエチルチオ (tert - ブチルチオ) である。 $C_1 - C_6$ - アルキルチオはさらに、例えば、ペンチルチオ、1 - メチルブチルチオ、2 - メチルブチルチオ、3 - メチルブチルチオ、1, 1 - ジメチルプロピルチオ、1, 2 - ジメチルプロピルチオ、2, 2 - ジメチルプロピルチオ、1 - エチルプロピルチオ、ヘキシルチオ、1 - メチルペンチルチオ、2 - メチルペンチルチオ、3 - メチルペンチルチオ、4 - メチルペンチルチオ、1, 1 - ジメチルブチルチオ、1, 2 - ジメチルブチルチオ、1, 3 - ジメチルブチルチオ、2, 2 - ジメチルブチルチオ、2, 3 - ジメチルブチルチオ、3, 3 - ジメチルブチルチオ、1 - エチルブチルチオ、2 - エチルブチルチオ、1, 1, 2 - トリメチルプロピルチオ、1,

2, 2 - トリメチルプロピルチオ、1 - エチル - 1 - メチルプロピルチオ又は1 - エチル - 2 - メチルプロピルチオである。 $C_1 - C_8$ - アルキルチオはさらに、例えば、ヘプチルチオ、オクチルチオ、2 - エチルヘキシルチオ、及びそれらの位置異性体である。 $C_1 - C_{10}$ - アルキルチオはさらに、例えばノニルチオ、デシルチオ、及びそれらの位置異性体である。

【0060】

用語「 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ - ハロアルキルチオ」は、硫黄原子を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ - ハロアルキル基である。 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルチオは、例えば、 SC_2H_2F 、 $SC_2H_2F_2$ 、 $SC_2H_2F_3$ 、 SC_2H_2Cl 、 $SC_2H_2Cl_2$ 、 $SC_2H_2Cl_3$ 、クロロフルオロメチルチオ、ジクロロフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、2 - フルオロエチルチオ、2 - クロロエチルチオ、2 - ブロモエチルチオ、2 - ヨードエチルチオ、2, 2 - ジフルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリフルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチルチオ、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチルチオ、2, 2, 2 - トリクロロエチルチオ又は SC_2F_5 である。 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルチオはさらに、例えば、2 - フルオロプロピルチオ、3 - フルオロプロピルチオ、2, 2 - ジフルオロプロピルチオ、2, 3 - ジフルオロプロピルチオ、2 - クロロプロピルチオ、3 - クロロプロピルチオ、2, 3 - ジクロロプロピルチオ、2 - ブロモプロピルチオ、3 - ブロモプロピルチオ、3, 3, 3 - トリフルオロプロピルチオ、3, 3, 3 - トリクロロプロピルチオ、 $SC_3H_2 - C_2F_5$ 、 $SC_3H_2F_2 - C_2F_5$ 、1 - (C_2H_2F) - 2 - フルオロエチルチオ、1 - (C_2H_2Cl) - 2 - クロロエチルチオ又は1 - (C_2H_2Br) - 2 - ブロモエチルチオである。 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルチオはさらに、例えば、4 - フルオロブチルチオ、4 - クロロブチルチオ、4 - ブロモブチルチオ、又はノナフルオロブチルチオである。 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルチオはさらに、例えば、5 - フルオロペンチルチオ、5 - クロロペンチルチオ、5 - ブロモペンチルチオ、5 - ヨードペンチルチオ、ウンデカフルオロペンチルチオ、6 - フルオロヘキシルチオ、6 - クロロヘキシルチオ、6 - ブロモヘキシルチオ、6 - ヨードヘキシルチオ又はドデカフルオロヘキシルチオである。

【0061】

用語「 $C_1 - C_2$ - アルキルスルフィニル」は、スルフィニル [$S(O)$] 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ - アルキルスルフィニル」は、スルフィニル [$S(O)$] 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニル」は、スルフィニル [$S(O)$] 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニル」は、スルフィニル [$S(O)$] 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ - アルキルスルフィニル」は、スルフィニル [$S(O)$] 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ - アルキル基である。 $C_1 - C_2$ - アルキルスルフィニルは、メチルスルフィニル又はエチルスルフィニルである。 $C_1 - C_3$ - アルキルスルフィニルはさらに、例えば、n - プロピルスルフィニル、及び1 - メチルエチルスルフィニル (イソプロピルスルフィニル) である。 $C_1 - C_4$ - アルキルスルフィニルはさらに、例えば、ブチルスルフィニル、1 - メチルプロピルスルフィニル (sec - ブチルスルフィニル)、2 - メチルプロピルスルフィニル (イソブチルスルフィニル) 又は1, 1 - ジメチルエチルスルフィニル (tert - ブチルスルフィニル) である。 $C_1 - C_6$ - アルキルスルフィニルはさらに、例えば、ペンチルスルフィニル、1 - メチルブチルスルフィニル、2 - メ

10

20

30

40

50

チルブチルスルフィニル、3 - メチルブチルスルフィニル、1, 1 - ジメチルプロピルスルフィニル、1, 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、2, 2 - ジメチルプロピルスルフィニル、1 - エチルプロピルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル、1 - メチルペンチルスルフィニル、2 - メチルペンチルスルフィニル、3 - メチルペンチルスルフィニル、4 - メチルペンチルスルフィニル、1, 1 - ジメチルブチルスルフィニル、1, 2 - ジメチルブチルスルフィニル、1, 3 - ジメチルブチルスルフィニル、2, 2 - ジメチルブチルスルフィニル、2, 3 - ジメチルブチルスルフィニル、3, 3 - ジメチルブチルスルフィニル、1 - エチルブチルスルフィニル、2 - エチルブチルスルフィニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルスルフィニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルスルフィニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルスルフィニル又は 1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルフィニルである。C₁ - C₈ - アルキルスルフィニルはさらに、例えばヘブチルスルフィニル、オクチルスルフィニル、2 - エチルヘキシルスルフィニル及びそれらの位置異性体である。C₁ - C₁₀ - アルキルスルフィニルはさらに、例えばノニルスルフィニル、デシルスルフィニル、及びそれらの位置異性体である。

【0062】

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

【0063】

用語「C₁ - C₂ - アルキルスルホニル」は、スルホニル [S(O)₂] 基を介して結合

している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ - アルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - アルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ - アルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ - アルキル基である。 $C_1 - C_2$ - アルキルスルホニルは、メチルスルホニル又はエチルスルホニルである。 $C_1 - C_3$ - アルキルスルホニルはさらに、例えば、 n - プロピルスルホニル又は 1 - メチルエチルスルホニル（イソプロピルスルホニル）である。 $C_1 - C_4$ - アルキルスルホニルはさらに、例えば、ブチルスルホニル、1 - メチルプロピルスルホニル（sec - ブチルスルホニル）、2 - メチルプロピルスルホニル（イソブチルスルホニル）、又は 1, 1 - ジメチルエチルスルホニル（tert - ブチルスルホニル）である。 $C_1 - C_6$ - アルキルスルホニルはさらに、例えば、ペンチルスルホニル、1 - メチルブチルスルホニル、2 - メチルブチルスルホニル、3 - メチルブチルスルホニル、1, 1 - ジメチルプロピルスルホニル、1, 2 - ジメチルプロピルスルホニル、2, 2 - ジメチルプロピルスルホニル、1 - エチルプロピルスルホニル、ヘキシルスルホニル、1 - メチルペンチルスルホニル、2 - メチルペンチルスルホニル、3 - メチルペンチルスルホニル、4 - メチルペンチルスルホニル、1, 1 - ジメチルブチルスルホニル、1, 2 - ジメチルブチルスルホニル、1, 3 - ジメチルブチルスルホニル、2, 2 - ジメチルブチルスルホニル、2, 3 - ジメチルブチルスルホニル、3, 3 - ジメチルブチルスルホニル、1 - エチルブチルスルホニル、2 - エチルブチルスルホニル、1, 1, 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1, 2, 2 - トリメチルプロピルスルホニル、1 - エチル - 1 - メチルプロピルスルホニル又は 1 - エチル - 2 - メチルプロピルスルホニルである。 $C_1 - C_8$ - アルキルスルホニルはさらに、例えばヘプチルスルホニル、オクチルスルホニル、2 - エチルヘキシルスルホニル及びそれらの位置異性体である。 $C_1 - C_{10}$ - アルキルスルホニルはさらに、例えばノニルスルホニル、デシルスルホニル、及びそれらの位置異性体である。

10

20

30

40

50

【0064】

用語「 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_2$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_3$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_4$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - ハロアルキル基である。用語「 $C_1 - C_{10}$ - ハロアルキルスルホニル」は、スルホニル $[S(O)_2]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_{10}$ - ハロアルキル基である。 $C_1 - C_2$ - ハロアルキルスルホニルは、例えば、 $S(O)_2CH_2F$ 、 $S(O)_2CHF_2$ 、 $S(O)_2CF_3$ 、 $S(O)_2CH_2Cl$ 、 $S(O)_2CHCl_2$ 、 $S(O)_2CCl_3$ 、クロロフルオロメチルスルホニル、ジクロロフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、2 - フルオロエチルスルホニル、2 - クロロエチルスルホニル、2 - プロモエチルスルホニル、2 - ヨードエチルスルホニル、2, 2 - ジフルオロエチルスルホニル、2, 2, 2 - トリフルオロエチルスルホニル、2 - クロロ - 2 - フルオロエチルスルホニル、2 - クロロ - 2, 2 - ジフルオロエチルスルホニル、2, 2 - ジクロロ - 2 - フルオロエチルスルホニル、2, 2, 2 - トリクロロエチルスルホニル又は $S(O)_2C_2F_5$ である。 $C_1 - C_3$ - ハロアルキルスルホニルはさらに、例えば、2 - フルオロプロピルスルホニル、3 - フルオロプロピルスルホニル、2, 2 - ジフルオロプロピルスルホニル、2, 3 - ジフルオロプロピルスルホニル、2 - クロロプロピルスルホニル、3 - クロロプロピルスルホニル、2, 3 - ジクロロプロピルスルホニル、2 - プロモプロピルスルホニル、

3 - ブロモプロピルスルホニル、3, 3, 3 - トリフルオロプロピルスルホニル、3, 3, 3 - トリクロロプロピルスルホニル、 $S(O)_2CH_2 - C_2F_5$ 、 $S(O)_2CF_2 - C_2F_5$ 、1 - (CH_2F) - 2 - フルオロエチルスルホニル、1 - (CH_2Cl) - 2 - クロロエチルスルホニル又は1 - (CH_2Br) - 2 - ブロモエチルスルホニルである。 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルスルホニルはさらに、例えば、4 - フルオロブチルスルホニル、4 - クロロブチルスルホニル、4 - ブロモブチルスルホニル又はノナフルオロブチルスルホニルである。 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルスルホニルはさらに、例えば、5 - フルオロペンチルスルホニル、5 - クロロペンチルスルホニル、5 - ブロモペンチルスルホニル、5 - ヨードペンチルスルホニル、ウンデカフルオロペンチルスルホニル、6 - フルオロヘキシルスルホニル、6 - クロロヘキシルスルホニル、6 - ブロモヘキシルスルホニル、6 - ヨードヘキシルスルホニル、又はドデカフルオロヘキシルスルホニルである。

10

【0065】

置換基「オキソ」(又は=O)は、 CH_2 基を $C(=O)$ 基により置きかえるものである。

【0066】

置換基=Sは、 CH_2 基を $C(=S)$ 基により置きかえるものである。

用語「アルキルカルボニル」は、カルボニル $[C(=O)]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの $C_1 - C_6$ - アルキル(「 $C_1 - C_6$ - アルキルカルボニル」)基、好ましくは $C_1 - C_4$ - アルキル(「 $C_1 - C_4$ - アルキルカルボニル」)基である。例は、アセチル(メチルカルボニル)、プロピオニル(エチルカルボニル)、プロピルカルボニル、イソプロピルカルボニル、n - ブチルカルボニルなどである。

20

用語「ハロアルキルカルボニル」は、カルボニル $[C(=O)]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル(「 $C_1 - C_6$ - ハロアルキルカルボニル」)基、好ましくは $C_1 - C_4$ - ハロアルキル(「 $C_1 - C_4$ - ハロアルキルカルボニル」)基である。例は、トリフルオロメチルカルボニル、2, 2, 2 - トリフルオロエチルカルボニルなどである。

【0067】

用語「アルコキシカルボニル」は、カルボニル $[C(=O)]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ(「 $C_1 - C_6$ - アルコキシカルボニル」)基、好ましくは $C_1 - C_4$ - アルコキシ(「 $C_1 - C_4$ - アルコキシカルボニル」)基である。例は、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、n - ブトキシカルボニルなどである。

30

用語「ハロアルコキシカルボニル」は、カルボニル $[C(=O)]$ 基を介して結合している、上で定義した通りの、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ(「 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシカルボニル」)基、好ましくは $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシ(「 $C_1 - C_4$ - ハロアルコキシカルボニル」)基である。例は、トリフルオロメトキシカルボニル、2, 2, 2 - トリフルオロエトキシカルボニルなどである。

【0068】

用語「 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノ」は、基 - $N(H)C_1 - C_6$ - アルキルである。例は、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノなどである。

40

【0069】

用語「ジ - ($C_1 - C_6$ - アルキル)アミノ」は、基 - $N(C_1 - C_6 - アルキル)_2$ である。例は、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、エチルメチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジイソプロピルアミノ、メチルプロピルアミノ、メチルイソプロピルアミノ、エチルプロピルアミノ、エチルイソプロピルアミノ、ジブチルアミノなどである。

用語「アミノカルボニル」は、基 - $C(O) - NH_2$ である。

用語「 $C_1 - C_6$ - アルキルアミノカルボニル」は、基 - $C(O) - N(H)C_1 - C_6$ - アルキルである。例は、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニルなどである。

50

用語「ジ - (C₁ - C₆ - アルキル) アミノカルボニル」は、基 - C(=O) - N(C₁ - C₆ - アルキル)₂である。例は、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、エチルメチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジイソプロピルアミノカルボニル、メチルプロピルアミノカルボニル、メチルイソプロピルアミノカルボニル、エチルプロピルアミノカルボニル、エチルイソプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニルなどである。

【0070】

用語「環員として、1、2若しくは3（又は4）個のヘテロ原子、又はN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択されるヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和、又は最大不飽和の複素環式環（又は複素単環式環若しくは複素二環式環）」は、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3（又は4）個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の、好ましくは3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素単環式環、又は7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和、若しくは最大不飽和の複素二環式環を意味する。

10

【0071】

不飽和環は、少なくとも1つのC - C及び/若しくはC - N並びに/又はN - N二重結合を含有している。最大不飽和環は、環のサイズにより許容されるものと同数の、共役C - C及び/若しくはC - N並びに/又はN - N二重結合を含有している。最大不飽和の5員又は6員の複素環式環は芳香族である。部分不飽和環は、環のサイズにより許容される最大数のC - C及び/又はC - N及び/又はN - N二重結合よりも少ない二重結合を含有する。この複素環式環は、炭素環員又は窒素環員を介して分子の残部に結合していてもよい。もちろん、この複素環式環は、少なくとも1個の炭素環原子を含有している。環が2個以上のO環原子を含有している場合、これらは隣接しない。

20

【0072】

用語「環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和、又は最大不飽和の複素環式環」（この場合、「最大不飽和」には、「芳香族」も含まれる）は、本明細書で使用する場合、単環式基を意味し、この単環式基は、飽和、部分不飽和、又は最大不飽和（芳香族を含む）である。用語「環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7若しくは8員の飽和、部分不飽和、又は最大不飽和の複素環式環」（この場合、「最大不飽和」には、「芳香族」も含まれる）は、本明細書で使用する場合、さらに、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している8員の複素単環式基も包含し、この単環式基は、飽和、部分不飽和、又は最大不飽和（芳香族を含む）である。不飽和環は、少なくとも1つのC - C及び/若しくはC - N並びに/又はN - N二重結合を含有している。最大不飽和環は、環のサイズにより許容されるものと同数の、共役C - C及び/若しくはC - N並びに/又はN - N二重結合を含有している。最大不飽和の5員又は6員の複素環式環は芳香族である。7員及び8員環は芳香族にはなり得ない。それらはホモ芳香族（7員環で、3つの二重結合）、又は4つの二重結合（8員環）を有する。この複素環式環は、炭素環員又は窒素環員を介して分子の残部に結合していてもよい。もちろん、この複素環式環は、少なくとも1個の炭素環原子を含有している。環が2個以上のO環原子を含有している場合、これらは隣接しない。

30

40

【0073】

3、4、5、6又は7員の飽和複素環式環の例には、以下が含まれる：オキシラニル、チラニル、アジリジニル、オキセタニル、チエタニル、アゼチジニル、テトラヒドロフラン - 2 - イル、テトラヒドロフラン - 3 - イル、テトラヒドロチエン - 2 - イル、テトラヒドロチエン - 3 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピロリジン - 2 - イル、ピロリジン

50

- 3 - イル、ピラゾリジン - 1 - イル、ピラゾリジン - 3 - イル、ピラゾリジン - 4 - イル、ピラゾリジン - 5 - イル、イミダゾリジン - 1 - イル、イミダゾリジン - 2 - イル、イミダゾリジン - 4 - イル、オキサゾリジン - 2 - イル、オキサゾリジン - 3 - イル、オキサゾリジン - 4 - イル、オキサゾリジン - 5 - イル、イソオキサゾリジン - 2 - イル、イソオキサゾリジン - 3 - イル、イソオキサゾリジン - 4 - イル、イソオキサゾリジン - 5 - イル、チアゾリジン - 2 - イル、チアゾリジン - 3 - イル、チアゾリジン - 4 - イル、チアゾリジン - 5 - イル、イソチアゾリジン - 2 - イル、イソチアゾリジン - 3 - イル、イソチアゾリジン - 4 - イル、イソチアゾリジン - 5 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾリジン - 3 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾリジン - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾリジン - 3 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾリジン - 5 - イル、1, 2, 4 - トリアゾリジン - 3 - イル、1, 3, 4 - オキサジアゾリジン - 2 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾリジン - 2 - イル、1, 3, 4 - トリアゾリジン - 1 - イル、1, 3, 4 - トリアゾリジン - 2 - イル、2 - テトラヒドロピラニル、4 - テトラヒドロピラニル、1, 3 - ジオキサン - 5 - イル、1, 4 - ジオキサン - 2 - イル、ペペリジン - 1 - イル、ペペリジン - 2 - イル、ペペリジン - 3 - イル、ペペリジン - 4 - イル、ヘキサヒドロピリダジン - 3 - イル、ヘキサヒドロピリダジン - 4 - イル、ヘキサヒドロピリミジン - 2 - イル、ヘキサヒドロピリミジン - 4 - イル、ヘキサヒドロピリミジン - 5 - イル、ピペラジン - 1 - イル、ピペラジン - 2 - イル、1, 3, 5 - ヘキサヒドロトリアジン - 1 - イル、1, 3, 5 - ヘキサヒドロトリアジン - 2 - イル及び 1, 2, 4 - ヘキサヒドロトリアジン - 3 - イル、モルホリン - 2 - イル、モルホリン - 3 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 2 - イル、チオモルホリン - 3 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 2 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 3 - イル、1 - オキソチオモルホリン - 4 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 2 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 3 - イル、1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、アゼパン - 1 - 、 - 2 - 、 - 3 - 又は - 4 - イル、オキセパン - 2 - 、 - 3 - 、 - 4 - 又は - 5 - イル、ヘキサヒドロ - 1, 3 - ジアゼピニル、ヘキサヒドロ - 1, 4 - ジアゼピニル、ヘキサヒドロ - 1, 3 - オキサゼピニル、ヘキサヒドロ - 1, 4 - オキサゼピニル、ヘキサヒドロ - 1, 3 - ジオキセピニル、ヘキサヒドロ - 1, 4 - ジオキセピニルなど。

【0074】

3、4、5、6 又は 7 員の部分不飽和複素環式環の例には、以下が含まれる：2, 3 - ジヒドロフル - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロフル - 3 - イル、2, 4 - ジヒドロフル - 2 - イル、2, 4 - ジヒドロフル - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロチエン - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロチエン - 3 - イル、2, 4 - ジヒドロチエン - 2 - イル、2, 4 - ジヒドロチエン - 3 - イル、2 - ピロリン - 2 - イル、2 - ピロリン - 3 - イル、3 - ピロリン - 2 - イル、3 - ピロリン - 3 - イル、2 - イソオキサゾリン - 3 - イル、3 - イソオキサゾリン - 3 - イル、4 - イソオキサゾリン - 3 - イル、2 - イソオキサゾリン - 4 - イル、3 - イソオキサゾリン - 4 - イル、4 - イソオキサゾリン - 4 - イル、2 - イソオキサゾリン - 5 - イル、3 - イソオキサゾリン - 5 - イル、4 - イソオキサゾリン - 5 - イル、2 - イソチアゾリン - 3 - イル、3 - イソチアゾリン - 3 - イル、4 - イソチアゾリン - 3 - イル、2 - イソチアゾリン - 4 - イル、3 - イソチアゾリン - 4 - イル、4 - イソチアゾリン - 4 - イル、2 - イソチアゾリン - 5 - イル、3 - イソチアゾリン - 5 - イル、4 - イソチアゾリン - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、3, 4 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 1 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 3 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 4 - イル、4, 5 - ジヒドロピラゾール - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 2 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 4 - イル、2, 3 - ジヒドロオキサゾール - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール

10

20

30

40

50

- 2 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール
 - 4 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 5 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール
 - 2 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール - 3 - イル、3, 4 - ジヒドロオキサゾール
 - 4 - イル、2 - 、3 - 、4 - 、5 - 又は 6 - ジ - 又はテトラヒドロピリジニル、3 - ジ
 - 又はテトラヒドロピリダジニル、4 - ジ - 又はテトラヒドロピリダジニル、2 - ジ - 又
 はテトラヒドロピリミジニル、4 - ジ - 又はテトラヒドロピリミジニル、5 - ジ - 又はテ
 トラヒドロピリミジニル、ジ - 又はテトラヒドロピラジニル、1, 3, 5 - ジ - 又はテト
 ラヒドロトリアジン - 2 - イル、1, 2, 4 - ジ - 又はテトラヒドロトリアジン - 3 - イ
 ル、2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ [1 H] アゼピン - 1 - 、 - 2 - 、 - 3 - 、 - 4 - 、
 - 5 - 、 - 6 - 又は - 7 - イル、3, 4, 5, 6 - テトラヒドロ [2 H] アゼピン - 2 -
 、 - 3 - 、 - 4 - 、 - 5 - 、 - 6 - 又は - 7 - イル、2, 3, 4, 7 - テトラヒドロ [1
 H] アゼピン - 1 - 、 - 2 - 、 - 3 - 、 - 4 - 、 - 5 - 、 - 6 - 又は - 7 - イル、2, 3
 , 6, 7 - テトラヒドロ [1 H] アゼピン - 1 - 、 - 2 - 、 - 3 - 、 - 4 - 、 - 5 - 、 -
 6 - 又は - 7 - イル、テトラヒドロオキセピニル、例えば、2, 3, 4, 5 - テトラヒド
 ロ [1 H] オキセピン - 2 - 、 - 3 - 、 - 4 - 、 - 5 - 、 - 6 - 又は - 7 - イル、2, 3
 , 4, 7 - テトラヒドロ [1 H] オキセピン - 2 - 、 - 3 - 、 - 4 - 、 - 5 - 、 - 6 - 又
 は - 7 - イル、2, 3, 6, 7 - テトラヒドロ [1 H] オキセピン - 2 - 、 - 3 - 、 - 4
 - 、 - 5 - 、 - 6 - 又は - 7 - イル、テトラヒドロ - 1, 3 - ジアゼピニル、テトラヒド
 ロ - 1, 4 - ジアゼピニル、テトラヒドロ - 1, 3 - オキサゼピニル、テトラヒドロ - 1
 , 4 - オキサゼピニル、テトラヒドロ - 1, 3 - ジオキセピニル及びテトラヒドロ - 1,
 4 - ジオキセピニル。

10

20

【 0 0 7 5 】

3, 4, 5, 6 又は 7 員の最大不飽和 (芳香族を含む) 複素環式環の例は、2 - フリル
 、3 - フリル、2 - チエニル、3 - チエニル、1 - ピロリル、2 - ピロリル、3 - ピロリ
 ル、1 - ピラゾリル、3 - ピラゾリル、4 - ピラゾリル、5 - ピラゾリル、2 - オキサゾ
 リル、4 - オキサゾリル、5 - オキサゾリル、2 - チアゾリル、4 - チアゾリル、5 - チ
 アゾリル、1 - イミダゾリル、2 - イミダゾリル、4 - イミダゾリル、1, 3, 4 - トリ
 アゾール - 1 - イル、1, 3, 4 - トリアゾール - 2 - イル、2 - ピリジニル、3 - ピリ
 ジニル、4 - ピリジニル、1 - オキソピリジン - 2 - イル、1 - オキソピリジン - 3 - イ
 ル、1 - オキソピリジン - 4 - イル、3 - ピリダジニル、4 - ピリダジニル、2 - ピリミ
 ジニル、4 - ピリミジニル、5 - ピリミジニル及び 2 - ピラジニル、などの 5 員又は 6 員
 の複素芳香族環、さらには 1 H - アゼピン、1 H - [1, 3] - ジアゼピン及び 1 H - [1
 , 4] - ジアゼピンなどのホモ芳香族基である。

30

【 0 0 7 6 】

本発明では、「複素二環式環」は、少なくとも 1 個の環原子を共有して有する、2 つの
 環を含有する。これらの 2 つの環の少なくとも 1 つは、環員として、N、O、S、NO、
 SO 及び SO₂ から選択される、ヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有する。この用語は、
 2 つの環が 2 個の隣接環原子を共通して有する、縮合している (condensed) (縮
 合 (fused)) 環系、及び環が 1 個の環原子だけを共通して有するスピロ系、及び
 少なくとも 3 個の環原子を共通して有する架橋系を含む。

40

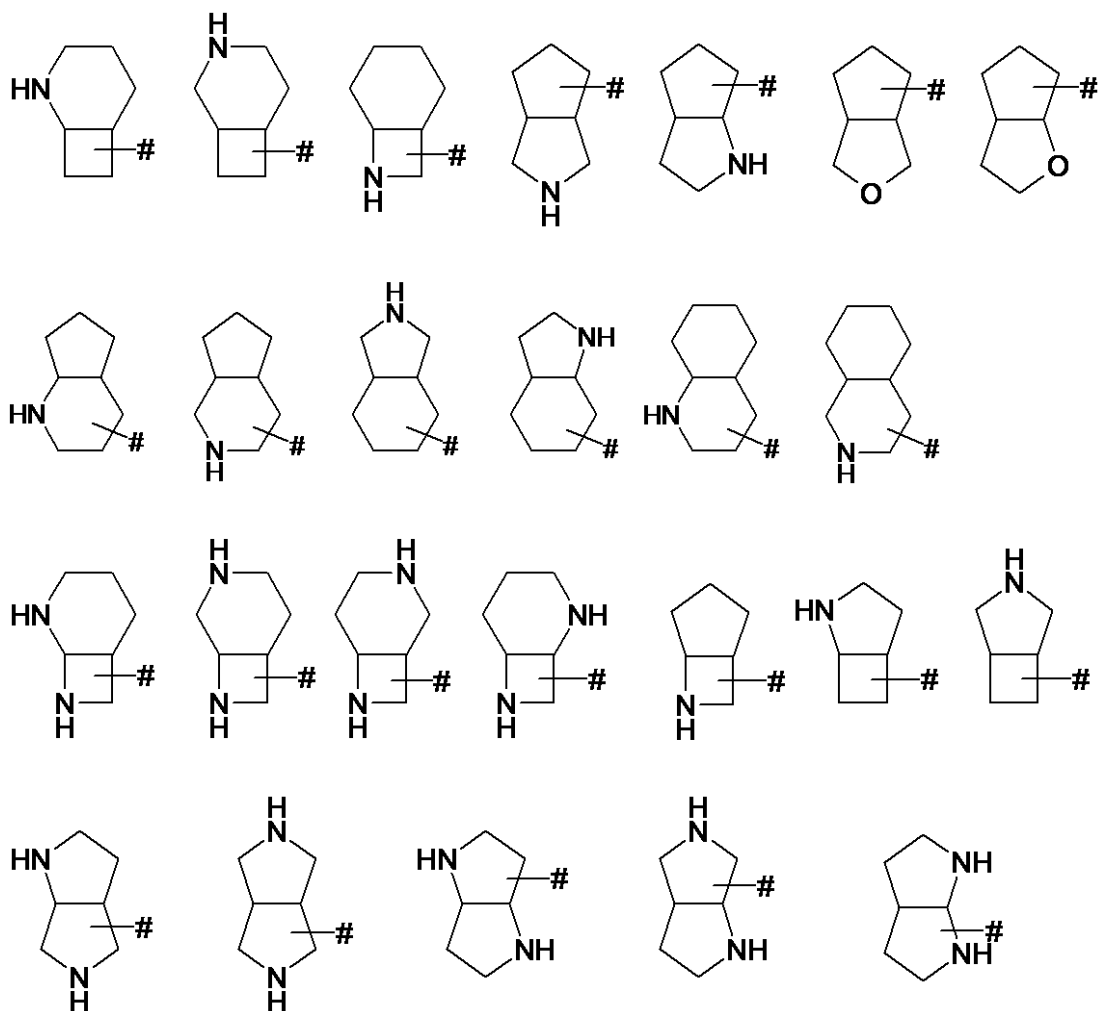
【 0 0 7 7 】

縮合系の例：

環員として、N、O、S、NO、SO 及び SO₂ から選択される 1, 2 又は 3 (又は 4
) 個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、7, 8, 9 又は 10 員の飽和複素二
 環式環の例は、以下である：

【 0 0 7 8 】

【化 2】



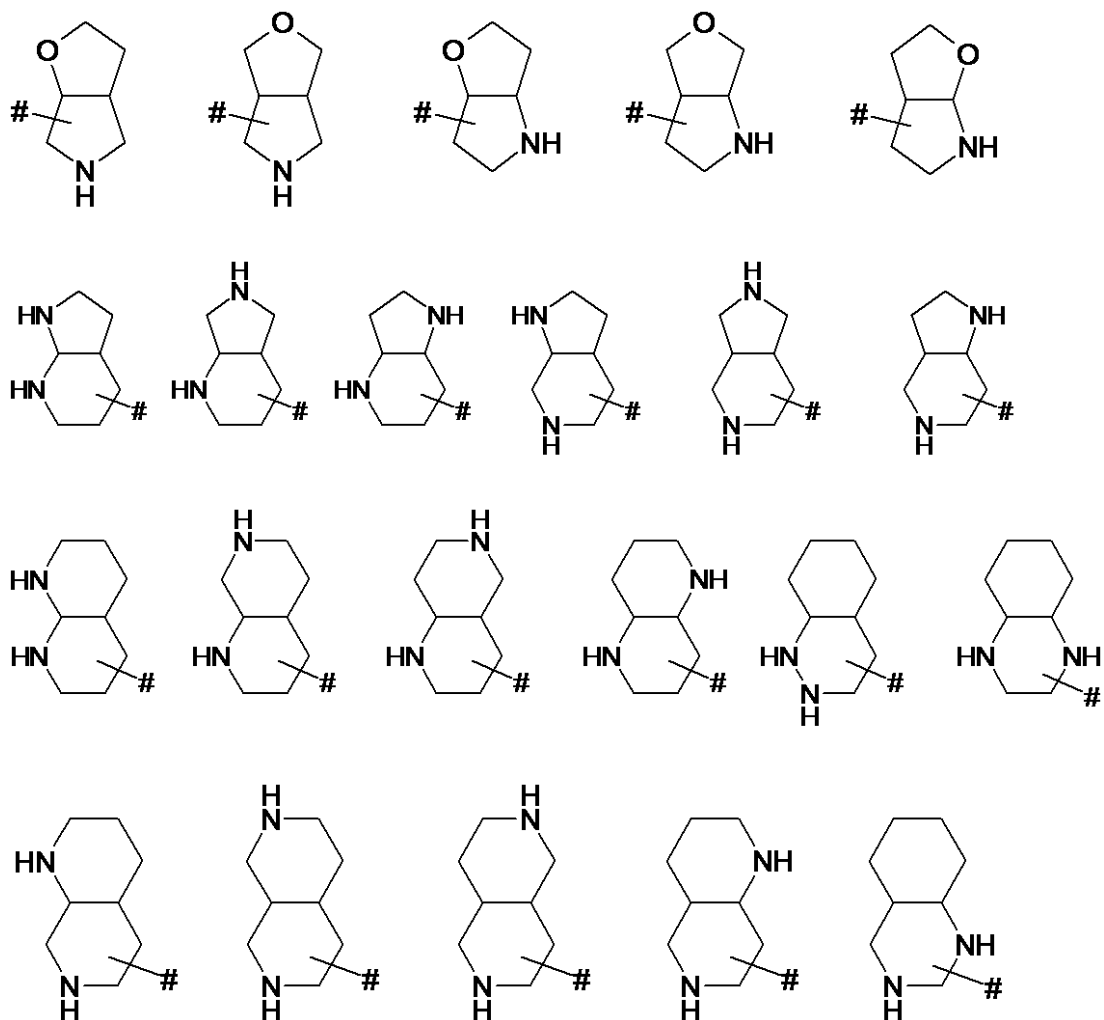
10

20

【 0 0 7 9 】

30

【化 3】



10

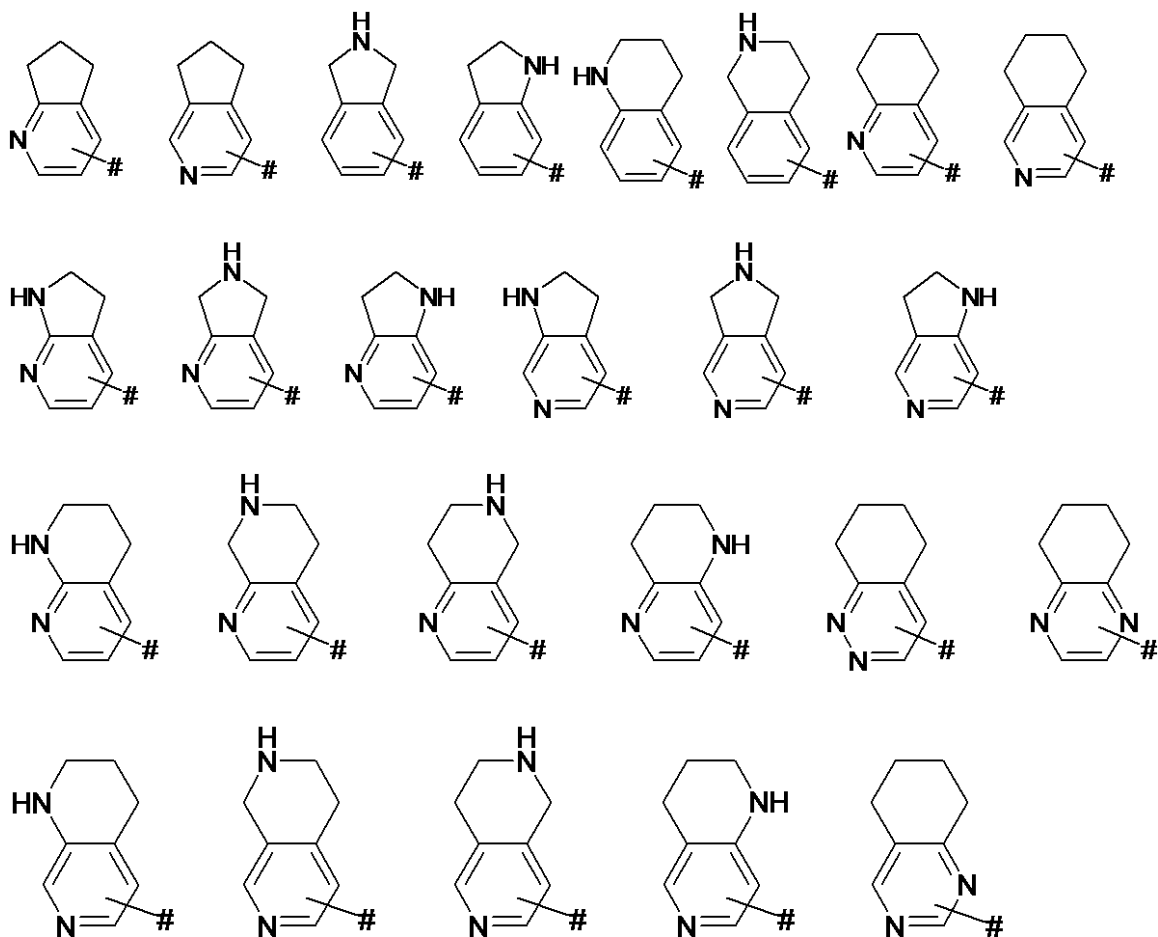
20

30

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、8、9又は10員の部分不飽和複素二環式環の例は、以下である：

【0080】

【化 4】



10

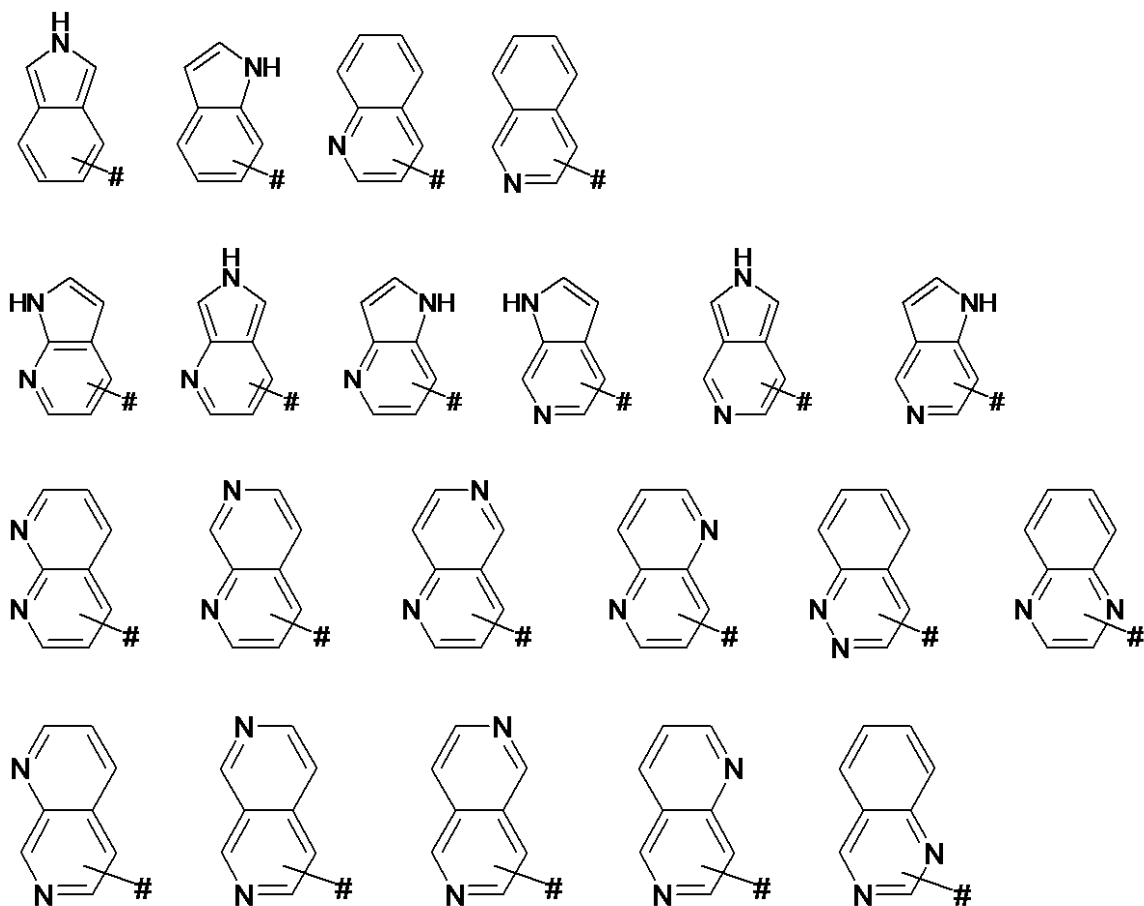
20

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、8、9又は10員の最大不飽和複素二環式環の例は、以下である：

30

【0081】

【化 5】



10

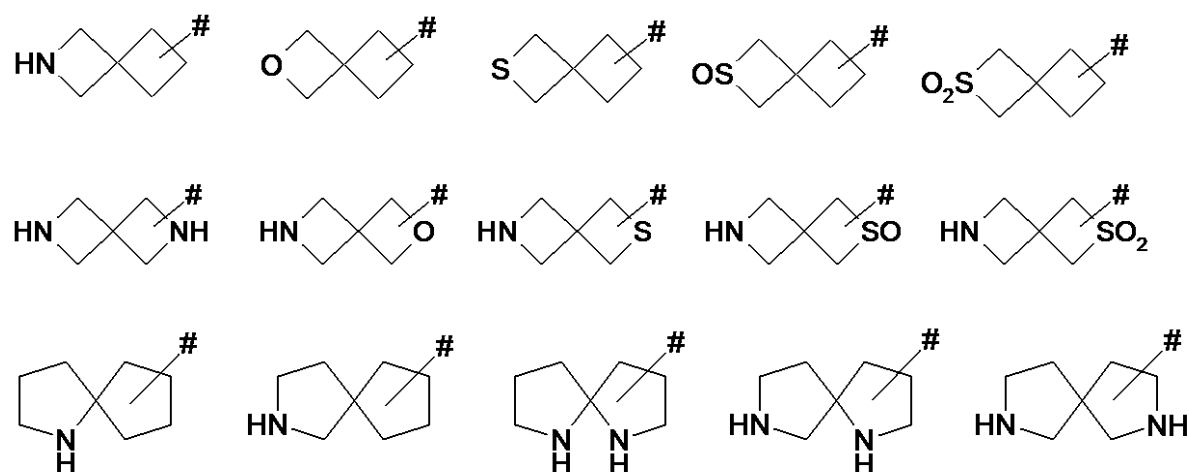
20

【0082】

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、7、8、9又は10員のスピロ結合している複素二環式環の例は、

30

【化 6】



40

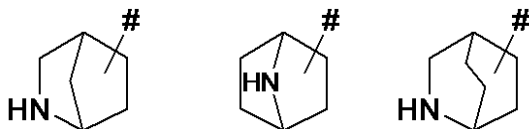
である。

【0083】

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3（又は4）個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、7、8、9又は10員の架橋複素二環式環の例は、

50

【化 7】



などである。

上記構造において、# は、分子の残部への結合点を意味する。この結合点は、示されている環上に限定されるものではないが、縮合環上のいずれかの上に存在することができ、且つ炭素環原子上又は窒素環原子上に存在することができる。この環が1つ又は複数の置換基を有する場合、これらの置換基は、炭素環原子及び/又は窒素環原子に結合することができる（後者の窒素環原子が、二重結合の一部ではない場合）。

10

上記で定義した複素単環式環又は複素二環式環が、 R^5 及び R^6 が結合している窒素原子と一緒にあって、これらにより形成されるものである場合、環員として、少なくとも1個の第二級窒素原子（すなわち、NH）を含有しており、且つ基C=Wへの結合点がこの第二級窒素原子上に存在している、上記で定義した環のものしか好適ではない（以下の、 R^5 及び R^6 の実施形態も参照されたい）。

【0084】

式Iの化合物の可変基の好ましい実施形態に関して以下に記載される注釈、とりわけこれらの置換基 B^1 、 B^2 、 B^3 、 G^1 、 G^2 、 G^3 、 G^4 、 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^{3b} 、 R^{3c} 、 R^{3d} 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{14a} 、 R^{14b} 、 R^{15} 、 R^{16} 、m及びn、本発明による使用及び方法の特徴、並びに本発明の組成物の特徴については、それら自体と、特にあらゆる可能性のある互いの組合せの両方に有効である。

20

本発明の好ましい実施形態では、 R^5 及び R^6 が結合している窒素原子と一緒にあって、これらにより形成される複素単環式環は、少なくとも1つの置換基 R^7 を必ず有している一方、 R^5 及び R^6 が結合している窒素原子と一緒にあって、これらにより形成される複素二環式環は、少なくとも1つの置換基 R^7 を有していてもよい。したがって、好ましくは、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、N、NH、SO及びSO₂から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素単環式環は、（必ず）1、2、3、4、5、6、7又は8つの置換基 R^7 により置換されており、この複素二環式環は、1、2、3、4、5、6、7又は8つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

30

【0085】

本発明の好ましい実施形態では、 R^5 及び R^6 が結合している窒素原子と一緒にあって、これらにより形成される複素環式環は単環式である。したがって、好ましくは、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5若しくは6員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、NH、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素単環式環は、1、2、3、4、5又は6、8の置換基 R^7 により置換されていてもよく（好ましくは置換されており）、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

40

【0086】

より好ましくは、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5又は6員の飽和複素単環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O及びNHから選択される1個若しくは2個、好ましくは1個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素環式環は、1、2、3、4、5又は6つの置換基 R^7 を有していてもよく（好ましくは有する）、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下

50

の好ましい意味の 1 つを有する。

【0087】

とりわけ、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、3、4、5又は6員の飽和複素単環式環を形成し、この環はさらに、環員として、1個若しくは2個のヘテロ原子含有基NHを含有していてもよく、この複素環式環は、1、2、3、4、5又は6つの置換基 R^7 を有していてもよく（好ましくは、有しており）、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0088】

R^5 及び R^6 が結合している窒素原子と一緒にあって、これらにより形成される適切な複素単環式環は、例えば、アジリジン-1-イル、ジアジリジン-1-イル、アゼチジン-1-イル、1,2-ジアゼチジン-1-イル、1,3-ジアゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イル、ピラゾリジン-1-イル、イミダゾリジン-1-イル、1,2,3-トリアゾリジン-1-イル、1,2,3-トリアゾリジン-2-イル、1,2,4-トリアゾリジン-1-イル、1,2,3-トリアゾリジン-4-イル、ピペリジン-1-イル、ヘキサヒドロピリミジン-1-イル、ピペラジン-1-イル、アゼパン-1-イル、1,4-ジアゼパン-1-イル、イソチアゾリジン-2-イル、1-オキソ-イソチアゾリジン-2-イル、1,1-ジオキソ-イソチアゾリジン-2-イル、チアゾリジン-3-イル、イソオキサゾリジン-2-イル、オキサゾリジン-3-イル、モルホリン-4-イル（モルホリノとも呼ばれる）、チオモルホリン-4-イル（チオモルホリノとも呼ばれる）、1-オキソチオモルホリン-4-イル、1,1-ジオキソチオモルホリン-4-イル、1,4-チアジナン-4-イル、1-オキソ-1,4-チアジナン-4-イル及び1,1-ジオキソ-1,4-チアジナン-4-イルである。上記の単環式環の中で、好ましいのは、アジリジン-1-イル、アゼチジン-1-イル、1,2-ジアゼチジン-1-イル、1,3-ジアゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イル、イミダゾリジン-1-イル、[1,2,4]-トリアゾリジン-1-イル、ピペリジン-1-イル、ピペラジン-1-イル、ヘキサヒドロピリミジン-1-イル、モルホリン-4-イル、チオモルホリン-4-イル、1-オキソ-1,4-チアジナン-4-イル及び1,1-ジオキソ-1,4-チアジナン-4-イルである。さらにより好ましいのは、アゼチジン-1-イル、ピロリジン-1-イル及びピペリジン-1-イルである。

10

20

30

【0089】

好ましくは、これらの複素単環式環は、1、2、3、4、5、6、7又は8つの置換基 R^7 を有する。より好ましくは、これらの複素単環式環は、1、2、3、4、5又は6つの置換基 R^7 を有する。これらの複素単環式環では、 R^7 は、互いに独立して、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

別のより好ましい実施形態では、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素二環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、N、NH、SO及びSO₂から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素二環式環は、1、2、3、4、5、6、7又は8つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

40

【0090】

この実施形態では、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、好ましくは、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素二環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、SO、SO₂、N及びNHから選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素環式環は、1、2、3又は4つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0091】

さらにより好ましくは、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、

50

7、8、9若しくは10員の飽和又は部分不飽和の複素二環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、N及びNHから選択される1個若しくは2個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素環式環は非置換であるか、又は1、2、3若しくは4つの置換基 R^7 により置換されており、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0092】

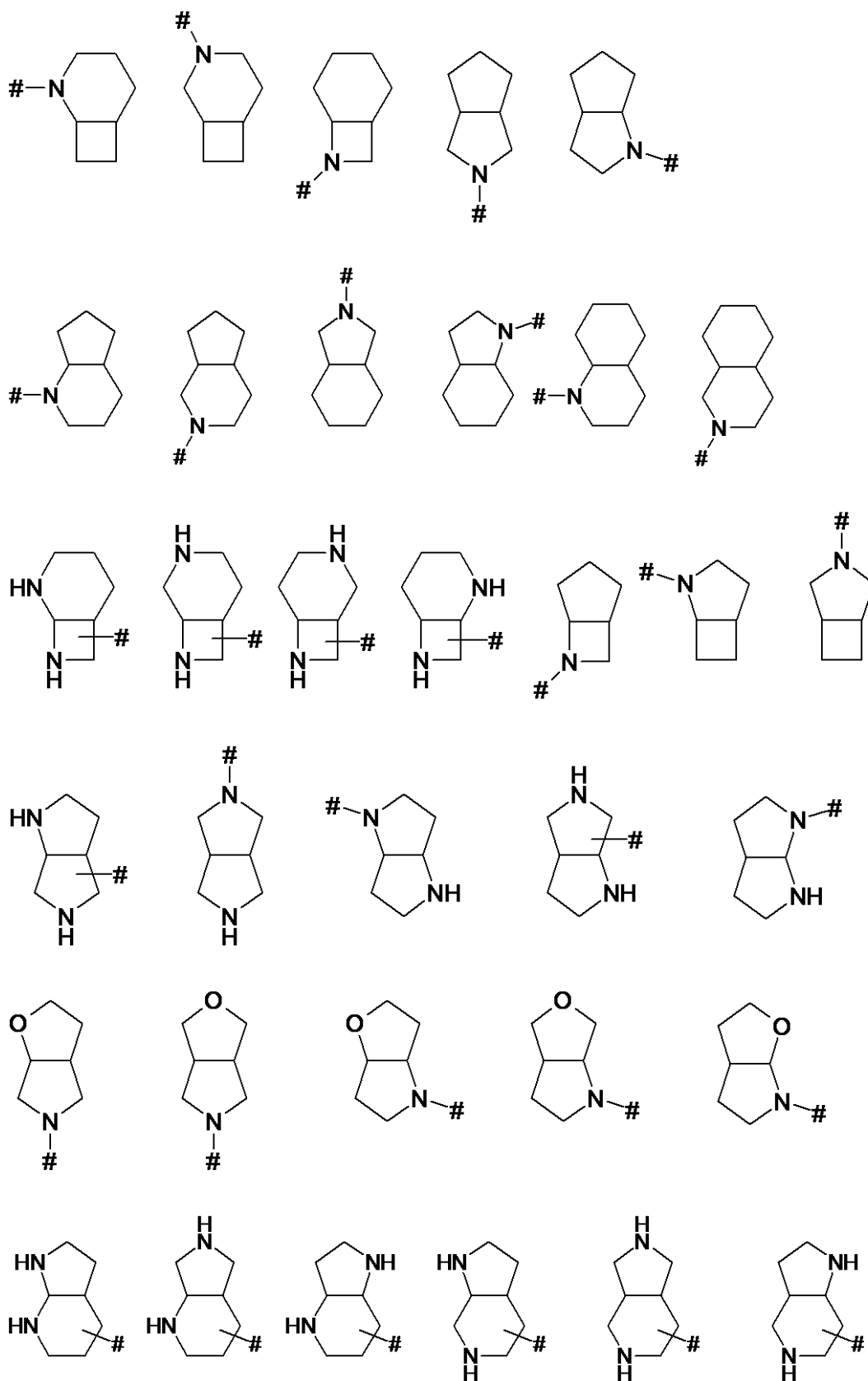
代替的なさらにより好ましい実施形態では、 R^5 及び R^6 はそれらが結合している窒素原子と一緒にあって、7、8、9又は10員の飽和複素二環式環を形成し、この環はさらに、環員として、O、S、SO、SO₂及びNHから選択される1個若しくは2個、好ましくは1個のヘテロ原子又はヘテロ原子含有基を含有していてもよく、この複素二環式環は、1、2、3又は4つ、5つ又は6つの置換基 R^7 により置換されていてもよく、 R^7 は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

10

【0093】

N、 R^5 及び R^6 により形成される適切な複素二環式環は、例えば以下である：

【化 8】



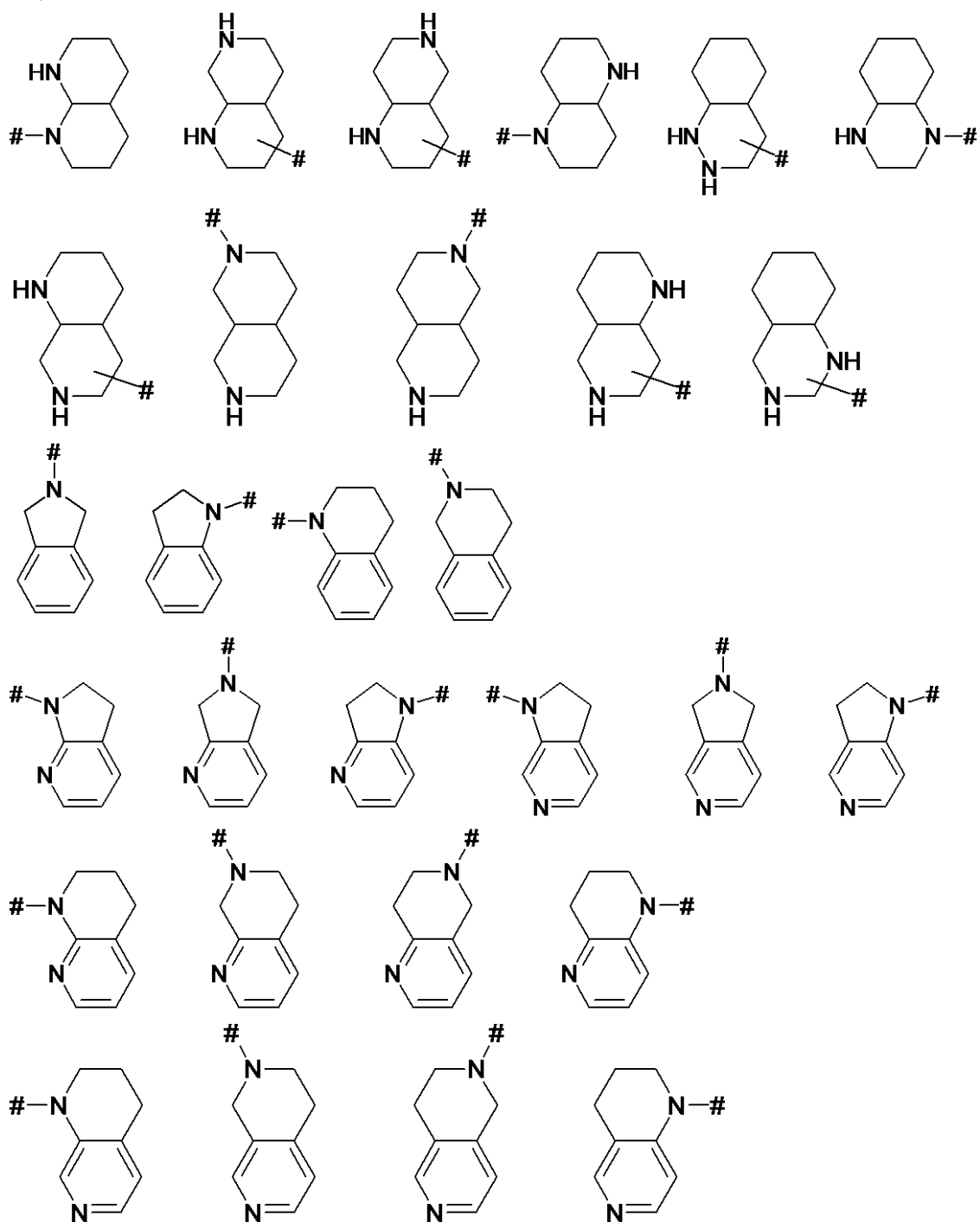
10

20

30

40

【化 9】

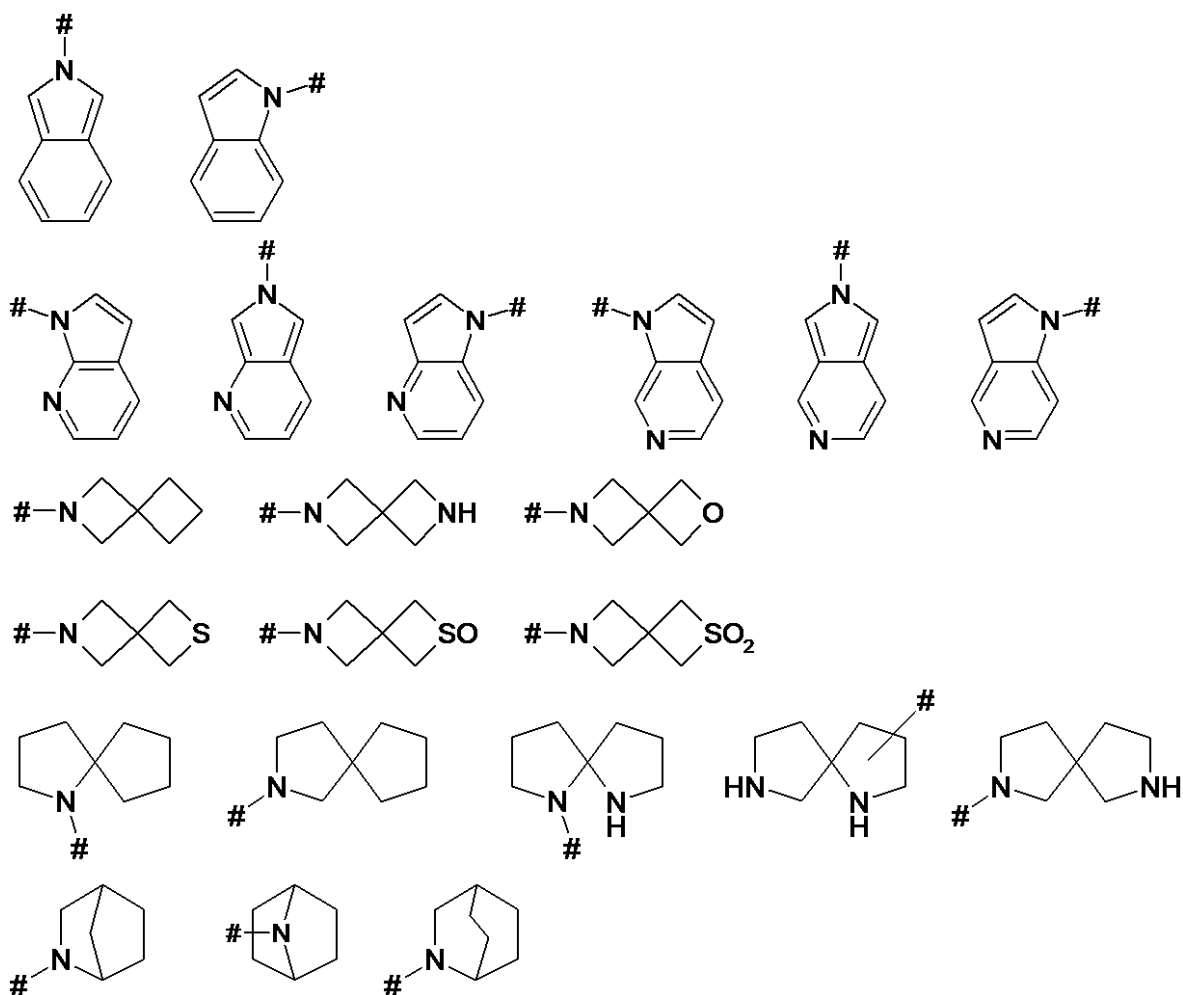


10

20

30

【化 1 0】

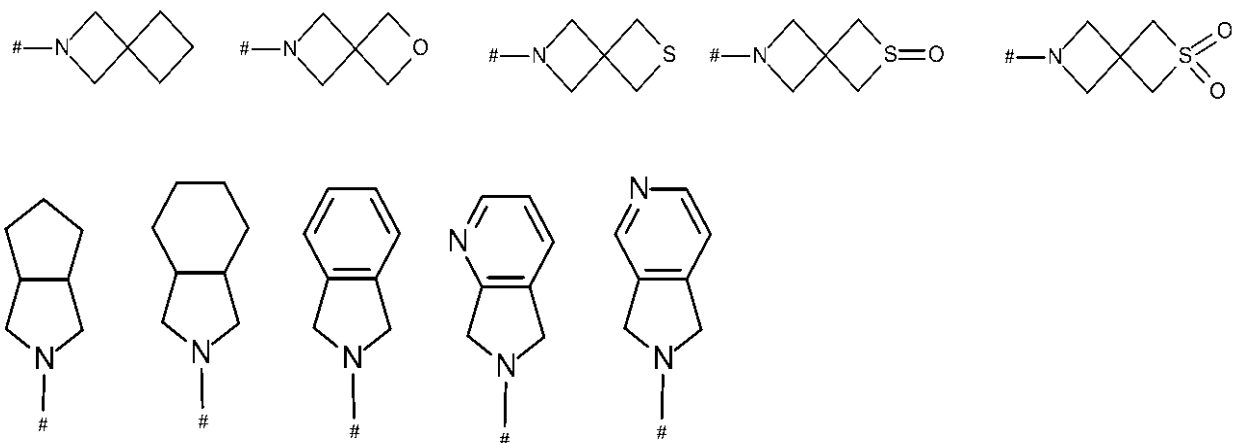


(式中、 # は、 C (= W) への結合点を意味する)。 2 個の第二級窒素原子を含有している環の一部は、非局在的な結合点を示す。この場合、この結合点は、 2 個の窒素環原子の一方に局在化している。

【 0 0 9 4 】

上記の複素二環式環の中で、好ましいのは以下である：

【化 1 1】



(式中、 # は、 $C (= W)$ への結合点を意味する)。

【 0 0 9 5 】

これらの複素二環式環は、1、2、3、4又は5つ、好ましくは1、2又は3つ、より

好ましくは1つ又は2つの置換基 R^7 を有していてもよく、 R^7 の各々は独立して、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0096】

基 R^7 は、炭素環原子上及び窒素環原子上の置換基とすることができる。 R^7 が窒素原子上の置換基である場合、 R^7 は、ハロゲン、アジド、ニトロ、 $-SCN$ 、 $-SF_5$ 、 $-Si(R^{12})_3$ 、 $-OR^9$ 及び $-OSO_2R^9$ から選択されることはなく、好ましくは、 $-S(O)_nR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ のどちらからも選択されない。

【0097】

したがって、窒素の置換基として、 R^7 は、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、

$-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、 $-C(=O)R^8$ 、

フェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{11} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環（この複素単環式環又は複素二環式環は、1つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよい）から、好ましくは、シアノ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、

$-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、 $-C(=O)R^8$ 、

フェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{11} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2、3若しくは4個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6、7、8、9若しくは10員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環又は複素二環式環から選択され、この複素単環式環又は複素二環式環は、1つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよい。

【0098】

したがって、これらの条件が、以下の R^7 の好ましい実施形態に該当する。

好ましくは、 R^7 の各々は、ハロゲン、シアノ、オキソ、 C_1-C_6 -アルキル、 C_3-C_8 -シクロアルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、 $-C(=O)R^8$ 、フェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{11} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5若しくは6員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素単環式環から独立して選択され、複素単環式環は、1つ又は複数の基 R^{11} により置換されていてもよく、 n 、 R^8 、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{11} は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0099】

R^7 が、オキソという意味を有する場合、同一炭素原子に結合している2つの基 R^7 が、基 $=O$ を形成するのは自明である。 R^7 が、 $=S$ という意味を有する場合、同一炭素原子に結合している2つの基 R^7 が、基 $=S$ を形成するのもやはり自明である。

【0100】

10

20

30

40

50

より好ましくは、 R^7 の各々は、ハロゲン、シアノ、オキソ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル（言及した最後の8つの置換基は、基 R^8 を有していてもよい）、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_6$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_6$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキルスルホニル、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ 、及び $-C(=O)R^8$ から独立して選択され、 R^8 、 R^{10a} 及び R^{10b} は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

10

【0101】

R^7 において、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル又は $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル基などの脂肪族又は脂環式基上の置換基としての基 R^8 は、好ましくは、シアノ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（CN、メチル及びオキソから選択される1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ 、 $-C(=O)OR^9$ 、フェニル（1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい）、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される、1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環から選択され、複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよく、 n 、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。より好ましくは、 R^8 は、シアノ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル（CN、メチル及びオキソから選択される、1つ又は2つの置換基により置換されていてもよい）、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル及び $-OR^9$ から選択される。

20

【0102】

R^7 に関して好ましい意味としての基 $C(=O)R^8$ では、基 R^8 は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から選択され、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。この実施形態では、 R^8 は、より好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から選択され、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。さらにより好ましくは、 R^8 は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_2$ -アルキル-、とりわけ $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- CH_2 -、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_2$ -アルキル-、とりわけ $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- CH_2 -（言及した最後の6つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から選択され、 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} は、上記の一般的な意味の1

30

40

50

つ、又は特に以下の好ましい意味の 1 つを有する。特に、 R^8 は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ から選択され、 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} は、上記の一般的な意味の 1 つ、又は特に以下の好ましい意味の 1 つを有する。

【0103】

R^7 に関する好ましい意味としての $-OR^9$ 、 $-S(O)_nR^9$ 又は $-C(=O)OR^9$ において、基 R^9 は、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環(複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよい)から、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル及び $C_1 - C_6$ -ハロアルキルから選択され、

R^{16} の各々は、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル及び $C_2 - C_4$ -ハロアルキニルからなる群から独立して選択されるか、又は飽和環の同一炭素原子上に存在している2つの R^{16} は、一緒になって $=O$ 又は $=S$ を形成してもよい。特に、 R^9 は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル及び $C_1 - C_6$ -ハロアルキルから選択され、具体的には、 $C_1 - C_6$ -アルキルである。

【0104】

R^7 の好ましい意味としての、 $-NR^{10a}R^{10b}$ 、 $-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}$ において、又は $-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}$ において、基 R^{10a} 及び R^{10b} は、互いに独立して、好ましくは、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル- (言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、

$C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-C(=O)R^{13}$ 、 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及び SO_2 から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環から選択され、この複素環式環は、1つ又は複数の置換基 R^{16} により置換されていてもよく、

R^{13} 、 R^{14a} 、 R^{14b} 及び R^{16} は、上記の一般的な意味の 1 つ、又は特に好ましい意味の 1 つを有する。

【0105】

より好ましくは、

R^{10a} は、水素又はメチルであり、

R^{10b} は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル- (言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-C(=O)R^{13}$ 、 $-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5つの置換基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに

環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和又は最大不飽和の複素環式環から選択され、この複素環式環は、1つ又は複数の置換基R¹⁶により置換されていてもよく、

R¹³、R^{14a}、R^{14b}及びR¹⁶は、上記の一般的な意味の1つを有するか、又は特にR¹⁶は、上記の好ましい意味の1つを有し、且つR¹³、R^{14a}及びR^{14b}は、以下の好ましい意味の1つを有する。

【0106】

さらにより好ましくは、

R^{10a}は水素であり、

R^{10b}は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、CN基を有するC₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-、C₃-C₈-ハロシクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい）、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、-C(=O)R¹³、及び-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}から選択され、

R¹³、R^{14a}及びR^{14b}は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0107】

特に、

R^{10a}は水素であり、

R^{10b}は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、CN基を有するC₁-C₆-アルキル、C₃-C₈-シクロアルキル、C₃-C₈-ハロシクロアルキル、C₃-C₈-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-、C₃-C₈-ハロシクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい）、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、及びC₂-C₆-ハロアルキニルから選択される。

【0108】

特に、

R^{10a}は水素であり、

R^{10b}は、-C(=O)R¹³及び-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}から選択され、

R¹³、R^{14a}及びR^{14b}は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

或いは、特に、

R^{10a}は、水素又はメチル、好ましくは水素であり、

R^{10b}は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、-C(=O)R¹³及び-C(=O)N(R^{14a})R^{14b}から選択され、

R¹³、R^{14a}及びR^{14b}は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0109】

上記の基R^{10a}及びR^{10b}において、

R¹³は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-ハロアルケニル、C₂-C₆-アルキニル、C₂-C₆-ハロアルキニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル-C₁-C₄-アルキル-（言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）、CN基により置換されているC₁-C₆-アルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシから好ましくは選択される。

【0110】

具体的には、上記の基R^{10a}及びR^{10b}において、

R¹³は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-ハロアルキル、C₂-C₆-アルケニル、

C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい)、及びCN基により置換されているC₁ - C₆ - アルキルから選択される。

代替的な特定の実施形態では、上記の基 R^{10a} 及び R^{10b} おいて、

R¹³ は、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル (言及した最後の2つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい)、C₁ - C₄ - アルコキシ - C₁ - C₄ - アルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ及びC₁ - C₄ - ハロアルコキシから選択される。

10

【0111】

上記の基 R^{10a} 及び R^{10b} おいて、

R^{14a} は、水素及びC₁ - C₆ アルキルから好ましくは選択され、

R^{14b} は、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₂ - C₆ - アルケニル、C₂ - C₆ - ハロアルケニル、C₂ - C₆ - アルキニル、C₂ - C₆ - ハロアルキニル、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい)、及びCN基により置換されているC₁ - C₆ - アルキルから好ましくは選択される。

或いは、上記の基 R^{10a} 及び R^{10b} おいて、

20

R^{14a} は、水素及びC₁ - C₆ アルキルから好ましくは選択され、

R^{14b} は、水素、C₁ - C₆ - アルキル及びC₁ - C₆ - ハロアルキルから好ましくは選択される。

【0112】

より好ましくは、R⁷ は、ハロゲン、シアノ、オキソ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、CN基を有するC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - 、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル - C₁ - C₄ - アルキル - (言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、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、- NR^{10a} NR^{10b}、- C(=O)N(R^{10a})R^{10b}、及び- C(=O)R⁸から選択され、R⁸、R^{10b} 及びR^{10b} は、上記の一般的な意味の1つを有するか、又は特に上記の好ましい意味の1つを有する。さらに好ましくは、R⁷ は、ハロゲン、シアノ、オキソ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、- N(R^{10a})R^{10b}、- C(=O)N(R^{10a})R^{10b}、及び- C(=O)R⁸から選択され、R⁸、R^{10b} 及びR^{10b} は、上記の一般的な意味の1つを有するか、又は特に上記の好ましい意味の1つを有する。

30

【0113】

特に、R⁷ は、フッ素、シアノ、オキソ、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、CF₃、CH₂CHF₂、CH₂CHF₂、CH₂CF₃、シアノ基により置換されているC₁ - C₄ - アルキル、シクロプロピル、シクロブチル、シアノ基により置換されているシクロプロピル、シアノ基により置換されているシクロブチル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₆ - シクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル - 、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル - C₁ - C₆ - アルキル - (言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)、アリル、プロパルギル、- NH C(=O)R¹³、- NH C(=O)N(R^{14a})R^{14b}、- C(=O)NHR^{10b} 及び- C(=O)R⁸から選択され、

40

R⁸ は、水素、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、CN基を有するC₁ - C₆ - アルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、C₃ - C₈ - シクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル - 、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル - C₁ - C₂ - アルキル - (言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい)

50

)、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ であり、 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} は、好ましい意味の1つを有し、

R^{13} は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）、 CN 基により置換されている $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシであり、

R^{10b} は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 CN 基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、 CN 基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、及び $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルから選択される。

【0114】

とりわけ、 R^7 は、フッ素、シアノ、オキソ、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、 CF_3 、 CH_2CHF_2 、 CH_2CHF_2 、 CH_2CF_3 、シアノ基により置換されている $C_1 - C_4$ -アルキル、シクロプロピル、シクロブチル、シアノ基により置換されているシクロプロピル、シアノ基により置換されているシクロブチル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_2$ -アルキル-、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_6$ -アルキル-（言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、 CN 基を有していてもよい）、アリル、プロパルギル、 $-NHC(=O)R^{13}$ 、 $-C(=O)NHR^{10b}$ 及び $-C(=O)R^8$ から選択され、

R^8 は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 CN 基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_2$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_2$ -アルキル-（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、 CN 基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $-OR^9$ 及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ であり、 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} は、好ましい意味の1つを有し、

R^{13} は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の3つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）及び CN 基により置換されている $C_1 - C_6$ -アルキルであり、 R^{10b} は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 CN 基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル-（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、 CN 基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、及び $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルから選択される。

【0115】

代替的な特定の実施形態では、 R^7 は、フッ素、シアノ、オキソ、メチル、エチル、 n -プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、 CF_3 、 CH_2CHF_2 、 CH_2CHF_2 、 CH_2CF_3 、 $-NHC(=O)R^{13}$ 、 $-NHC(=O)N(R^{14a})R^{14b}$ 、 $-C(=O)NHR^{10b}$ 及び $-C(=O)R^8$ から選択され、

R^8 は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、又は $-OR^9$ 、及び $-N(R^{10a})R^{10b}$ であり、 R^9 は、上記の好ましい意味の1つを有しており、特に、 $C_1 - C_6$ -アルキル又は $C_1 - C_6$ -ハロアルキルであり、

R^{13} は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル（言及した最後の2つの基中のシクロアルキル部分は、シアノ基により置換されていてもよい）、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシであり、

R^{10b} は、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、CN基を有する $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル- $C_1 - C_4$ -アルキル（言及した最後の4つの基中のシクロアルキル部分は、CN基を有していてもよい）、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル、及び $C_2 - C_6$ -ハロアルキニルから選択され、

R^{14a} は、水素及び $C_1 - C_6$ アルキルから選択され、

R^{14b} は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル及び $C_1 - C_6$ -ハロアルキルから選択される。

【0116】

本発明の好ましい実施形態では、WはOである。

好ましくは、 B^1 、 B^2 及び B^3 は CR^2 である。より好ましくは、 B^1 及び B^3 は CR^2 であり、 R^2 は水素ではなく、 B^2 は CR^2 であり、 R^2 は上で与えられている意味の1つを有する。

【0117】

好ましくは、 R^2 は、水素、ハロゲン、シアノ、アジド、ニトロ、-SCN、 SF_5 、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_2 - C_6$ -アルケニル、 $C_2 - C_6$ -アルキニル（言及した最後の4つの脂肪族及び脂環式基は、部分的若しくは完全にハロゲン化されていてもよく、且つ/又は1つ若しくは複数の基 R^8 により置換されていてもよい）、-OR⁹、-S(O)_nR⁹及び-NR^{10a}R^{10b}から選択され、
n、 R^8 、 R^9 、 R^{10a} 及び R^{10b} は、上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

【0118】

より好ましくは、 R^2 は、水素、ハロゲン及び $C_1 - C_2$ -ハロアルキルから、好ましくは、水素、F、Cl、Br及びCF₃から選択される。

特定の実施形態では、 B^1 及び B^3 はC-Clであり、 B^2 はC-Fである。さらなる特定の実施形態では、 B^1 及び B^3 はC-CF₃であり、 B^2 はC-Hである。さらなる特定の実施形態では、 B^1 及び B^3 はC-Brであり、 B^2 はC-Fである。さらなる特定の実施形態では、 B^1 、 B^2 及び B^3 はC-Clである。さらなる特定の実施形態では、 B^1 はC-Clであり、 B^2 はC-Hであり、 B^3 はC-CF₃である。さらなる特定の実施形態では、 B^1 はC-Brであり、 B^2 はC-Hであり、 B^3 はC-CF₃である。具体的には、 B^1 及び B^3 はC-Clであり、 B^2 はC-Fである。

【0119】

好ましくは、 G^1 、 G^2 、 G^3 及び G^4 は CR^4 であり、 R^4 は上又は下で与えられている意味の1つを有する。同様に、好ましくは、 G^1 、 G^3 及び G^4 は CR^4 であり、 G^2 はNであり、 R^4 は上又は下で与えられている意味の1つを有する。同様に、好ましくは、 G^2 、 G^3 及び G^4 は CR^4 であり、 G^1 はNであり、 R^4 は上又は下で与えられている意味の1つを有する。より好ましくは、 G^1 、 G^3 及び G^4 はCHであり、 G^2 は CR^4 であり、 R^4 は上記の一般的な意味の1つ、又は特に以下の好ましい意味の1つを有する。

好ましくは、 R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_5$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_5$ -ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオから選択され、好ましくは水素、ハロゲン及びメチルから選択される。

【0120】

好ましくは、 R^1 は、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル及び-C(=O)

10

20

30

40

50

OR¹⁵から選択され、特に好ましくは、C₁ - C₄ - ハロアルキル及び - C(=O)OR¹⁵から選択され、R¹⁵は、好ましくはC₁ - C₄ - アルキルである。特に、R¹は、C₁ - C₄ - ハロアルキル、具体的にはC₁ - C₂ - ハロアルキル、又は - C(=O)OR¹⁵であり、R¹⁵はC₁ - C₄ - アルキルである。より具体的には、R¹はハロメチル、特に、フルオロメチルなどのフルオロメチル、ジフルオロメチル及びトリフルオロメチルであり、非常に具体的には、トリフルオロメチルである。

【0121】

好ましくは、R^{3a}及びR^{3b}は、互いに独立して、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、C₁ - C₃ - アルキル、C₂ - C₃ - アルケニル、C₂ - C₃ - アルキニル、C₁ - C₃ - ハロアルキル、C₁ - C₃ - アルコキシ、C₁ - C₃ - アルキルチオ及びC₁ - C₃ - アルキルスルホニルから選択される。より好ましくは、R^{3a}及びR^{3b}は、互いに独立して、水素及びハロゲン、好ましくは、水素及びフッ素から選択され、特に水素である。

10

【0122】

特に上で指定しない場合、R⁸、R⁹、R^{10a}、R^{10b}、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁵及びR¹⁶は、以下の好ましい意味を有する。

R⁸がアルキル、アルケニル、又はアルキニル基上の置換基である場合、R⁸は、シアノ、C₃ - C₈ - シクロアルキル、C₃ - C₈ - ハロシクロアルキル、-OR⁹、-SR⁹、-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=O)OR⁹、フェニル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁶により置換されていてもよい)、並びに環員としてN、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している、3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の基R¹⁶により置換されていてもよい)からなる群から好ましくは選択され、R⁹、R^{10a}、R^{10b}及びR¹⁶は、上で与えられている意味の1つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の1つを有する。

20

【0123】

R⁸がアルキル、アルケニル又はアルキニル基上の置換基である場合、R⁸は、シアノ、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、C₁ - C₄ - アルコキシ、C₁ - C₄ - ハロアルコキシ、C₁ - C₄ - アルキルチオ、C₁ - C₄ - ハロアルキルチオ、-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=O)OR⁹、フェニル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁶により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の基R¹⁶により置換されていてもよい)からなる群からさらに好ましくは選択され、R⁹、R^{10a}、R^{10b}及びR¹⁶は、上で与えられている意味の1つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の1つを有する。特に、R⁸は、シアノ、C₃ - C₆ - シクロアルキル、C₃ - C₆ - ハロシクロアルキル、-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=O)OR⁹、フェニル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁶により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の基R¹⁶により置換されていてもよい)からなる群から選択され、R⁹、R^{10a}、R^{10b}及びR¹⁶は、上で与えられている意味の1つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の1つを有する。

30

40

R⁸がシクロアルキル基上の置換基である場合、R⁸は、シアノ、C₁ - C₆ - アルキル、C₁ - C₆ - ハロアルキル、C₁ - C₆ - アルコキシ、C₁ - C₆ - アルキル、-OR⁹、-OSO₂R⁹、-SR⁹、-N(R^{10a})R^{10b}、-C(=O)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=S)N(R^{10a})R^{10b}、-C(=O)OR⁹、フェニル(1、2、3、4又は5つの基R¹⁶により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複

50

数の基 R^{16} により置換されていてもよい) からなる群から好ましくは選択され、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} は、上で与えられている意味の 1 つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の 1 つを有する。

【0124】

R^8 がシクロアルキル基上の置換基である場合、 R^8 は、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_3$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルコキシ及び $C_1 - C_3$ - ハロアルコキシからなる群からさらに好ましくは選択される。特に、シクロアルキル基上の置換基としての R^8 は、シアノ、 $C_1 - C_4$ - アルキル、及び $C_1 - C_3$ - ハロアルキルから選択される。

【0125】

基 - $C(=O)R^8$ 、 $=C(R^8)_2$ 、又は - $C(=NR^6)R^8$ 中の R^8 の場合、 R^8 は、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ - $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_6$ - アルキニル、 $C_2 - C_6$ - ハロアルキニル、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5つの基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の基 R^{16} により置換されていてもよい) からなる群から好ましくは選択され、 R^9 、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} は、上で与えられている意味の 1 つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の 1 つを有する。

10

20

【0126】

基 - $C(=O)R^8$ 、 $=C(R^8)_2$ 、又は - $C(=NR^6)R^8$ 中の R^8 の場合、 R^8 は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、 $C_1 - C_6$ - ハロアルコキシ、 $-N(R^{10a})R^{10b}$ 、フェニル(1、2、3、4又は5つの基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の基 R^{16} により置換されていてもよい) からなる群からより好ましくは選択され、 R^{10a} 、 R^{10b} 及び R^{16} は、上で与えられている意味の 1 つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の 1 つを有する。

30

【0127】

好ましくは、 R^9 の各々は、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - ハロシクロアルキル、 $C_3 - C_8$ - シクロアルキル - $C_1 - C_4$ - アルキル、フェニル(1、2、3、4又は5つの基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2又は3個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含有している3、4、5、6又は7員の飽和、部分不飽和又は芳香族複素環式環(この複素環式環は、1つ又は複数の、例えば、1、2、3又は4つ、好ましくは1つ又は2つ、より好ましくは1つの基 R^{16} により置換されていてもよい) からなる群から独立して選択され、 R^{16} は、上で与えられている意味の 1 つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の 1 つを有する。

40

より好ましくは、 R^9 の各々は、水素、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、フェニル(1、2、3、4又は5つの基 R^{16} により置換されていてもよい)、並びに環員としてN、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有している5員又は6員の複素芳香族環(この複素芳香族環は、1つ又は複数の基 R^{16} により置換されていてもよい) からなる群から独立して選択され、 R^{16} は、上で与えられている意味の 1 つ、又は特に以下で与えられる好ましい意味の 1 つを有する。

【0128】

R^{10a} 及び R^{10b} は、水素、 $C_1 - C_4$ - アルキル、 $C_1 - C_4$ - ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ - アルケニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ - アルキニル、 $C_2 - C_4$ - ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ - シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ - ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ - アルキル

50

カルボニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルカルボニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルアミノカルボニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキルアミノカルボニル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキルアミノカルボニル、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1、2若しくは3個のヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含む、3、4、5、6若しくは7員の飽和、部分不飽和若しくは最大不飽和の複素環式環（この複素環式環は、ハロゲン、CN、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオから選択される1つ又は複数、好ましくは1、2又は3つ、特に1つの置換基により、置換されていていてもよい）から互いに独立して好ましくは選択されるか、

又は、R^{10a}及びR^{10b}は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、5員若しくは6員の飽和、部分不飽和若しくは芳香族複素環式環を形成し、複素環式環はさらに、環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個若しくは2個のさらなるヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有していてもよく、ハロゲン、CN、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオから選択される1つ又は2つ、特に1つの置換基を有していてもよい。

【0129】

より好ましくは、R^{10a}及びR^{10b}は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、並びに環員として、N、O、S、NO、SO及びSO₂から選択される1個のヘテロ原子又はヘテロ原子基を含む3員又は4員の飽和複素環式環から、互いに独立して選択され（この複素環式環は、ハロゲン、CN、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される1つ又は複数、好ましくは1、2又は3つ、特に1つの置換基により置換されていていてもよい）、具体的には、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルキルから互いに独立して選択される。

【0130】

各R¹¹及び各R¹⁶は、出現毎に独立して、且つ互いに独立して、好ましくはハロゲン、CN、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル及び $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルホニルから、より好ましくはハロゲン、CN、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される。

R¹²の各々は、 $C_1 - C_4$ -アルキルから好ましくは選択され、特にメチルである。

【0131】

R¹³がアルキル、アルケニル、又はアルキニル基上の置換基である場合、R¹³は、シアノ、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、-OH、-SH、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルホニル及びフェニル（ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される、1、2又は3つの基により置換されていていてもよい）からなる群から好ましくは選択される。

R¹³がシクロアルキル基上の置換基である場合、R¹³は、シアノ、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル

10

20

30

40

50

、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシ、 $C_1 - C_4$ -アルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルチオ、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルフィニル、 $C_1 - C_4$ -アルキルスルホニル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキルスルホニル及びフェニル（ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される、1、2又は3つの基により置換されていてよい）からなる群から好ましくは選択される。

【0132】

R^{13} がシクロアルキル基上の置換基である場合、 R^{13} は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_3$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_3$ -ハロアルコキシからなる群からさらに好ましくは選択される。特に、シクロアルキル基上の置換基としての R^{13} は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、及び $C_1 - C_3$ -ハロアルキルから選択される。

10

基 $-C(=O)R^{13}$ 、 $-C(=S)R^{13}$ 、 $=C(R^{13})_2$ 、又は $-C(=NR^{14})R^{13}$ 中の R^{13} の場合、 R^8 は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_8$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_8$ -ハロシクロアルキル、 $-OH$ 、 $-SH$ 、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、 $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシ、及びフェニル（ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される、1、2又は3つの基により置換されていてよい）からなる群から好ましくは選択される。

20

【0133】

R^{14} 、 R^{14a} 及び R^{14b} は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_2 - C_4$ -アルケニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルケニル、 $C_2 - C_4$ -アルキニル、 $C_2 - C_4$ -ハロアルキニル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル及びベンジルから互いに独立して好ましくは選択され、ベンジル中のフェニル環は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される1、2又は3つ、特に1つの置換基により置換されていてよいが、

又は、 R^{14a} 及び R^{14b} は、それらが結合している窒素原子と一緒に、5員若しくは6員の飽和、部分不飽和若しくは芳香族複素環式環を形成し、この複素環式環はさらに、環員として、 N 、 O 、 S 、 NO 、 SO 及び SO_2 から選択される1個若しくは2個のさらなるヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有していてもよく、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される1つ若しくは2つ、特に1つの置換基を有していてもよい。

30

【0134】

より好ましくは、 R^{14} 、 R^{14a} 及び R^{14b} は、水素、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_3 - C_6$ -シクロアルキル、 $C_3 - C_6$ -ハロシクロアルキル、及びベンジルから互いに独立して選択され、ベンジル中のフェニル環は、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される1、2又は3つ、特に1つの置換基により置換されていてよいが、

又は、

40

R^{14a} 及び R^{14b} は、それらが結合している窒素原子と一緒に、5員若しくは6員の飽和、部分不飽和若しくは芳香族複素環式環を形成し、この複素環式環はさらに、環員として、 N 、 O 、 S 、 NO 、 SO 及び SO_2 から選択される1個若しくは2個のさらなるヘテロ原子若しくはヘテロ原子基を含有していてもよく、ハロゲン、 $C_1 - C_4$ -アルキル、 $C_1 - C_4$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_4$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_4$ -ハロアルコキシから選択される1つ若しくは2つ、特に1つの置換基を有していてもよい。

R^{15} の各々は、水素、 $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、フェニル、ベンジル、ピリジル、及びフェノキシから好ましくは選択され、言及した最後の4つの基は非置換であってもよく、且つ/又は $C_1 - C_6$ -アルキル、 $C_1 - C_6$ -ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ -アルコキシ、及び $C_1 - C_6$ -ハロアルコキシから選択される1、2若しくは3つの

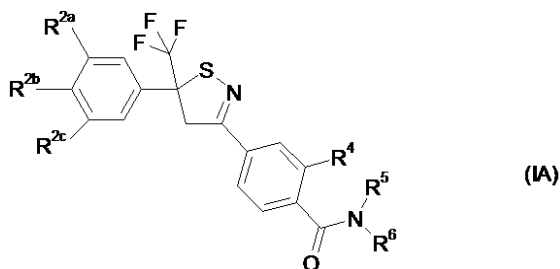
50

置換基を有する。

本発明の特定の実施形態では、化合物 I は式 I A の化合物、すなわち、式 I の化合物であり、 B^1 は CR^{2a} であり、 B^2 は CR^{2b} であり、 B^3 は CR^{2c} であり、 R^1 は CF_3 であり、 R^{3a} 及び R^{3b} は、それぞれ水素であり、 G^1 は $C-H$ であり、 G^3 は $C-H$ であり、 G^4 は $C-H$ であり、 G^2 は $C-R^4$ であり、

【0135】

【化12】



10

R^4 、 R^5 及び R^6 は、上で与えられている一般的な意味の 1 つ、又は特に上で与えられている好ましい意味の 1 つを有し、 R^{2a} 、 R^{2b} 及び R^{2c} は、互いに独立して、一般的な意味の 1 つ、又は特に R^2 に関して上で与えられている好ましい意味の 1 つを有しているが、 R^{2a} 及び R^{2c} が Cl であり、同時に、 R^{2b} が H であり、 R^4 が F 、 Cl 、 CH_3 又は SCH_3 であり、 R^5 及び R^6 がそれらが結合している窒素原子と一緒に、非置換のアジリジン - 1 - イル、非置換のアゼチジン - 1 - イル、非置換のピロリジン - 1 - イル、非置換のピペリジン - 1 - イル、非置換のチアゾリジン - 3 - イル、非置換のモルホリン - 4 - イル、非置換のチオモルホリン - 4 - イル、非置換の 1 - オキシ - 1, 4 - チアジナン - 4 - イル及び非置換の 1, 1 - ジオキシ - 1, 4 - チアジナン - 4 - イルから選択される環を形成する化合物 I A は除外する。

20

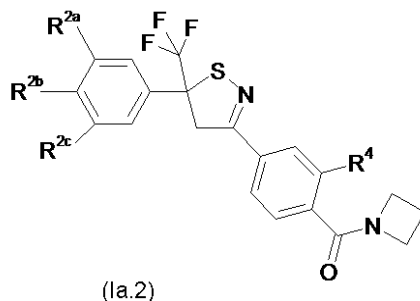
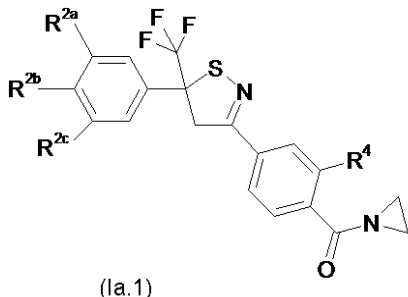
【0136】

好ましい化合物の例は、以下の式 I a . 1 ~ I a . 52 の化合物であり、可変基は、一般的な意味の 1 つ、又は上で示された好ましい意味の 1 つを有する。好ましい化合物の例は、以下の表 1 ~ 265 にまとめた個々の化合物であり、さらには、表中の個々の可変基に関して以下に言及する意味は、それらについて言及されている組合せとそれ自体独立して、対象となる置換基の特に好ましい実施形態である。

30

【0137】

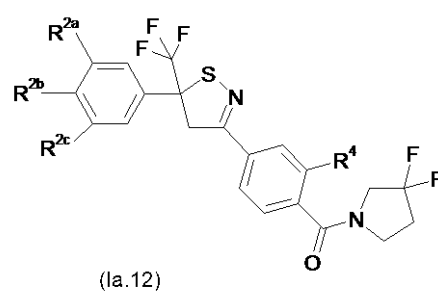
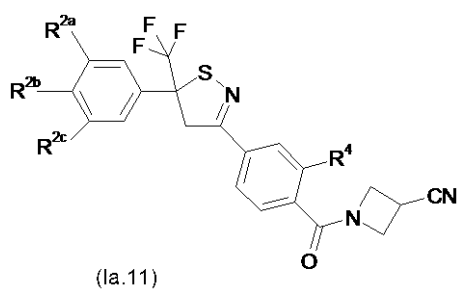
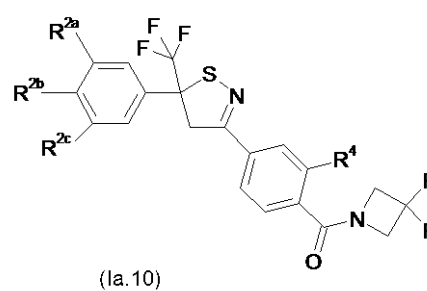
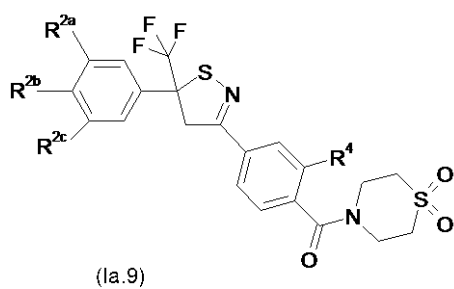
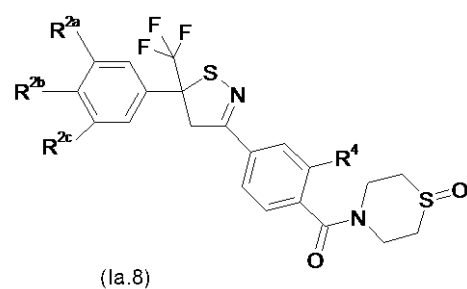
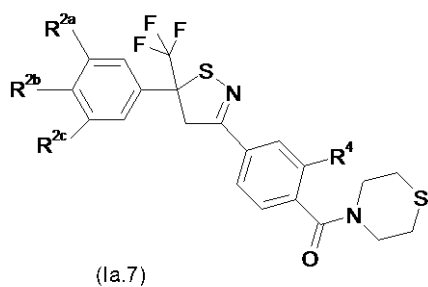
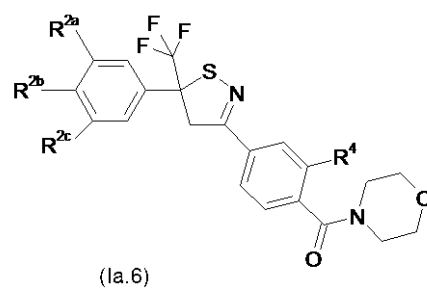
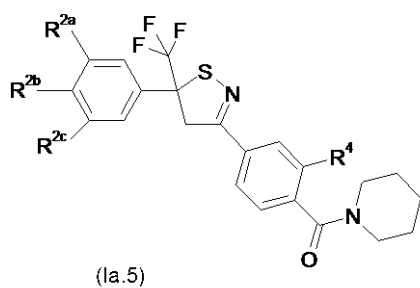
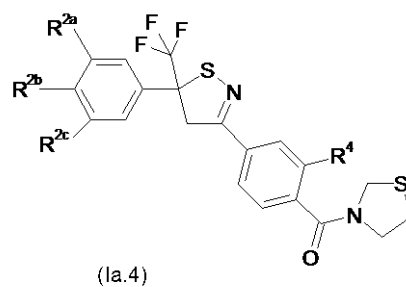
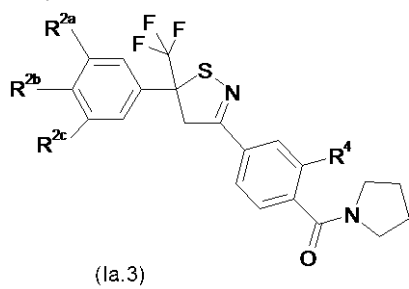
【化13】



40

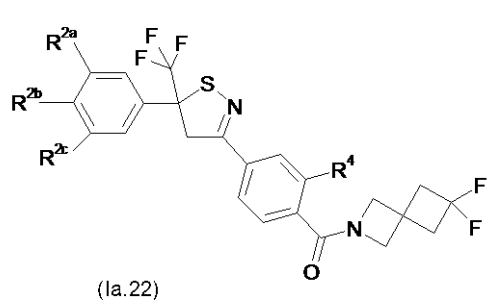
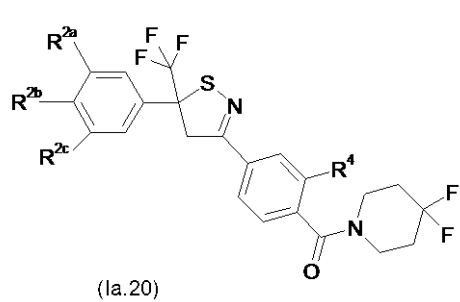
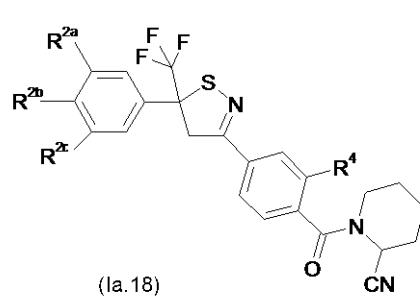
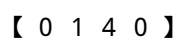
【0138】

【化 1 4】

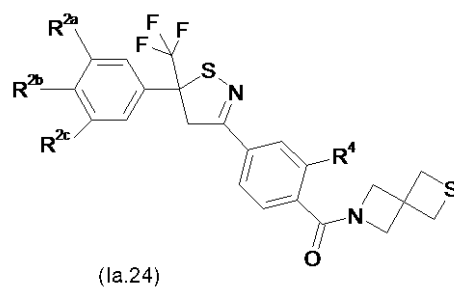
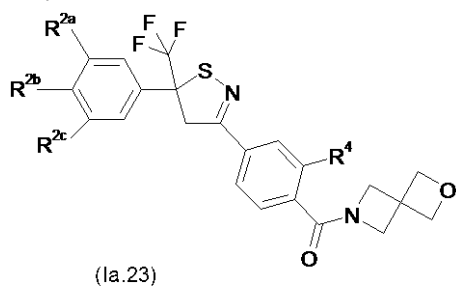


【 0 1 3 9 】

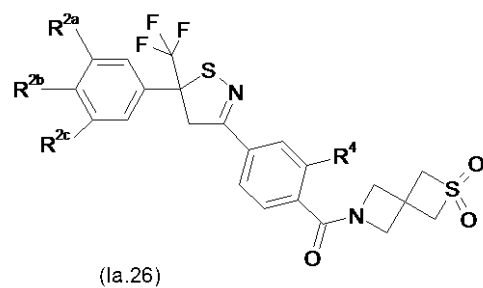
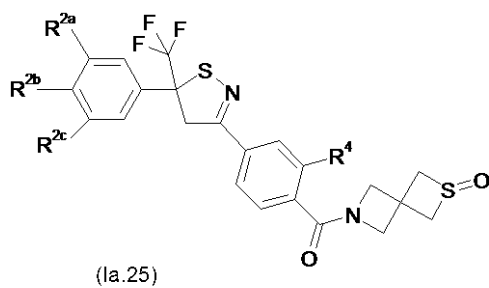
10



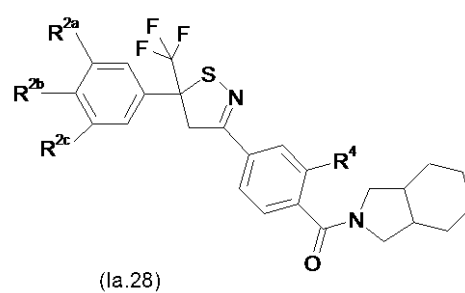
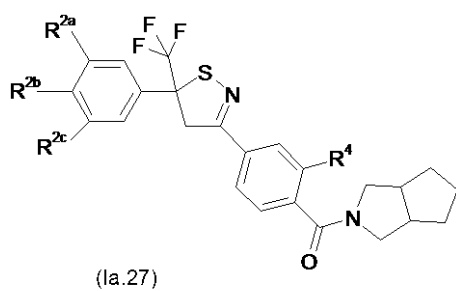
【化 1 6】



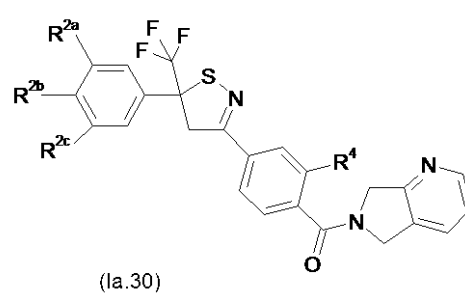
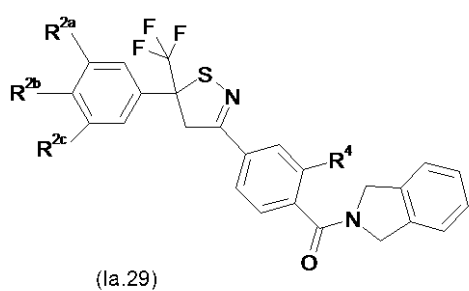
10



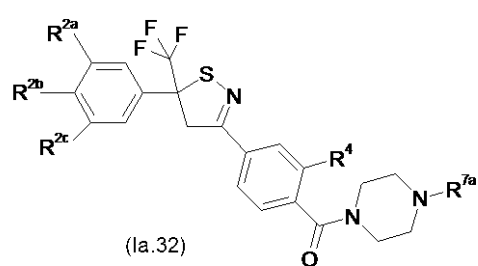
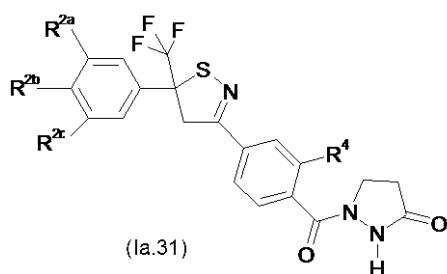
20



30

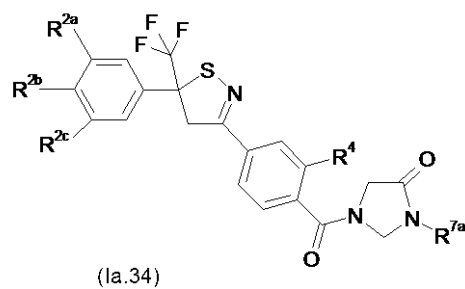
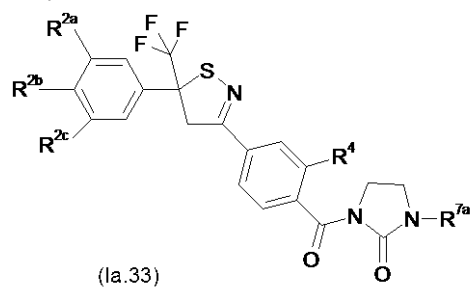


40

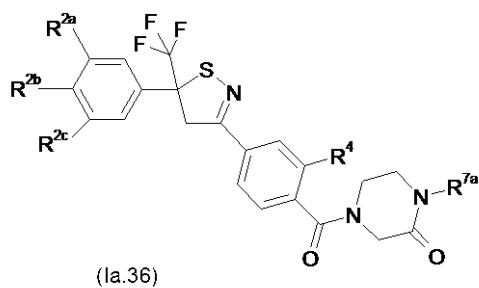
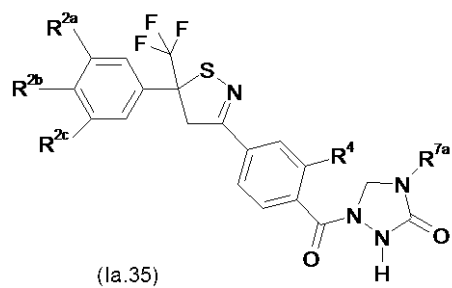


【 0 1 4 1 】

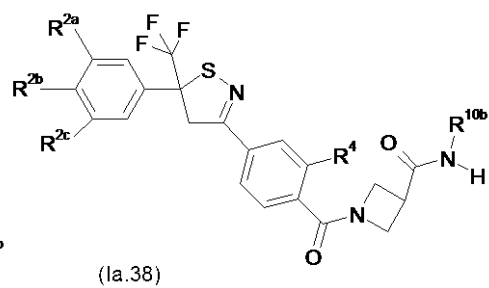
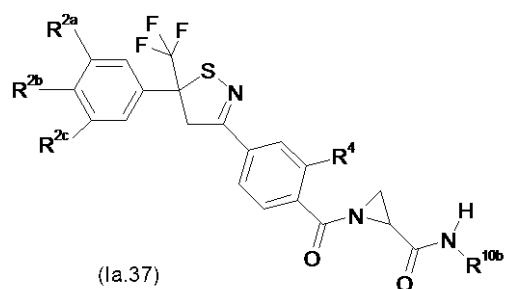
【化 17】



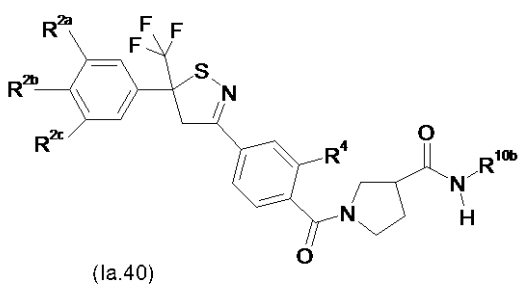
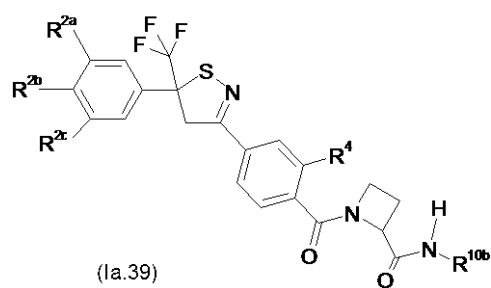
10



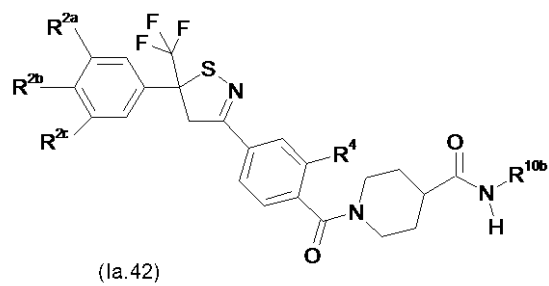
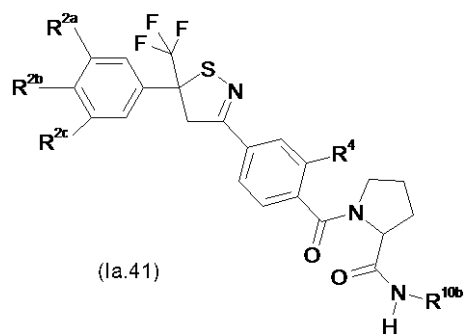
20



30

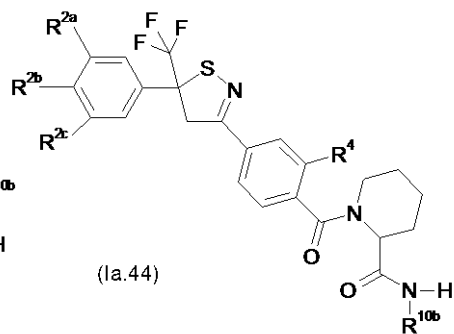
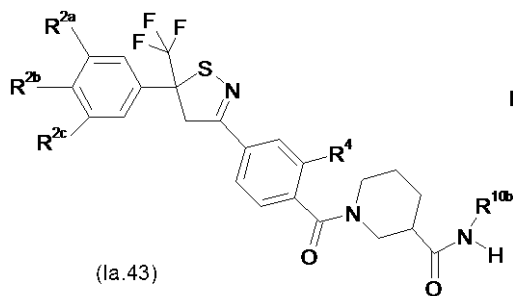


40

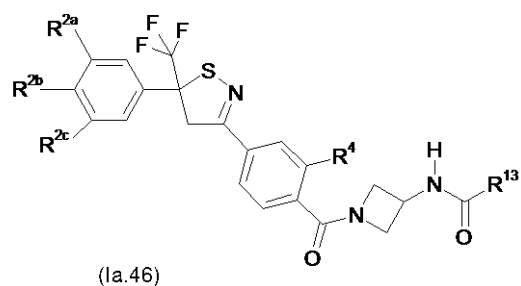
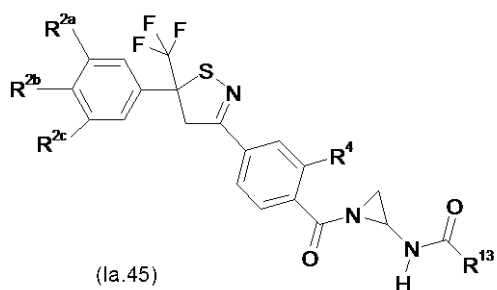


【 0 1 4 2 】

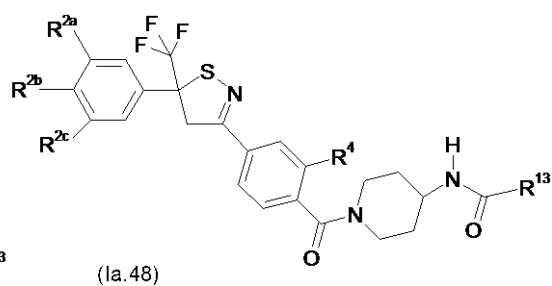
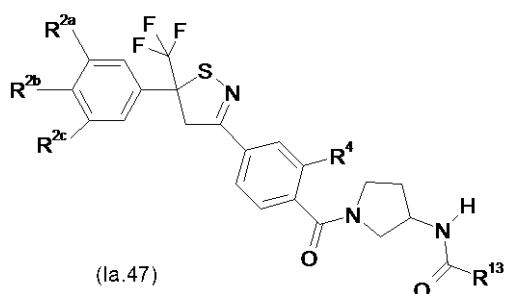
【化 1 8】



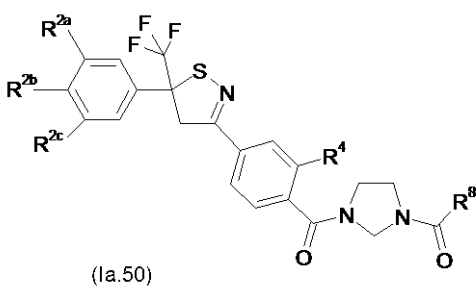
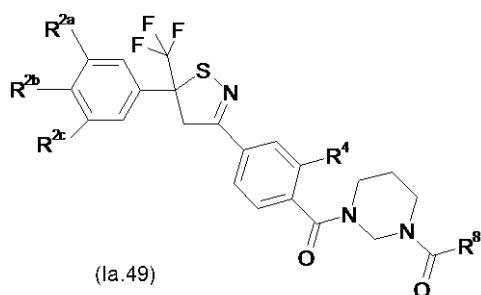
10



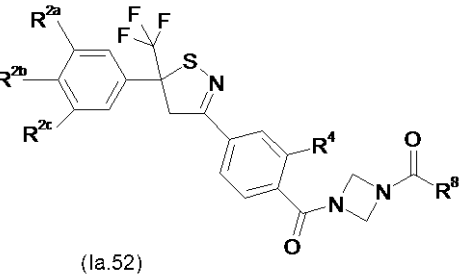
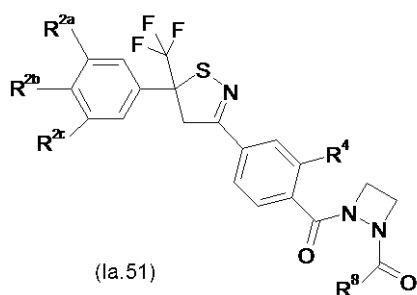
20



30



40



【 0 1 4 3】

表 1

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 の

50

化合物。

【 0 1 4 4 】

表 2

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 の化合物。

【 0 1 4 5 】

表 3

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 3 の化合物。

10

表 4

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 の化合物。

表 5

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 5 の化合物。

【 0 1 4 6 】

20

表 6

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 6 の化合物。

表 7

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 7 の化合物。

表 8

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 8 の化合物。

30

【 0 1 4 7 】

表 9

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、行 A - 3 7、A - 3 0 7、A - 3 3 7 及び A - 6 6 7 を除外する、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 9 の化合物。

表 1 0

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 0 の化合物。

40

表 1 1

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 1 の化合物。

表 1 2

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 2 の化合物。

表 1 3

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 3 の化合物。

【 0 1 4 8 】

50

表 1 4

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 4 の化合物。

【 0 1 4 9 】

表 1 5

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 5 の化合物。

表 1 6

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 6 の化合物。

10

表 1 7

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 7 の化合物。

表 1 8

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 8 の化合物。

【 0 1 5 0 】

表 1 9

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 1 9 の化合物。

20

表 2 0

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 0 の化合物。

表 2 1

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 1 の化合物。

表 2 2

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 2 の化合物。

【 0 1 5 1 】

30

表 2 3

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 3 の化合物。

表 2 4

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 4 の化合物。

表 2 5

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 5 の化合物。

表 2 6

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 6 の化合物。

40

【 0 1 5 2 】

表 2 7

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 7 の化合物。

表 2 8

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 2 8 の化合物。

表 2 9

50

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 29 の化合物。

表 30

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 30 の化合物。

【0153】

表 31

化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 31 の化合物。

表 32

R^{7a} が水素であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 33

R^{7a} がメチルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 34

R^{7a} がエチルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

【0154】

表 35

R^{7a} がイソプロピル ($-CH(CH_3)_2$) であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 36

R^{7a} が 2, 2 - ジフルオロエチルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 37

R^{7a} が 2, 2, 2 - トリフルオロエチルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 38

R^{7a} がシクロプロピルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

【0155】

表 39

R^{7a} がシクロプロピルメチル - であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 40

R^{7a} がアリルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 41

R^{7a} がプロパ - 2 - イニル (プロパルギル) であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 32 の化合物。

表 42 ~ 51

R^{7a} が表 32 ~ 41 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 33 の化合物。

【0156】

表 52 ~ 61

R^{7a} が表 32 ~ 41 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 34 の化合物。

10

20

30

40

50

表 6 2 ~ 7 1

R^{7a} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 3 5 の化合物。

【 0 1 5 7 】

表 7 2 ~ 8 1

R^{7a} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 3 6 の化合物。

表 8 2 ~ 9 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 3 7 の化合物。

表 9 2 ~ 1 0 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 3 8 の化合物。

表 1 0 2 ~ 1 1 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 3 9 の化合物。

【 0 1 5 8 】

表 1 1 2 ~ 1 2 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 0 の化合物。

表 1 2 2 ~ 1 3 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 1 の化合物。

表 1 3 2 ~ 1 4 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 2 の化合物。

表 1 4 2 ~ 1 5 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 3 の化合物。

【 0 1 5 9 】

表 1 5 2 ~ 1 6 1

R^{10b} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 4 の化合物。

表 1 6 2 ~ 1 7 1

R^{13} が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

表 1 7 2

R^{13} が CF_3 であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

10

20

30

40

50

表 1 7 3

R^{13} がビニルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

【 0 1 6 0 】

表 1 7 4

R^{13} がエチニルであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

表 1 7 5

R^{13} が $-NH(CH_3)$ であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

10

表 1 7 6

R^{13} が $-NH(CH_2CH_3)$ であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

表 1 7 7

R^{13} が $-NH(CH_2CF_3)$ であり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 5 の化合物。

【 0 1 6 1 】

表 1 7 8 ~ 1 9 3

R^{13} が表 1 6 2 ~ 1 7 7 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 6 の化合物。

20

表 1 9 4 ~ 2 0 9

R^{13} が表 1 6 2 ~ 1 7 7 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 7 の化合物。

表 2 1 0 ~ 2 2 5

R^{13} が表 1 6 2 ~ 1 7 7 のいずれかにおいて定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 8 の化合物。

表 2 2 6 ~ 2 3 5

R^8 が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 4 9 の化合物。

30

【 0 1 6 2 】

表 2 3 6 ~ 2 4 5

R^8 が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 5 0 の化合物。

表 2 4 6 ~ 2 5 5

R^8 が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 5 1 の化合物。

40

表 2 5 6 ~ 2 6 5

R^8 が表 3 2 ~ 4 1 のいずれかにおいて R^{7a} に関して定義されている通りであり、化合物の R^{2a} 、 R^{2b} 、 R^{2c} 及び R^4 の組合せが、各場合において、表 A の 1 つの行に相当する、式 I a . 5 2 の化合物。

【 0 1 6 3 】

【表 1】

表A

No.	R ^{2a}	R ^{2b}	R ^{2c}	R ⁴
A-1	F	H	F	H
A-2	F	F	F	H
A-3	F	Cl	F	H
A-4	F	Br	F	H
A-5	F	H	Cl	H
A-6	F	H	Br	H
A-7	Cl	H	Cl	H
A-8	Cl	Cl	Cl	H
A-9	Cl	F	Cl	H
A-10	Cl	Br	Cl	H
A-11	Cl	H	Br	H
A-12	Br	H	Br	H
A-13	Br	F	Br	H
A-14	Br	Cl	Br	H
A-15	CF ₃	H	F	H
A-16	CF ₃	H	Cl	H
A-17	CF ₃	H	Br	H
A-18	CF ₃	H	CF ₃	H
A-19	CF ₃	F	F	H
A-20	CF ₃	Cl	Cl	H
A-21	CF ₃	Br	Br	H
A-22	SF ₅	H	F	H
A-23	SF ₅	H	Cl	H
A-24	SF ₅	H	Br	H
A-25	SF ₅	H	CF ₃	H
A-26	SF ₅	H	H	H
A-27	CF ₃	H	H	H
A-28	Br	H	H	H
A-29	Cl	H	H	H
A-30	F	H	H	H
A-31	F	H	F	CH ₃
A-32	F	F	F	CH ₃
A-33	F	Cl	F	CH ₃
A-34	F	Br	F	CH ₃
A-35	F	H	Cl	CH ₃
A-36	F	H	Br	CH ₃
A-37	Cl	H	Cl	CH ₃
A-38	Cl	Cl	Cl	CH ₃
A-39	Cl	F	Cl	CH ₃
A-40	Cl	Br	Cl	CH ₃

10

20

30

40

A-41	Cl	H	Br	CH ₃
A-42	Br	H	Br	CH ₃
A-43	Br	F	Br	CH ₃
A-44	Br	Cl	Br	CH ₃
A-45	CF ₃	H	F	CH ₃
A-46	CF ₃	H	Cl	CH ₃
A-47	CF ₃	H	Br	CH ₃
A-48	CF ₃	H	CF ₃	CH ₃
A-49	CF ₃	F	F	CH ₃
A-50	CF ₃	Cl	Cl	CH ₃
A-51	CF ₃	Br	Br	CH ₃
A-52	SF ₅	H	F	CH ₃
A-53	SF ₅	H	Cl	CH ₃
A-54	SF ₅	H	Br	CH ₃
A-55	SF ₅	H	CF ₃	CH ₃
A-56	SF ₅	H	H	CH ₃
A-57	CF ₃	H	H	CH ₃
A-58	Br	H	H	CH ₃
A-59	Cl	H	H	CH ₃
A-60	F	H	H	CH ₃
A-61	F	H	F	CH ₂ CH ₃
A-62	F	F	F	CH ₂ CH ₃
A-63	F	Cl	F	CH ₂ CH ₃
A-64	F	Br	F	CH ₂ CH ₃
A-65	F	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-66	F	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-67	Cl	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-68	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A-69	Cl	F	Cl	CH ₂ CH ₃
A-70	Cl	Br	Cl	CH ₂ CH ₃
A-71	Cl	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-72	Br	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-73	Br	F	Br	CH ₂ CH ₃
A-74	Br	Cl	Br	CH ₂ CH ₃
A-75	CF ₃	H	F	CH ₂ CH ₃
A-76	CF ₃	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-77	CF ₃	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-78	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-79	CF ₃	F	F	CH ₂ CH ₃
A-80	CF ₃	Cl	Cl	CH ₂ CH ₃
A-81	CF ₃	Br	Br	CH ₂ CH ₃
A-82	SF ₅	H	F	CH ₂ CH ₃
A-83	SF ₅	H	Cl	CH ₂ CH ₃
A-84	SF ₅	H	Br	CH ₂ CH ₃
A-85	SF ₅	H	CF ₃	CH ₂ CH ₃

10

20

30

40

A-86	SF ₅	H	H	CH ₂ CH ₃
A-87	CF ₃	H	H	CH ₂ CH ₃
A-88	Br	H	H	CH ₂ CH ₃
A-89	Cl	H	H	CH ₂ CH ₃
A-90	F	H	H	CH ₂ CH ₃
A-91	F	H	F	CH(CH ₃) ₂
A-92	F	F	F	CH(CH ₃) ₂
A-93	F	Cl	F	CH(CH ₃) ₂
A-94	F	Br	F	CH(CH ₃) ₂
A-95	F	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-96	F	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-97	Cl	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-98	Cl	Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-99	Cl	F	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-100	Cl	Br	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-101	Cl	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-102	Br	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-103	Br	F	Br	CH(CH ₃) ₂
A-104	Br	Cl	Br	CH(CH ₃) ₂
A-105	CF ₃	H	F	CH(CH ₃) ₂
A-106	CF ₃	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-107	CF ₃	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-108	CF ₃	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
A-109	CF ₃	F	F	CH(CH ₃) ₂
A-110	CF ₃	Cl	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-111	CF ₃	Br	Br	CH(CH ₃) ₂
A-112	SF ₅	H	F	CH(CH ₃) ₂
A-113	SF ₅	H	Cl	CH(CH ₃) ₂
A-114	SF ₅	H	Br	CH(CH ₃) ₂
A-115	SF ₅	H	CF ₃	CH(CH ₃) ₂
A-116	SF ₅	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-117	CF ₃	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-118	Br	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-119	Cl	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-120	F	H	H	CH(CH ₃) ₂
A-121	F	H	F	CHF ₂
A-122	F	F	F	CHF ₂
A-123	F	Cl	F	CHF ₂
A-124	F	Br	F	CHF ₂
A-125	F	H	Cl	CHF ₂
A-126	F	H	Br	CHF ₂
A-127	Cl	H	Cl	CHF ₂
A-128	Cl	Cl	Cl	CHF ₂
A-129	Cl	F	Cl	CHF ₂
A-130	Cl	Br	Cl	CHF ₂

10

20

30

40

A-131	Cl	H	Br	CHF ₂
A-132	Br	H	Br	CHF ₂
A-133	Br	F	Br	CHF ₂
A-134	Br	Cl	Br	CHF ₂
A-135	CF ₃	H	F	CHF ₂
A-136	CF ₃	H	Cl	CHF ₂
A-137	CF ₃	H	Br	CHF ₂
A-138	CF ₃	H	CF ₃	CHF ₂
A-139	CF ₃	F	F	CHF ₂
A-140	CF ₃	Cl	Cl	CHF ₂
A-141	CF ₃	Br	Br	CHF ₂
A-142	SF ₅	H	F	CHF ₂
A-143	SF ₅	H	Cl	CHF ₂
A-144	SF ₅	H	Br	CHF ₂
A-145	SF ₅	H	CF ₃	CHF ₂
A-146	SF ₅	H	H	CHF ₂
A-147	CF ₃	H	H	CHF ₂
A-148	Br	H	H	CHF ₂
A-149	Cl	H	H	CHF ₂
A-150	F	H	H	CHF ₂
A-151	F	H	F	CF ₃
A-152	F	F	F	CF ₃
A-153	F	Cl	F	CF ₃
A-154	F	Br	F	CF ₃
A-155	F	H	Cl	CF ₃
A-156	F	H	Br	CF ₃
A-157	Cl	H	Cl	CF ₃
A-158	Cl	Cl	Cl	CF ₃
A-159	Cl	F	Cl	CF ₃
A-160	Cl	Br	Cl	CF ₃
A-161	Cl	H	Br	CF ₃
A-162	Br	H	Br	CF ₃
A-163	Br	F	Br	CF ₃
A-164	Br	Cl	Br	CF ₃
A-165	CF ₃	H	F	CF ₃
A-166	CF ₃	H	Cl	CF ₃
A-167	CF ₃	H	Br	CF ₃
A-168	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃
A-169	CF ₃	F	F	CF ₃
A-170	CF ₃	Cl	Cl	CF ₃
A-171	CF ₃	Br	Br	CF ₃
A-172	SF ₅	H	F	CF ₃
A-173	SF ₅	H	Cl	CF ₃
A-174	SF ₅	H	Br	CF ₃
A-175	SF ₅	H	CF ₃	CF ₃

10

20

30

40

A-176	SF ₅	H	H	CF ₃
A-177	CF ₃	H	H	CF ₃
A-178	Br	H	H	CF ₃
A-179	Cl	H	H	CF ₃
A-180	F	H	H	CF ₃
A-181	F	H	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-182	F	F	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-183	F	Cl	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-184	F	Br	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-185	F	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-186	F	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-187	Cl	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-188	Cl	Cl	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-189	Cl	F	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-190	Cl	Br	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-191	Cl	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-192	Br	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-193	Br	F	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-194	Br	Cl	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-195	CF ₃	H	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-196	CF ₃	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-197	CF ₃	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-198	CF ₃	H	CF ₃	CH ₂ -CH=CH ₂
A-199	CF ₃	F	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-200	CF ₃	Cl	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-201	CF ₃	Br	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-202	SF ₅	H	F	CH ₂ -CH=CH ₂
A-203	SF ₅	H	Cl	CH ₂ -CH=CH ₂
A-204	SF ₅	H	Br	CH ₂ -CH=CH ₂
A-205	SF ₅	H	CF ₃	CH ₂ -CH=CH ₂
A-206	SF ₅	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-207	CF ₃	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-208	Br	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-209	Cl	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-210	F	H	H	CH ₂ -CH=CH ₂
A-211	F	H	F	CH=CH ₂
A-212	F	F	F	CH=CH ₂
A-213	F	Cl	F	CH=CH ₂
A-214	F	Br	F	CH=CH ₂
A-215	F	H	Cl	CH=CH ₂
A-216	F	H	Br	CH=CH ₂
A-217	Cl	H	Cl	CH=CH ₂
A-218	Cl	Cl	Cl	CH=CH ₂
A-219	Cl	F	Cl	CH=CH ₂
A-220	Cl	Br	Cl	CH=CH ₂

10

20

30

40

A-221	Cl	H	Br	CH=CH ₂
A-222	Br	H	Br	CH=CH ₂
A-223	Br	F	Br	CH=CH ₂
A-224	Br	Cl	Br	CH=CH ₂
A-225	CF ₃	H	F	CH=CH ₂
A-226	CF ₃	H	Cl	CH=CH ₂
A-227	CF ₃	H	Br	CH=CH ₂
A-228	CF ₃	H	CF ₃	CH=CH ₂
A-229	CF ₃	F	F	CH=CH ₂
A-230	CF ₃	Cl	Cl	CH=CH ₂
A-231	CF ₃	Br	Br	CH=CH ₂
A-232	SF ₅	H	F	CH=CH ₂
A-233	SF ₅	H	Cl	CH=CH ₂
A-234	SF ₅	H	Br	CH=CH ₂
A-235	SF ₅	H	CF ₃	CH=CH ₂
A-236	SF ₅	H	H	CH=CH ₂
A-237	CF ₃	H	H	CH=CH ₂
A-238	Br	H	H	CH=CH ₂
A-239	Cl	H	H	CH=CH ₂
A-240	F	H	H	CH=CH ₂
A-241	F	H	F	C≡CH
A-242	F	F	F	C≡CH
A-243	F	Cl	F	C≡CH
A-244	F	Br	F	C≡CH
A-245	F	H	Cl	C≡CH
A-246	F	H	Br	C≡CH
A-247	Cl	H	Cl	C≡CH
A-248	Cl	Cl	Cl	C≡CH
A-249	Cl	F	Cl	C≡CH
A-250	Cl	Br	Cl	C≡CH
A-251	Cl	H	Br	C≡CH
A-252	Br	H	Br	C≡CH
A-253	Br	F	Br	C≡CH
A-254	Br	Cl	Br	C≡CH
A-255	CF ₃	H	F	C≡CH
A-256	CF ₃	H	Cl	C≡CH
A-257	CF ₃	H	Br	C≡CH
A-258	CF ₃	H	CF ₃	C≡CH
A-259	CF ₃	F	F	C≡CH
A-260	CF ₃	Cl	Cl	C≡CH
A-261	CF ₃	Br	Br	C≡CH
A-262	SF ₅	H	F	C≡CH
A-263	SF ₅	H	Cl	C≡CH
A-264	SF ₅	H	Br	C≡CH
A-265	SF ₅	H	CF ₃	C≡CH

10

20

30

40

A-266	SF ₅	H	H	C≡CH
A-267	CF ₃	H	H	C≡CH
A-268	Br	H	H	C≡CH
A-269	Cl	H	H	C≡CH
A-270	F	H	H	C≡CH
A-271	F	H	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-272	F	F	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-273	F	Cl	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-274	F	Br	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-275	F	H	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-276	F	H	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-277	Cl	H	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-278	Cl	Cl	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-279	Cl	F	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-280	Cl	Br	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-281	Cl	H	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-282	Br	H	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-283	Br	F	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-284	Br	Cl	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-285	CF ₃	H	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-286	CF ₃	H	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-287	CF ₃	H	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-288	CF ₃	H	CF ₃	[°] C ₃ H ₅ *
A-289	CF ₃	F	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-290	CF ₃	Cl	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-291	CF ₃	Br	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-292	SF ₅	H	F	[°] C ₃ H ₅ *
A-293	SF ₅	H	Cl	[°] C ₃ H ₅ *
A-294	SF ₅	H	Br	[°] C ₃ H ₅ *
A-295	SF ₅	H	CF ₃	[°] C ₃ H ₅ *
A-296	SF ₅	H	H	[°] C ₃ H ₅ *
A-297	CF ₃	H	H	[°] C ₃ H ₅ *
A-298	Br	H	H	[°] C ₃ H ₅ *
A-299	Cl	H	H	[°] C ₃ H ₅ *
A-300	F	H	H	[°] C ₃ H ₅ *
A-301	F	H	F	F
A-302	F	F	F	F
A-303	F	Cl	F	F
A-304	F	Br	F	F
A-305	F	H	Cl	F
A-306	F	H	Br	F
A-307	Cl	H	Cl	F
A-308	Cl	Cl	Cl	F
A-309	Cl	F	Cl	F
A-310	Cl	Br	Cl	F

10

20

30

40

A-311	Cl	H	Br	F
A-312	Br	H	Br	F
A-313	Br	F	Br	F
A-314	Br	Cl	Br	F
A-315	CF ₃	H	F	F
A-316	CF ₃	H	Cl	F
A-317	CF ₃	H	Br	F
A-318	CF ₃	H	CF ₃	F
A-319	CF ₃	F	F	F
A-320	CF ₃	Cl	Cl	F
A-321	CF ₃	Br	Br	F
A-322	SF ₅	H	F	F
A-323	SF ₅	H	Cl	F
A-324	SF ₅	H	Br	F
A-325	SF ₅	H	CF ₃	F
A-326	SF ₅	H	H	F
A-327	CF ₃	H	H	F
A-328	Br	H	H	F
A-329	Cl	H	H	F
A-330	F	H	H	F
A-331	F	H	F	Cl
A-332	F	F	F	Cl
A-333	F	Cl	F	Cl
A-334	F	Br	F	Cl
A-335	F	H	Cl	Cl
A-336	F	H	Br	Cl
A-337	Cl	H	Cl	Cl
A-338	Cl	Cl	Cl	Cl
A-339	Cl	F	Cl	Cl
A-340	Cl	Br	Cl	Cl
A-341	Cl	H	Br	Cl
A-342	Br	H	Br	Cl
A-343	Br	F	Br	Cl
A-344	Br	Cl	Br	Cl
A-345	CF ₃	H	F	Cl
A-346	CF ₃	H	Cl	Cl
A-347	CF ₃	H	Br	Cl
A-348	CF ₃	H	CF ₃	Cl
A-349	CF ₃	F	F	Cl
A-350	CF ₃	Cl	Cl	Cl
A-351	CF ₃	Br	Br	Cl
A-352	SF ₅	H	F	Cl
A-353	SF ₅	H	Cl	Cl
A-354	SF ₅	H	Br	Cl
A-355	SF ₅	H	CF ₃	Cl

10

20

30

40

A-356	SF ₅	H	H	Cl
A-357	CF ₃	H	H	Cl
A-358	Br	H	H	Cl
A-359	Cl	H	H	Cl
A-360	F	H	H	Cl
A-361	F	H	F	Br
A-362	F	F	F	Br
A-363	F	Cl	F	Br
A-364	F	Br	F	Br
A-365	F	H	Cl	Br
A-366	F	H	Br	Br
A-367	Cl	H	Cl	Br
A-368	Cl	Cl	Cl	Br
A-369	Cl	F	Cl	Br
A-370	Cl	Br	Cl	Br
A-371	Cl	H	Br	Br
A-372	Br	H	Br	Br
A-373	Br	F	Br	Br
A-374	Br	Cl	Br	Br
A-375	CF ₃	H	F	Br
A-376	CF ₃	H	Cl	Br
A-377	CF ₃	H	Br	Br
A-378	CF ₃	H	CF ₃	Br
A-379	CF ₃	F	F	Br
A-380	CF ₃	Cl	Cl	Br
A-381	CF ₃	Br	Br	Br
A-382	SF ₅	H	F	Br
A-383	SF ₅	H	Cl	Br
A-384	SF ₅	H	Br	Br
A-385	SF ₅	H	CF ₃	Br
A-386	SF ₅	H	H	Br
A-387	CF ₃	H	H	Br
A-388	Br	H	H	Br
A-389	Cl	H	H	Br
A-390	F	H	H	Br
A-391	F	H	F	CN
A-392	F	F	F	CN
A-393	F	Cl	F	CN
A-394	F	Br	F	CN
A-395	F	H	Cl	CN
A-396	F	H	Br	CN
A-397	Cl	H	Cl	CN
A-398	Cl	Cl	Cl	CN
A-399	Cl	F	Cl	CN
A-400	Cl	Br	Cl	CN

10

20

30

40

A-401	Cl	H	Br	CN
A-402	Br	H	Br	CN
A-403	Br	F	Br	CN
A-404	Br	Cl	Br	CN
A-405	CF ₃	H	F	CN
A-406	CF ₃	H	Cl	CN
A-407	CF ₃	H	Br	CN
A-408	CF ₃	H	CF ₃	CN
A-409	CF ₃	F	F	CN
A-410	CF ₃	Cl	Cl	CN
A-411	CF ₃	Br	Br	CN
A-412	SF ₅	H	F	CN
A-413	SF ₅	H	Cl	CN
A-414	SF ₅	H	Br	CN
A-415	SF ₅	H	CF ₃	CN
A-416	SF ₅	H	H	CN
A-417	CF ₃	H	H	CN
A-418	Br	H	H	CN
A-419	Cl	H	H	CN
A-420	F	H	H	CN
A-421	F	H	F	OCH ₃
A-422	F	F	F	OCH ₃
A-423	F	Cl	F	OCH ₃
A-424	F	Br	F	OCH ₃
A-425	F	H	Cl	OCH ₃
A-426	F	H	Br	OCH ₃
A-427	Cl	H	Cl	OCH ₃
A-428	Cl	Cl	Cl	OCH ₃
A-429	Cl	F	Cl	OCH ₃
A-430	Cl	Br	Cl	OCH ₃
A-431	Cl	H	Br	OCH ₃
A-432	Br	H	Br	OCH ₃
A-433	Br	F	Br	OCH ₃
A-434	Br	Cl	Br	OCH ₃
A-435	CF ₃	H	F	OCH ₃
A-436	CF ₃	H	Cl	OCH ₃
A-437	CF ₃	H	Br	OCH ₃
A-438	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₃
A-439	CF ₃	F	F	OCH ₃
A-440	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₃
A-441	CF ₃	Br	Br	OCH ₃
A-442	SF ₅	H	F	OCH ₃
A-443	SF ₅	H	Cl	OCH ₃
A-444	SF ₅	H	Br	OCH ₃
A-445	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₃

10

20

30

40

A-446	SF ₅	H	H	OCH ₃
A-447	CF ₃	H	H	OCH ₃
A-448	Br	H	H	OCH ₃
A-449	Cl	H	H	OCH ₃
A-450	F	H	H	OCH ₃
A-451	F	H	F	OCH ₂ CH ₃
A-452	F	F	F	OCH ₂ CH ₃
A-453	F	Cl	F	OCH ₂ CH ₃
A-454	F	Br	F	OCH ₂ CH ₃
A-455	F	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-456	F	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-457	Cl	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-458	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-459	Cl	F	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-460	Cl	Br	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-461	Cl	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-462	Br	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-463	Br	F	Br	OCH ₂ CH ₃
A-464	Br	Cl	Br	OCH ₂ CH ₃
A-465	CF ₃	H	F	OCH ₂ CH ₃
A-466	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-467	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-468	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₂ CH ₃
A-469	CF ₃	F	F	OCH ₂ CH ₃
A-470	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-471	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH ₃
A-472	SF ₅	H	F	OCH ₂ CH ₃
A-473	SF ₅	H	Cl	OCH ₂ CH ₃
A-474	SF ₅	H	Br	OCH ₂ CH ₃
A-475	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₂ CH ₃
A-476	SF ₅	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-477	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-478	Br	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-479	Cl	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-480	F	H	H	OCH ₂ CH ₃
A-481	F	H	F	OCH(CH ₃) ₂
A-482	F	F	F	OCH(CH ₃) ₂
A-483	F	Cl	F	OCH(CH ₃) ₂
A-484	F	Br	F	OCH(CH ₃) ₂
A-485	F	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-486	F	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-487	Cl	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-488	Cl	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-489	Cl	F	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-490	Cl	Br	Cl	OCH(CH ₃) ₂

10

20

30

40

A-491	Cl	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-492	Br	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-493	Br	F	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-494	Br	Cl	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-495	CF ₃	H	F	OCH(CH ₃) ₂
A-496	CF ₃	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-497	CF ₃	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-498	CF ₃	H	CF ₃	OCH(CH ₃) ₂
A-499	CF ₃	F	F	OCH(CH ₃) ₂
A-500	CF ₃	Cl	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-501	CF ₃	Br	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-502	SF ₅	H	F	OCH(CH ₃) ₂
A-503	SF ₅	H	Cl	OCH(CH ₃) ₂
A-504	SF ₅	H	Br	OCH(CH ₃) ₂
A-505	SF ₅	H	CF ₃	OCH(CH ₃) ₂
A-506	SF ₅	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-507	CF ₃	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-508	Br	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-509	Cl	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-510	F	H	H	OCH(CH ₃) ₂
A-511	F	H	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-512	F	F	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-513	F	Cl	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-514	F	Br	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-515	F	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-516	F	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-517	Cl	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-518	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-519	Cl	F	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-520	Cl	Br	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-521	Cl	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-522	Br	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-523	Br	F	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-524	Br	Cl	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-525	CF ₃	H	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-526	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-527	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-528	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
A-529	CF ₃	F	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-530	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-531	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-532	SF ₅	H	F	OCH ₂ CH=CH ₂
A-533	SF ₅	H	Cl	OCH ₂ CH=CH ₂
A-534	SF ₅	H	Br	OCH ₂ CH=CH ₂
A-535	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂

10

20

30

40

A-536	SF ₅	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-537	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-538	Br	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-539	Cl	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-540	F	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂
A-541	F	H	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-542	F	F	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-543	F	Cl	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-544	F	Br	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-545	F	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-546	F	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-547	Cl	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-548	Cl	Cl	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-549	Cl	F	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-550	Cl	Br	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-551	Cl	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-552	Br	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-553	Br	F	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-554	Br	Cl	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-555	CF ₃	H	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-556	CF ₃	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-557	CF ₃	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-558	CF ₃	H	CF ₃	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-559	CF ₃	F	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-560	CF ₃	Cl	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-561	CF ₃	Br	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-562	SF ₅	H	F	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-563	SF ₅	H	Cl	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-564	SF ₅	H	Br	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-565	SF ₅	H	CF ₃	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-566	SF ₅	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-567	CF ₃	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-568	Br	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-569	Cl	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-570	F	H	H	O- ^c C ₃ H ₅ *
A-571	F	H	F	OCHF ₂
A-572	F	F	F	OCHF ₂
A-573	F	Cl	F	OCHF ₂
A-574	F	Br	F	OCHF ₂
A-575	F	H	Cl	OCHF ₂
A-576	F	H	Br	OCHF ₂
A-577	Cl	H	Cl	OCHF ₂
A-578	Cl	Cl	Cl	OCHF ₂
A-579	Cl	F	Cl	OCHF ₂
A-580	Cl	Br	Cl	OCHF ₂

10

20

30

40

A-581	Cl	H	Br	OCHF ₂
A-582	Br	H	Br	OCHF ₂
A-583	Br	F	Br	OCHF ₂
A-584	Br	Cl	Br	OCHF ₂
A-585	CF ₃	H	F	OCHF ₂
A-586	CF ₃	H	Cl	OCHF ₂
A-587	CF ₃	H	Br	OCHF ₂
A-588	CF ₃	H	CF ₃	OCHF ₂
A-589	CF ₃	F	F	OCHF ₂
A-590	CF ₃	Cl	Cl	OCHF ₂
A-591	CF ₃	Br	Br	OCHF ₂
A-592	SF ₅	H	F	OCHF ₂
A-593	SF ₅	H	Cl	OCHF ₂
A-594	SF ₅	H	Br	OCHF ₂
A-595	SF ₅	H	CF ₃	OCHF ₂
A-596	SF ₅	H	H	OCHF ₂
A-597	CF ₃	H	H	OCHF ₂
A-598	Br	H	H	OCHF ₂
A-599	Cl	H	H	OCHF ₂
A-600	F	H	H	OCHF ₂
A-601	F	H	F	OCF ₃
A-602	F	F	F	OCF ₃
A-603	F	Cl	F	OCF ₃
A-604	F	Br	F	OCF ₃
A-605	F	H	Cl	OCF ₃
A-606	F	H	Br	OCF ₃
A-607	Cl	H	Cl	OCF ₃
A-608	Cl	Cl	Cl	OCF ₃
A-609	Cl	F	Cl	OCF ₃
A-610	Cl	Br	Cl	OCF ₃
A-611	Cl	H	Br	OCF ₃
A-612	Br	H	Br	OCF ₃
A-613	Br	F	Br	OCF ₃
A-614	Br	Cl	Br	OCF ₃
A-615	CF ₃	H	F	OCF ₃
A-616	CF ₃	H	Cl	OCF ₃
A-617	CF ₃	H	Br	OCF ₃
A-618	CF ₃	H	CF ₃	OCF ₃
A-619	CF ₃	F	F	OCF ₃
A-620	CF ₃	Cl	Cl	OCF ₃
A-621	CF ₃	Br	Br	OCF ₃
A-622	SF ₅	H	F	OCF ₃
A-623	SF ₅	H	Cl	OCF ₃
A-624	SF ₅	H	Br	OCF ₃
A-625	SF ₅	H	CF ₃	OCF ₃

10

20

30

40

A-626	SF ₅	H	H	OCF ₃
A-627	CF ₃	H	H	OCF ₃
A-628	Br	H	H	OCF ₃
A-629	Cl	H	H	OCF ₃
A-630	F	H	H	OCF ₃
A-631	F	H	F	OCH ₂ CF ₃
A-632	F	F	F	OCH ₂ CF ₃
A-633	F	Cl	F	OCH ₂ CF ₃
A-634	F	Br	F	OCH ₂ CF ₃
A-635	F	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-636	F	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-637	Cl	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-638	Cl	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-639	Cl	F	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-640	Cl	Br	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-641	Cl	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-642	Br	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-643	Br	F	Br	OCH ₂ CF ₃
A-644	Br	Cl	Br	OCH ₂ CF ₃
A-645	CF ₃	H	F	OCH ₂ CF ₃
A-646	CF ₃	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-647	CF ₃	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-648	CF ₃	H	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
A-649	CF ₃	F	F	OCH ₂ CF ₃
A-650	CF ₃	Cl	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-651	CF ₃	Br	Br	OCH ₂ CF ₃
A-652	SF ₅	H	F	OCH ₂ CF ₃
A-653	SF ₅	H	Cl	OCH ₂ CF ₃
A-654	SF ₅	H	Br	OCH ₂ CF ₃
A-655	SF ₅	H	CF ₃	OCH ₂ CF ₃
A-656	SF ₅	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-657	CF ₃	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-658	Br	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-659	Cl	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-660	F	H	H	OCH ₂ CF ₃
A-661	F	H	F	SCH ₃
A-662	F	F	F	SCH ₃
A-663	F	Cl	F	SCH ₃
A-664	F	Br	F	SCH ₃
A-665	F	H	Cl	SCH ₃
A-666	F	H	Br	SCH ₃
A-667	Cl	H	Cl	SCH ₃
A-668	Cl	Cl	Cl	SCH ₃
A-669	Cl	F	Cl	SCH ₃
A-670	Cl	Br	Cl	SCH ₃

10

20

30

40

A-671	Cl	H	Br	SCH ₃
A-672	Br	H	Br	SCH ₃
A-673	Br	F	Br	SCH ₃
A-674	Br	Cl	Br	SCH ₃
A-675	CF ₃	H	F	SCH ₃
A-676	CF ₃	H	Cl	SCH ₃
A-677	CF ₃	H	Br	SCH ₃
A-678	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₃
A-679	CF ₃	F	F	SCH ₃
A-680	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₃
A-681	CF ₃	Br	Br	SCH ₃
A-682	SF ₅	H	F	SCH ₃
A-683	SF ₅	H	Cl	SCH ₃
A-684	SF ₅	H	Br	SCH ₃
A-685	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₃
A-686	SF ₅	H	H	SCH ₃
A-687	CF ₃	H	H	SCH ₃
A-688	Br	H	H	SCH ₃
A-689	Cl	H	H	SCH ₃
A-690	F	H	H	SCH ₃
A-691	F	H	F	SCH ₂ CH ₃
A-692	F	F	F	SCH ₂ CH ₃
A-693	F	Cl	F	SCH ₂ CH ₃
A-694	F	Br	F	SCH ₂ CH ₃
A-695	F	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-696	F	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-697	Cl	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-698	Cl	Cl	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-699	Cl	F	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-700	Cl	Br	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-701	Cl	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-702	Br	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-703	Br	F	Br	SCH ₂ CH ₃
A-704	Br	Cl	Br	SCH ₂ CH ₃
A-705	CF ₃	H	F	SCH ₂ CH ₃
A-706	CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-707	CF ₃	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-708	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₂ CH ₃
A-709	CF ₃	F	F	SCH ₂ CH ₃
A-710	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-711	CF ₃	Br	Br	SCH ₂ CH ₃
A-712	SF ₅	H	F	SCH ₂ CH ₃
A-713	SF ₅	H	Cl	SCH ₂ CH ₃
A-714	SF ₅	H	Br	SCH ₂ CH ₃
A-715	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₂ CH ₃

10

20

30

40

A-716	SF ₅	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-717	CF ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-718	Br	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-719	Cl	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-720	F	H	H	SCH ₂ CH ₃
A-721	F	H	F	SCH(CH ₃) ₂
A-722	F	F	F	SCH(CH ₃) ₂
A-723	F	Cl	F	SCH(CH ₃) ₂
A-724	F	Br	F	SCH(CH ₃) ₂
A-725	F	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-726	F	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-727	Cl	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-728	Cl	Cl	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-729	Cl	F	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-730	Cl	Br	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-731	Cl	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-732	Br	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-733	Br	F	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-734	Br	Cl	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-735	CF ₃	H	F	SCH(CH ₃) ₂
A-736	CF ₃	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-737	CF ₃	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-738	CF ₃	H	CF ₃	SCH(CH ₃) ₂
A-739	CF ₃	F	F	SCH(CH ₃) ₂
A-740	CF ₃	Cl	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-741	CF ₃	Br	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-742	SF ₅	H	F	SCH(CH ₃) ₂
A-743	SF ₅	H	Cl	SCH(CH ₃) ₂
A-744	SF ₅	H	Br	SCH(CH ₃) ₂
A-745	SF ₅	H	CF ₃	SCH(CH ₃) ₂
A-746	SF ₅	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-747	CF ₃	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-748	Br	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-749	Cl	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-750	F	H	H	SCH(CH ₃) ₂
A-751	F	H	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-752	F	F	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-753	F	Cl	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-754	F	Br	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-755	F	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-756	F	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-757	Cl	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-758	Cl	Cl	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-759	Cl	F	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-760	Cl	Br	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂

10

20

30

40

A-761	Cl	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-762	Br	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-763	Br	F	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-764	Br	Cl	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-765	CF ₃	H	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-766	CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-767	CF ₃	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-768	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
A-769	CF ₃	F	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-770	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-771	CF ₃	Br	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-772	SF ₅	H	F	SCH ₂ CH=CH ₂
A-773	SF ₅	H	Cl	SCH ₂ CH=CH ₂
A-774	SF ₅	H	Br	SCH ₂ CH=CH ₂
A-775	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
A-776	SF ₅	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-777	CF ₃	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-778	Br	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-779	Cl	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-780	F	H	H	SCH ₂ CH=CH ₂
A-781	F	H	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-782	F	F	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-783	F	Cl	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-784	F	Br	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-785	F	H	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-786	F	H	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-787	Cl	H	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-788	Cl	Cl	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-789	Cl	F	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-790	Cl	Br	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-791	Cl	H	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-792	Br	H	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-793	Br	F	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-794	Br	Cl	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-795	CF ₃	H	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-796	CF ₃	H	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-797	CF ₃	H	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-798	CF ₃	H	CF ₃	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-799	CF ₃	F	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-800	CF ₃	Cl	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-801	CF ₃	Br	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-802	SF ₅	H	F	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-803	SF ₅	H	Cl	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-804	SF ₅	H	Br	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-805	SF ₅	H	CF ₃	S ⁻ C ₃ H ₅ *

10

20

30

40

A-806	SF ₅	H	H	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-807	CF ₃	H	H	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-808	Br	H	H	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-809	Cl	H	H	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-810	F	H	H	S ⁻ C ₃ H ₅ *
A-811	F	H	F	SCF ₃
A-812	F	F	F	SCF ₃
A-813	F	Cl	F	SCF ₃
A-814	F	Br	F	SCF ₃
A-815	F	H	Cl	SCF ₃
A-816	F	H	Br	SCF ₃
A-817	Cl	H	Cl	SCF ₃
A-818	Cl	Cl	Cl	SCF ₃
A-819	Cl	F	Cl	SCF ₃
A-820	Cl	Br	Cl	SCF ₃
A-821	Cl	H	Br	SCF ₃
A-822	Br	H	Br	SCF ₃
A-823	Br	F	Br	SCF ₃
A-824	Br	Cl	Br	SCF ₃
A-825	CF ₃	H	F	SCF ₃
A-826	CF ₃	H	Cl	SCF ₃
A-827	CF ₃	H	Br	SCF ₃
A-828	CF ₃	H	CF ₃	SCF ₃
A-829	CF ₃	F	F	SCF ₃
A-830	CF ₃	Cl	Cl	SCF ₃
A-831	CF ₃	Br	Br	SCF ₃
A-832	SF ₅	H	F	SCF ₃
A-833	SF ₅	H	Cl	SCF ₃
A-834	SF ₅	H	Br	SCF ₃
A-835	SF ₅	H	CF ₃	SCF ₃
A-836	SF ₅	H	H	SCF ₃
A-837	CF ₃	H	H	SCF ₃
A-838	Br	H	H	SCF ₃
A-839	Cl	H	H	SCF ₃
A-840	F	H	H	SCF ₃
A-841	F	H	F	SCH ₂ CF ₃
A-842	F	F	F	SCH ₂ CF ₃
A-843	F	Cl	F	SCH ₂ CF ₃
A-844	F	Br	F	SCH ₂ CF ₃
A-845	F	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-846	F	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-847	Cl	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-848	Cl	Cl	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-849	Cl	F	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-850	Cl	Br	Cl	SCH ₂ CF ₃

10

20

30

40

A-851	Cl	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-852	Br	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-853	Br	F	Br	SCH ₂ CF ₃
A-854	Br	Cl	Br	SCH ₂ CF ₃
A-855	CF ₃	H	F	SCH ₂ CF ₃
A-856	CF ₃	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-857	CF ₃	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-858	CF ₃	H	CF ₃	SCH ₂ CF ₃
A-859	CF ₃	F	F	SCH ₂ CF ₃
A-860	CF ₃	Cl	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-861	CF ₃	Br	Br	SCH ₂ CF ₃
A-862	SF ₅	H	F	SCH ₂ CF ₃
A-863	SF ₅	H	Cl	SCH ₂ CF ₃
A-864	SF ₅	H	Br	SCH ₂ CF ₃
A-865	SF ₅	H	CF ₃	SCH ₂ CF ₃
A-866	SF ₅	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-867	CF ₃	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-868	Br	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-869	Cl	H	H	SCH ₂ CF ₃
A-870	F	H	H	SCH ₂ CF ₃

10

20

* °C₃H₅ = シクロプロピル

【 0 1 8 3 】

上記の化合物の中で、好ましいのは、式 I a . 2、I a . 3、I a . 1 0、I a . 1 1、I a . 1 2、I a . 1 3 及び I a . 1 4 の化合物である。

【 0 1 8 4 】

式 I の化合物は、以下のスキーム若しくは実施例の合成の説明において記載されている方法により、又は有機化学の標準的方法により調製することができる。置換基、可変基及び指数は、特に指定しない場合、式 I について上で定義した通りである。

30

【 0 1 8 5 】

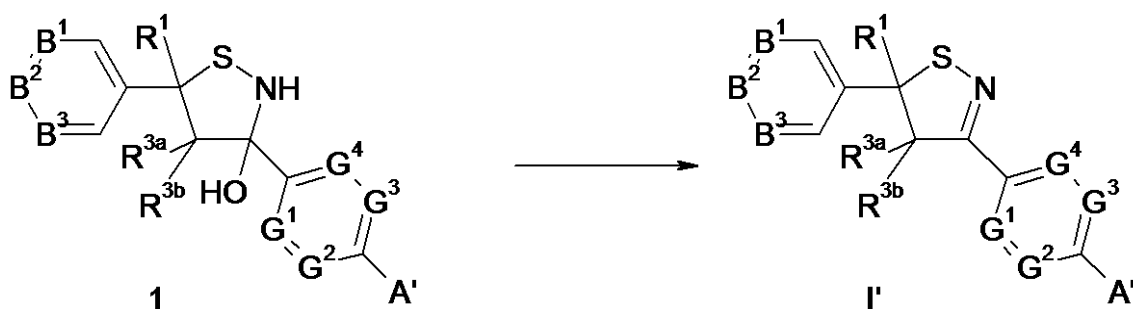
式 I の化合物は、以下のスキーム 1 に示されている通り、式 1 の化合物を脱水することにより調製することができる。A' は A、又は A の前駆体であり、A は、基 C (= W) N (R⁵R⁶) であり、W、R⁵ 及び R⁶ は、上で定義されている通りである。A の典型的な前駆体は、ハロゲン原子、CN、カルボキシ、tert-ブトキシカルボニル、アセタール (acetal) 基、保護アルデヒド基又は -OSO₂-R^{z1} であり、R^{z1} は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル又はフェニル (C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又は C₁-C₄-ハロアルコキシから選択される、1、2 又は 3 つの基により置換されていてもよい) である。化合物 I' は、A' が A の場合の化合物 I に相当する。脱水は、自発的に、又はモレキュラーシーブ、酸洗浄済みモレキュラーシーブ、硫酸マグネシウム、硫酸ナトリウム、シリカゲル、SOCl₂、POCl₃、バージェス (Burgess) 試薬、トリフルオロ酢酸無水物、p-トルエンスルホン酸、無水 HCl 又は硫酸などの脱水剤の手助けにより起こる。好ましくは、p-トルエンスルホン酸又は酸洗浄済みモレキュラーシーブが使用される。形成した水は、或いは、例えば、共留剤としてベンゼン/トルエンを用いる例えば共沸蒸留により、例えば、ディーンスタークトラップを使用して除去してもよい。必要な場合 (すなわち、A' が A の前駆体である場合)、A' は次に基 A に変換される。

40

【 0 1 8 6 】

スキーム 1

【化 19】



【0187】

10

R^{3b} が水素である化合物 1 は、スキーム 2 に示されている通り、化合物 3 をアミノ化剤と反応させて式 2 の化合物を得て、これが自然に反応して化合物 1 になることにより調製することができる。使用するアミノ化剤に応じて、アミノ化は一工程反応で行うことができ、この場合、化合物 3 が反応して直接化合物 2 となるか、又は二工程反応としては、化合物 3 の S H 基をまず酸化して S - C l 基にし、次にこの基をさらに反応させて S - N H₂ 基にし、こうして化合物 2 が得られる。

【0188】

20

一工程反応に適したアミノ化剤は、例えば H O S A (ヒドロキシルアミン - O - スルホン酸) (これは一般に、塩基 (適切な塩基は、例えば、リン酸水素ナトリウム、リン酸水素カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメタノレート、トリエチルアミンなど) の存在下で使用される)、O - (ジフェニルホスホリル) ヒドロキシルアミン (これは一般に、塩基 (適切な塩基は、例えば、リン酸水素ナトリウム、リン酸水素カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、ナトリウムメタノレート、トリエチルアミンなど) の存在下でも使用される)、2, 4 - ジニトロフェニルヒドロキシルアミン、O - メシチレンスルホンヒドロキシルアミン、及び 2 - オキサ - 1 - アザスピロ [2. 5] オクタンであり、これらの中で、H O S A 及び O - (ジフェニルホスホリル) ヒドロキシルアミンが好ましい。アミノ化は一般に、溶媒中で行われ、適切な溶媒は、例えば塩化メチレン又はクロロホルムなどの塩素化アルカン、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン又はジクロロベンゼンなどの芳香族溶媒、並びにジエチルエーテル、ジブチルエーテル、メチル t e r t - ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン (T H F)、又はジオキサンなどのエーテルである。反応は、低温、例えば - 100 ~ 0、又は - 78 ~ 0 で好適に実施される。一般に、化合物 3 は溶媒に分散させて、所望の温度まで冷却し、塩基、次いでアミノ化剤を加えるか、又はアミノ化剤、次いで塩基を加える、或いは塩基とアミノ化剤を同時に加える。H O S A は、トリエチルアミンなどのアミン塩基と組み合わせて好適に使用される。この場合、化合物 3 を - 30 ~ 0、好ましくは - 20 ~ - 10 に冷却して、この温度でアミン塩基、次に H O S A を加え、約 - 10 ~ 0 で反応を維持するのが好ましい。

30

【0189】

40

或いは、O - (ジフェニルホスホリル) ヒドロキシルアミンは、塩基、例えばリン酸水素ナトリウム、リン酸水素カリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、又は炭酸カリウムなどの無機塩基、具体的にはリン酸水素ナトリウムと組み合わせて使用することができる。この場合、化合物 3 を - 80 ~ - 30、特に - 80 ~ - 70 に冷却して、この温度で塩基、次に O - (ジフェニルホスホリル) ヒドロキシルアミンを加え、約 0 ~ 室温で反応を維持するのが好ましい。

【0190】

50

二工程反応では、化合物 3 をまず、S H 基を S - C l 基に変換する塩素化剤と反応させる。適切な塩素化剤は、例えば塩化スルフルル、N - クロロスクシンイミド (N C S)、次亜塩素酸ナトリウム、モノクロロアミン (N H₂ C l)、又は塩素 (F e C l₃ の存在下で好ましくは使用される) である。塩素化は、Synthesis 1987, 1987, 683-688, Tetrahe

dron 66(36), 2010, 7279-7287, J. Org. Chem. 59(4), 1994, 914-921, J. Org. Chem. 63, 1998, 4878-4888、又はJ. Chem Soc. 1938, 2114-2117において記載されている方法と同様に実施することができる。塩素化は、溶媒中で一般に行われる。適切な溶媒は、例えば、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、メチル *tert*-ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン、又はジオキサンなどのエーテルである。反応温度は広い範囲にわたり変えることができ、一般に 0 ~ 反応混合物の沸点（溶媒を使用する場合）である。次に、塩素化化合物は、単離することなく、アンモニア又は水酸化アンモニウムと反応させる。無水アンモニアを使用する場合、この反応は - 78 ~ - 33 で一般に行われる。水性アンモニア又は水酸化アンモニウムを使用する場合、この反応は 0 ~ 25 などのより高い温度で実施することもできる。反応は、溶媒中で一般に実施される。適切な溶媒は、例えば、上で列挙したエーテルであり、それらの中で、THF及びジオキサンなどの水混和性エーテルが好ましい。一般に、塩素化化合物を溶媒に溶かし、この中に、アンモニア又は水酸化アンモニウムを加える。反応は、例えば、Synthesis, 1987, 8, 683-688に記載されている通り実施することができる。塩素化/アミノ化はまた、ワンポット (one pot) 反応として行うこともできる。例えば、チオール 3 は塩素化剤 (NCS 又は水性次亜塩素酸ナトリウムなど)、及びエーテル溶媒 (THF 又は Et₂O など) 中の無水若しくは水性アンモニア、又は水と同時に反応させる。好ましいのは、THF と無水の液体アンモニアとの混合物中、- 33 における NCS との反応である。例えば、THF / 液体アンモニア中、- 78 で、NCS (N-クロロスクシンイミド) の溶液に THF 中のチオール 3 の溶液を加える。この溶液を - 30 まで温め、アンモニアが蒸発するまで攪拌する。或いは、0 で、水性アンモニア (25%) と水性次亜塩素酸ナトリウム (1N) との混合物に、水中のナトリウムチオレート (NaSR) の溶液を加える。ワンポット塩素化/アミノ化反応は、例えばTetrahedron 2010, 66, 7279-7287、又はJ. Org. Chem. 1994, 59, 914-921において記載されている通り実施することができる。

10

20

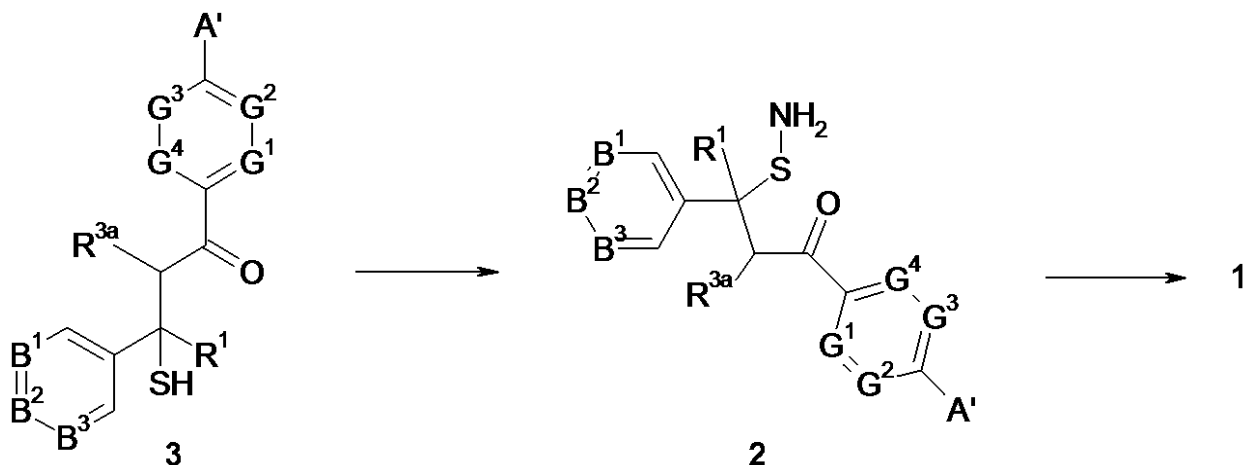
【0191】

化合物 2 は一般に、自然に閉環反応で反応して化合物 1 になるので、実質的に単離することができない。

スキーム 2

【化 20】

30

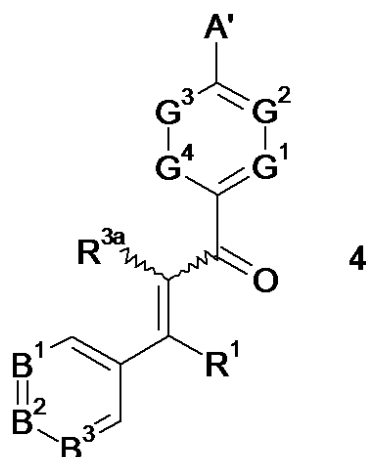


40

【0192】

式 3 の化合物は、式 4 の化合物

【化 2 1】



10

を硫黄源と反応させることにより調製することができる。適切な硫黄源は、例えば H_2S 、 NaSH 又は KSH などの金属硫化水素、 Na_2S 、 K_2S 、 Li_2S 、 Cu_2S 、 MgS 、 CaS 、 CuS 、 FeS などの金属硫化物、硫化アンモニウム $[(\text{NH}_4)_2\text{S}]$ 、硫化テトラメチルアンモニウム、硫化テトラエチルアンモニウム、硫化テトラプロピルアンモニウムなどの硫化テトラアルキルアンモニウム (R_4NSH)、又はビストリメチルシリルスルフィドである。硫黄源としての H_2S は、 Na_2CO_3 、 K_2CO_3 、 Cs_2CO_3 、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、酢酸セシウムなどの塩基、ジエチルアミン、ジプロピルアミン、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンなどのアミン、又はピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、ピリジン、ルチジンなどの塩基性窒素含有複素環の存在下で一般に使用される。或いは、硫黄源としての H_2S は、 AlCl_3 又は FeCl_3 などのルイス酸の存在下で使用することができる。化合物 4 と硫黄源との反応は、一般に溶媒中で実施され、適切な溶媒は、例えば、塩化メチレン又はクロロホルムなどの塩素化アルカン、及びベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン又はジクロロベンゼンなどの芳香族溶媒である。反応温度は、 $-78 \sim$ 室温などの広い範囲にわたり、変えることができる。一般に、化合物 4 を溶媒に溶かし、冷却してもよく、次に塩基（使用する場合）、次いで硫黄源を加える。或いは、化合物 4 は、化合物 3 をもたらす硫黄源と反応させて、このチオール基 SH において保護基 (S-PG) により保護することができる。これは、化合物 3 に例えばより厳しい精製条件を施すか、或いは例えば、前駆体基 A' を基 A に変換するため又はこの段階で基 A' を修飾するために誘導体化する場合、有利である。さらに、保護生成物の精製はより容易である。こうした保護チオールを与えるのに適した硫化試薬は、例えば、チオ尿素 ($\text{NH}_2 - \text{C}(=\text{S}) - \text{NH}_2$)、ベンジルチオール、 o -若しくは p -メトキシ-ベンジルチオール、 o -若しくは p -ヒドロキシベンジルチオール、 o -若しくは p -アセトキシベンジルチオール、 o -若しくは p -ニトロベンジルチオール、又は 2, 4, 6-トリメチルベンジルチオールなどの置換されていてもよいベンジルチオール、ピリジン-4-イル-メチルチオール、キノリン-2-イル-メチルチオール、ナトリウムベンジルスルフィドなどの金属ベンジルスルフィド、フェニルチオール、2, 4-ジニトロフェニルチオール、トリチルチオール、*tert*-ブチルチオール、式 $\text{R} - \text{C}(=\text{O}) - \text{NH} - \text{CH}_3 - \text{SH}$ (R は、メチル、*tert*-ブチル、アリル、フェニル、又はベンジルである) の化合物、2-トリメチルシラニル-エタンチオール、2-(2, 4-ジニトロフェニル)-エタンチオール、2-フェニルスルホニル-エタンチオール、メチルカルボニルチオール又はフェニルカルボニルチオールなどのアシル化チオール、及びチオカルバメート $\text{R} - \text{NH} - \text{C}(=\text{O}) - \text{SH}$ (R は、例えばメチル又はエチルである) である。ベンジル及びアルキルチオールは一般に、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、リン酸ナトリウム、リン酸カリウム、リン酸水素ナトリウム、リン酸水素カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド (LDA)、ナトリウムメタノレート、ナトリウムエタノレー

20

30

40

50

ト、カリウム *tert*-ブトキシド、水性テトラホウ酸ナトリウム、*n*-ブチルリチウム、*tert*-ブチルリチウム (*tert*-butyllithium)、フッ化テトラブチルアンモニウム (TBAF)、NaHMDSなどの塩基の存在下、或いはFeCl₃、Zn(ClO₄)₂、Cu(BF₄)₂、HBF₄若しくはHClO₄などのルイス酸又はブレンステッド酸の存在下で使用される。反応は一般に、溶媒中で行われ、適切な溶媒は、例えば塩化メチレン又はクロロホルムなどの塩素化アルカン、及びジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、メチル *tert*-ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、又はジオキサンなどのエーテルである。反応温度は、-25 ~ 反応混合物の沸点までなどの広い範囲にわたることができる。アシル化チオールは、無溶媒又は溶媒中で反応させることができ、適切な溶媒は、例えば塩化メチレン又はクロロホルムなどの塩素化アルカン、及びジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、メチル *tert*-ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、又はジオキサンなどのエーテルである。それらの溶媒は、塩基と共に又はそれなしで使用することができる。次に、S保護化合物3は、例えば、Peter G. M. Wuts, Theodora Greene, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 4th edition, John Wiley & Sons, Inc., 2007, Chapter 6において記載されているものなどの、個々の保護基に関して一般に公知の条件下で、遊離チオール3に脱保護することができる。

10

【0193】

化合物4は、欧州特許出願公開第EP-A-2172462号に記載されている方法と同様に調製することができる。

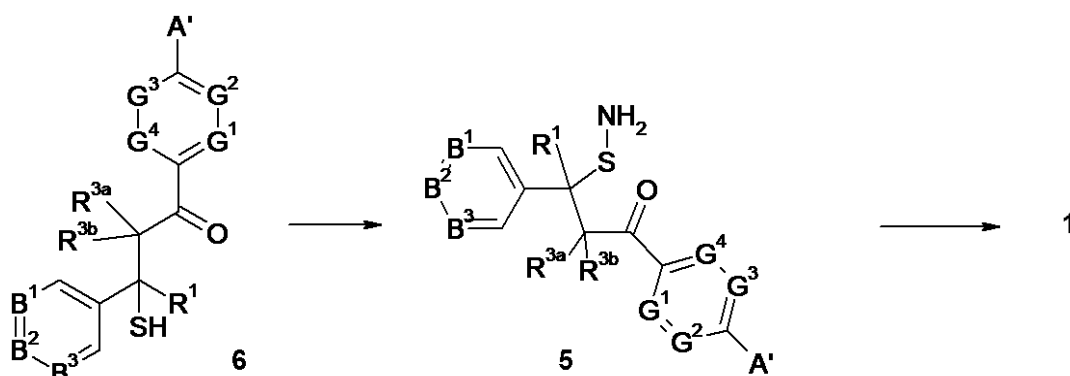
20

化合物1 (R^{3b}は必ずしも水素である必要はない)は、スキーム3に示されている通り、式6の化合物をアミノ化剤と反応させて式5の化合物にし、これが自然に反応して化合物1になることにより、代替的に調製することができる。この反応は、化合物3及び2のそれと同様に行うことができる。

【0194】

スキーム3

【化22】



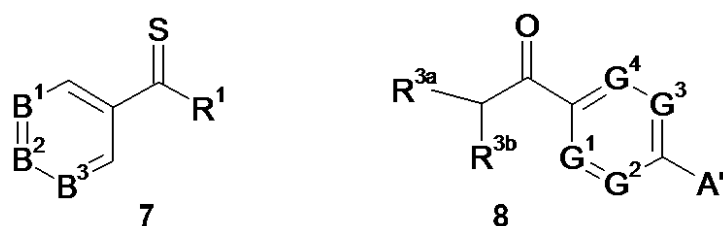
30

【0195】

式6の化合物は、式7の化合物を式8の化合物と反応させることにより得ることができる。

40

【化23】



反応は、Mukaiyamaアルドール反応として好ましくは実施される。この目的のため、TiCl₄又はBF₃[O(C₂H₅)₂]などのルイス酸の存在下で、8のトリアル

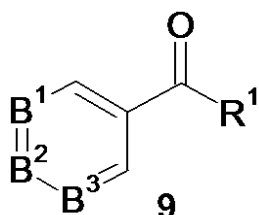
50

キルシリル - エノレート誘導体を 7 と反応させる。或いは、この反応は、リチウムジイソプロピルアミド (LDA)、ナトリウムビストリメチルシリルアミド (ナトリウムヘキサメチルジシラジド ; NaHMDS) などの強塩基、及びトリエチルアミン、トリプロピルアミン又はジイソプロピルエチルアミンなどのアミンの存在下で実施することができる。反応は一般に、溶媒中で実施される。リチウム又はナトリウム塩基を使用する場合、溶媒は、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、メチル t e r t - ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、又はジオキサンなどのエーテルが適している。適切な反応温度は、 - 78 ~ 25 の範囲である。アミン塩基を使用する場合、溶媒は、ジエチルエーテル、ジプロピルエーテル、メチル t e r t - ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、若しくはジオキサンなどのエーテル、又はペンタン、ヘキサン若しくはヘプタンなどのアルカンが適している。適切な反応温度は、 25 ~ 100 の範囲である。

【 0 1 9 6 】

式 7 の化合物は、式 9 の化合物

【化 2 4】



をローソン (Lawesson) 試薬又は P_2S_5 などの硫化剤と反応させることにより得ることができる。

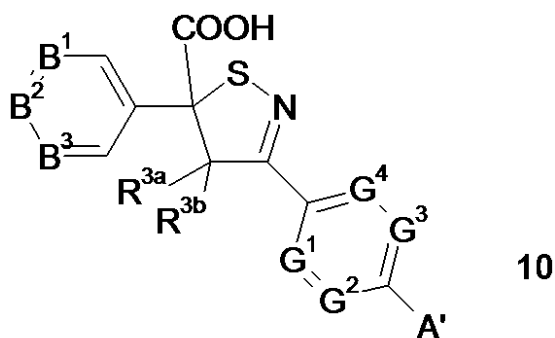
反応は一般に、溶媒中で行われ、適切な溶媒は、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン又はジクロロベンゼンなどの芳香族溶媒、ジエチルエーテル、ジブロピルエーテル、メチル *tert*-ブチルエーテル、メチルイソブチルエーテル、エチレンジリコールジメチルエーテル、テトラヒドロフラン (THF)、又はジオキサンなどのエーテル、及びヘキサメチルリン酸トリアミド (HMPA) である。反応は一般に、25 ~ 反応混合物の沸点までの温度で実施される。

【 0 1 9 7 】

R¹がC F₃である式Iの化合物はさらに、式10の化合物をフッ素化剤と反応させ、必要に応じて（すなわち、A'がAの前駆体である場合）基A'を基Aに変換することにより調製することができる。

【 0 1 9 8 】

【化 2 5】



【 0 1 9 9 】

適切なフッ素化剤は、例えば、好ましくは HF 又は $\text{BF}_3[\text{O}(\text{C}_2\text{H}_5)_2]$ と組み合わせた SF_4 、好ましくは HF 及びピリジンと組み合わせた三フッ化フェニル硫黄 (Ph-SF_3)、三フッ化 4 - tert - ブチル - 2 , 6 - ジメチルフェニル硫黄 (「Fluol」)、及び三フッ化ビス (2 - メトキシエチル) アミノ硫黄 [$(\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SF}_3)_2$)] を用いることができる。

$2) _2 \text{N S F}_3]$ である。これらの中で、好ましいのは、 H F と組み合わせた S F_4 である。 S F_4 を H F と組み合わせて使用する場合、反応は無溶媒、すなわちさらなる溶媒を何ら使用することなく実施される。反応は一般に、例えば $2 \sim 10 \text{ bar}$ 、好ましくは $5 \sim 8 \text{ bar}$ の圧力で、反応剤から生じる高圧下で実施される。反応温度は、 $25 \sim 120$ 、好ましくは $60 \sim 100$ などの広い範囲にわたり変えることができる。

【0200】

或いは、フッ素化は、二工程方法により実施することができ、この場合、イソチアゾリン環上のカルボキシル基をまず C C l_3 基に変換し、続いてこれをフッ素化して C F_3 基にする。 C O O H 基の C C l_3 基への変換は、化合物 V I を P C l_5 及びフェニルホスホロキシジクロリド ($\text{P h} - \text{P} (= \text{O}) \text{C l}_2$) と反応させることにより好ましくは実施される。この反応は、無溶媒、すなわちさらなる溶媒を何ら使用することなく実施することができる。好適には、この反応は高温、例えば 50 ～ 還流まで、好ましくは還流という高温で実施される。 C C l_3 基を C F_3 基に変換するためのフッ素化剤は上記のものであり、さらには H F 、及び S b C l_5 と組み合わせた H F 、並びに C l_2 及び S b F_3 と組み合わせた H F である。反応は、無溶媒、すなわちさらなる溶媒を何ら使用することなく実施することができる。反応温度は、広い範囲にわたり、例えば $25 \sim 300$ 、好ましくは $50 \sim 200$ 、特に $80 \sim 120$ と変えることができる。フッ素化剤が、 H F 、又はさらなる試剤と組み合わせた H F である場合、反応は一般に、 H F に由来する圧力、及び一般に $2 \sim 10 \text{ bar}$ 、好ましくは $5 \sim 8 \text{ bar}$ の範囲となる圧力で行われる。

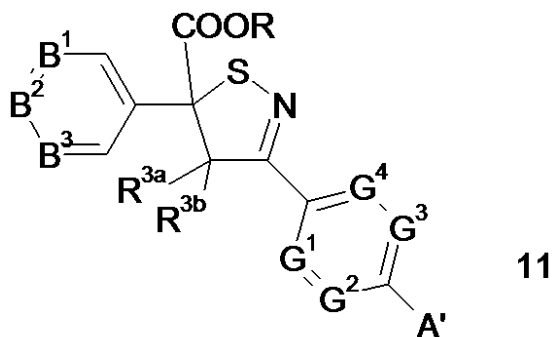
10

【0201】

式 10 の化合物は、式 11 の化合物

20

【化 26】



30

(式中、 R は $\text{C}_1 - \text{C}_4$ - アルキルである)

を加水分解することにより好ましくは得られる。

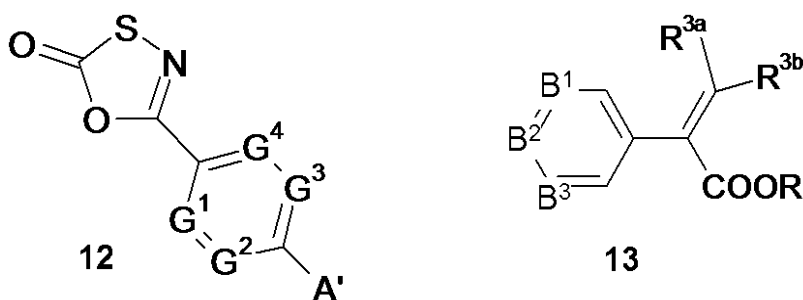
【0202】

加水分解は、例えば塩酸、臭化水素酸、硫酸、トリフルオロ酢酸などを使用する酸性条件など、或いは例えば L i O H 、 N a O H 、若しくは K O H などのアルカリ金属水酸化物、又は炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウムなどのアルカリ金属炭酸塩を使用する塩基性条件により、エステル基を加水分解するのに公知のいかなる適切な手段によっても実施することができる。

同様にして、式 11 の化合物は、化合物 12 を化合物 13

40

【化 27】



と反応させることにより得ることができる。

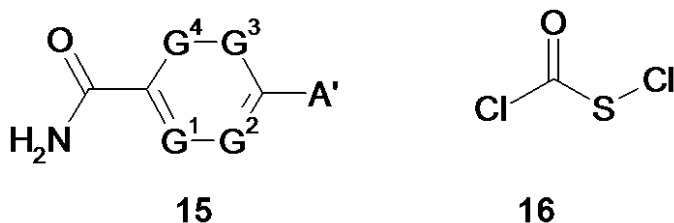
50

【 0 2 0 3 】

反応は、高温、例えば 90 ~ 200 、好ましくは 100 ~ 180 、特に 120 ~ 160 、例えば約 140 で行われる。

同様にして、式 12 の化合物は、化合物 15 を化合物 16

【 化 2 8 】



10

と反応させることにより得ることができる。

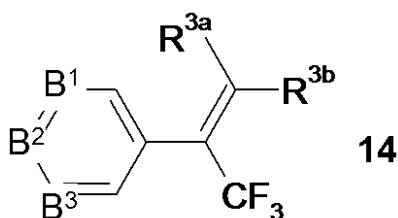
【 0 2 0 4 】

反応は一般に、溶媒中で行われ、適切な溶媒は、例えばベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン及びジクロロベンゼンなどの芳香族溶媒である。反応温度は、好ましくは 80 ~ 140 、より好ましくは 100 ~ 120 である。

しかし、 R^1 が CF_3 である式 I の化合物はさらに、上で定義した通りの式 12 の化合物を式 14 の化合物と反応させ、必要に応じて基 A' を基 A に変換することにより調製することができる。

【 化 2 9 】

20



【 0 2 0 5 】

反応は、高温、例えば 90 ~ 200 、好ましくは 100 ~ 180 、特に 120 ~ 160 、例えば約 140 で行われる。

A' が A の前駆体である、化合物 I' は、以下に示す通り、変換することができる。

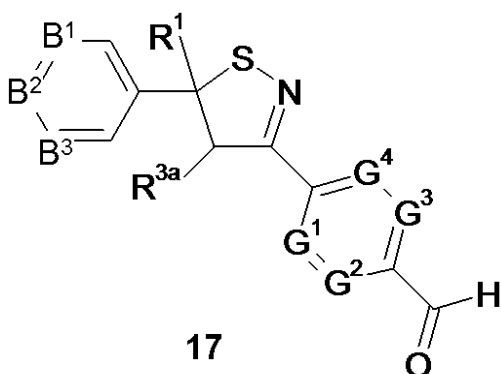
30

A' が Cl 、 Br 、 I 又は $-OSO_2-R^{z1}$ (R^{z1} は上で定義した通りである) である化合物 I' は、遷移金属錯体触媒、好ましくはパラジウム触媒の存在下、一酸化炭素及びトリエチルシランなどのヒドリド源と反応させてカルボニル化合物 17 にすることにより、化合物 I (A は基 $C(=W)N(R^5R^6)$ である) に変換することができる。この反応は、出発基 A' をカルボニル基 $-C(=O)H$ に変換するものである。

【 0 2 0 6 】

【 化 3 0 】

40



アルデヒド 17 はまた、エステル 18 (以下を参照されたい; $R = C_1 - C_4$ - アルキル) を水素化ジイソブチルアルミニウム (DIBAL-H) により還元して、アルデヒド 17 に直接、又は対応するアルコールを経て、次にこのアルコールを酸化してアルデヒドに

50

することにより得ることもできる。

【0207】

化合物 I を得るためには、次に、こうしたカルボニル化合物 17 を環式アミン（誘導体） $\text{NH}(\text{R}^5)\text{R}^6$ と反応させる。或いは、 A' が Cl 、 Br 、 I 若しくは $-\text{OSO}_2-\text{R}^z$ (R^z は上で定義した通りである) である化合物 I' は、遷移金属錯体触媒及び環式アミン $\text{NH}(\text{R}^5)\text{R}^6$ の存在下、一酸化炭素及び水素とワンポット反応で反応させることができる。

【0208】

或いは、 A' が Br 又は Cl である化合物 I' は、H e c k カルボニル化の意味での Pd 触媒アミノカルボニル化により、 A が基 $\text{C}(=\text{W})\text{N}(\text{R}^5\text{R}^6)$ である化合物 I に変換することができる。酢酸パラジウム (II) などの Pd 触媒の存在下、 Xanthos (4, 5 - ビス(ジフェニルホスフィノ) - 9, 9 - ジメチルキサンテン) などのホスフィン配位子の存在下で、アリールハライド化合物 I' を一酸化炭素及び環式アミン $\text{NH}(\text{R}^5)\text{R}^6$ と反応させる。通常、この反応は塩基の存在下で行われる。適切な塩基は、炭酸ナトリウム若しくは炭酸カリウムなどの炭酸アルカリ金属塩、又はリン酸カリウムなどリン酸アルカリ金属塩、又はナトリウムフェノキシドである。

10

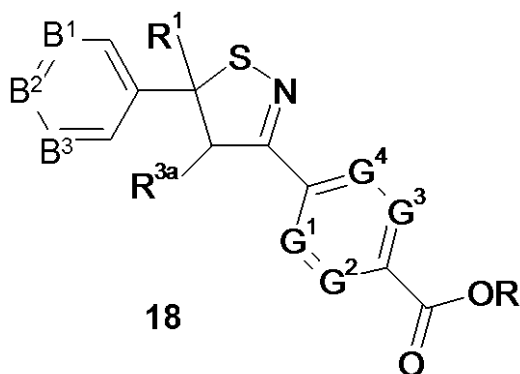
【0209】

W が O である化合物 I は、パラジウム触媒及びアルコール ROH (R は、 $\text{C}1 - \text{C}4$ - アルキルである) の存在下、化合物 I' (A' は Cl 、 Br 、 I 又はトリフレートである) を一酸化炭素と反応させて式 18 の化合物にすることにより調製することができる。適切なパラジウム触媒は、例えば $\text{PCT/EP}2011/060388$ に記載されているものである。

20

【0210】

【化 31】



30

次に、このエステルを各カルボン酸に加水分解し、これを標準的なアミド化条件下で、環式アミン NHR^5R^6 と反応させる。加水分解は、標準条件、例えば塩酸、硫酸又はトリフルオロ酢酸を使用する酸性条件下、又は例えば LiOH 、 NaOH 、若しくは KOH などのアルカリ金属水酸化物を使用する塩基性条件下で実施することができる。アミド化は、カルボン酸を塩化オキサリル [$(\text{COCl})_2$] 又は塩化チオニル (SOCl_2) により活性化して個々の酸塩化物にし、次いでアミン NHR^5R^6 と反応させることにより好ましくは実施される。或いは、アミド化は、カップリング試薬の存在下で実施される。適切なカップリング試薬（活性化剤）は周知であり、例えば、カルボジイミド、例えば、 DCC (ジシクロヘキシルカルボジイミド) 及び DCI (ジイソプロピルカルボジイミド)、ベンゾトリアゾール誘導体、例えば、 HATU ($\text{O} - (7 - \text{アザベンゾトリアゾール} - 1 - \text{イル}) - \text{N}, \text{N}, \text{N}', \text{N}' - \text{テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート}$)、 HBTU ($(\text{O} - \text{ベンゾトリアゾール} - 1 - \text{イル}) - \text{N}, \text{N}, \text{N}', \text{N}' - \text{テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート}$) 及び HCTU ($1\text{H} - \text{ベンゾトリアゾリウム} - 1 - [\text{ビス(ジメチルアミノ)メチレン}] - 5 - \text{クロロテトラフルオロボレート}$)、並びにホスホニウム由来の活性化剤、例えば、 BOP ($(\text{ベンゾトリアゾール} - 1 - \text{イルオキシ}) - \text{トリス(ジメチルアミノ)ホスホニウムヘキサフルオロホスフェート}$)、 $\text{Py} - \text{BO}$

40

50

P ((ベンゾトリアゾール - 1 - イルオキシ) - トリピロリジンホスホニウムヘキサフルオロホスフェート) 及び P y - B r O P (プロモトリピロリジンホスホニウムヘキサフルオロホスフェート) から選択される。一般に、活性化剤は過剰に使用される。ベンゾトリアゾール及びホスホニウムカップリング試薬は、一般に塩基性媒体中で使用される。

【 0 2 1 1 】

W が S である化合物 I は、対応するオキソ化合物 (W は O である) とローソン試薬 (C A S 1 9 1 7 2 - 4 7 - 5) とを反応させることにより調製することができ、例えば、Je s b e r g e r e t a l . , S y n t h e s i s , 2003, 1929-1958、及びその参考文献を参照されたい。6 0 ~ 1 0 0 などの高温で、H M P A 又は T H F などの溶媒を使用することができる。好ましい反応条件は、6 5 において T H F である。

10

【 0 2 1 2 】

一般に、その立体異性体、塩、及び N - オキシドを含む式 (I) の化合物、及び合成法におけるその前駆体は、上記の方法により調製することができる。個々の化合物を上記の経路を経て調製することができない場合、他の化合物 (I) 又は個々の前駆体の誘導体化によって、又は記載されている合成経路の慣用的な改変によって調製することができる。例えば、個々の場合、ある種の式 (I) の化合物は、誘導体化によって、例えばエステル加水分解、アミド化、エステル化、エーテルの開裂、オレフィン化、還元、酸化などにより、又は記載されている合成経路の慣用的な改変によって式 (I) の他の化合物から有利に調製することができる。

【 0 2 1 3 】

反応混合物は、慣用的な方法で、例えば水と混合して相を分離することにより、及び適切な場合、クロマトグラフィーにより、例えばアルミナ上又はシリカゲル上で粗生成物を精製することにより後処理が行われる。一部の間mediate及び最終生成物は、無色又は淡褐色の粘性油状物の形態で得ることができ、これを、減圧下、及び中程度の高温で揮発性成分を不含にするか、又は精製する。中間体及び最終生成物が固体として得られる場合は、それらを再結晶又は粉末化することにより精製することができる。

20

本発明の化合物は、その優れた活性によって、無脊椎有害生物の防除に使用することができる。

したがって、本発明はまた、無脊椎有害生物を防除する方法であって、有害生物、それらの餌供給源、それらの生息地若しくはそれらの繁殖地、又は有害生物が成長中であるか若しくは成長し得る栽培植物、植物繁殖材料 (種子など) 、土壌、区域、資材若しくは環境、又は有害生物の攻撃若しくは侵襲から保護すべき資材、栽培植物、植物繁殖材料 (種子など) 、土壌、表面若しくは空間を、上で定義されている本発明の化合物又は組成物の殺有害生物有効量で処理するステップを含む、方法を提供する。本発明はまた、無脊椎有害生物を駆除するための、本発明の化合物、その立体異性体及び / 又は農業的に若しくは獣医学的に許容される塩の使用に関する。

30

【 0 2 1 4 】

好ましくは、本発明の方法は、植物繁殖材料 (種子など) 、及びそこから生長する植物を、無脊椎有害生物の攻撃又は侵襲から保護するのに役立ち、且つ植物繁殖材料 (種子など) を、上で定義した本発明の化合物の殺有害生物有効量又は上で定義した及び下で定義する農業用組成物の殺有害生物有効量で処理するステップを含む。本発明の方法は、本発明によって処理された「基体 (s u b s t r a t e) 」 (植物、植物繁殖材料、土壌資材など) の保護に限定されないだけでなく、予防効果、すなわち、例えば処理された植物繁殖材料 (種子など) から生長し、その植物自体は処理されていない植物に応じた保護も有している。

40

或いは、好ましくは、本発明の方法は、無脊椎有害生物による攻撃又は侵襲から植物を保護するのに役立ち、この方法は、該植物を少なくとも 1 つの本発明の化合物、その立体異性体及び / 又は少なくとも 1 つの農業的に許容されるその塩の殺有害生物有効量で処理するステップを含む。

【 0 2 1 5 】

50

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

本発明はさらに、無脊椎有害生物を駆除するための農業用組成物であって、殺有害生物作用を有するほどの量の本発明による少なくとも1つの化合物、及び農業的に許容される少なくとも1種の不活性液体及び/又は固形担体、並びに所望の場合、少なくとも1種の界面活性剤を含む、農業用組成物を提供する。

こうした組成物は、本発明の単一の活性化合物、又は本発明のいくつかの活性化合物の混合物を含んでもよい。本発明による組成物は、個々の異性体若しくは異性体の混合物、又は塩、及び個々の互変異性体又は互変異性体の混合物を含んでもよい。

【0216】

本発明の化合物は、それらの塩、立体異性体及び互変異性体を含めて、クモ形類、多足類(myriapede)及び昆虫、並びに線虫などの節足有害生物を効果的に防除するのに特に適している。それらはとりわけ、以下の有害生物を効果的に駆除又は防除するのに適している。

鱗翅目(鱗翅類(Lepidoptera))の目からの昆虫、例えば、オオケンモン(Acrionicta major)、コカクモンハマキ(Adoxophyes orana)、ナカジロシタバ(Aedia leucomelas)、アグロチス属の種(Agrothis spp.)、例えば、アグロチス・フコサ(Agrothis fucosa)、アグロチス・セゲツム(Agrothis segetum)、アグロチス・イプシロン(Agrothis ypsilon)、アラバマ・アルギラセア(Alabama argillacea)、アンティカルシア・ゲマタリス(Anticarsia gemmatalis)、アンティカルシア属の種(Anticarsia spp.)、リンゴヒメシンクイ(Argyresthia conjugella)、ガンマキンウバ(Autographa gamma)、バラトラ・ブラシカエ(Barathra brassicae)、ブツカラトリツクス・スルベリエラ(Bucculatrix thurberielia)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、カコエシア・ムリナナ(Cacoecia murinana)、カコエシア・ポダナ(Cacoecia podana)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、カルボカプサ・ポモネラ(Carpocapsa pomonella)、ケイマトビア・ブルマータ(Cheimatobia brumata)、キロ属の種(Chilo spp.)、例えば、ニカメイガ(Chilo suppressalis)、コリストネウラ・フミフェラナ(Choristoneura fumiferana)、コリストネウラ・オシデンタリス(Choristoneura occidentalis)、シルフィス・ウニブクタ(Cirphis unipuncta)、ブドウホソハマキ(Clysia ambiguella)、クナファロセルス属の種(Cnaphalocerus spp.)、シディア・ポモネラ(Cydia pomonella)、デンドロリムス・ピニ(Dendrolimus pini)、ジアファニア・ニチダリス(Diaphania nitidalis)、ジアトラエア・グランジオセラ(Diatraea grandiosella)、ミスジアオリング(Earias insulana)、モロコシマダラメイガ(Elasmopalpus lignosellus)、エフェスチア・カウテラ(Ephestia cautella)、エフェスチア・クエニエラ(Ephestia kuehniella)、ブドウホソハマキ(Eupoecilia ambiguella)、ユープロクティス・クリソロエア(Euproctis chrysorrhoea)、エウクソア属の種(Euxoa spp.)、エベトリア・ボウリアナ(Evetria bouliana)、フェルチア属の種(Feltia spp.)、例えば、フェルチア・スブテラネア(Feltia subterranean)、ハチノスツツリガ(Galleria mellonella)、スモモヒメハマキ(Grapholitha funebris)

10

20

30

40

50

na)、ナシヒメシンクイ (*Grapholitha molesta*)、ヘリコベルパ
 属の種 (*Helicoverpa* spp.)、例えば、オオタバコガ (*Helicov
 erpa armigera*)、ヘリコベルパ・ゼア (*Helicoverpa zea*)、
 ヘリオティス属の種 (*Heliothis* spp.)、例えば、ヘリオティス・ア
 ルミゲラ (*Heliothis armigera*)、ヘリオティス・ビレセンス (*He
 liothis virescens*)、ヘリオティス・ゼア (*Heliothis z
 ea*)、ハイマダラノメイガ (*Heliothis undalis*)、ヒベルニア・デホリ
 アリア (*Hibernia defoliaria*)、チャイロマルハキバガ (*Hofm
 annophila pseudospirella*)、チャハマキ (*Homona
 magnanima*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ヒ
 ポノメウタ・パデラ (*Hyponomeuta padella*)、ヒポノメウタ・マリ
 ネルス (*Hyponomeuta malinellus*)、ケイフェリア・リコベルシ
 ケラ (*Keiferia lycopersicella*)、ランブジナ・フィセラリア
 (*Lambdina fiscellaria*)、ラフィグマ属の種 (*Laphygma
 spp.*)、例えば、ラフィグマ・エキシグア (*Laphygma exigua*)、
 ロイコプテラ・コフエエラ (*Leucoptera coffeella*)、ロイコプテ
 ラ・シテラ (*Leucoptera scitella*)、リトコレチス・ブランカルデ
 ラ (*Lithocolletis blancardella*)、リトファネ・アンテン
 ナタ (*Lithophane antennata*)、ロベシア・ボトラナ (*Lobes
 ia botrana*)、ロキサグロチス・アルビコスタ (*Loxagrotis al
 bicosta*)、ロクソステゲ・スチクチカリス (*Loxostege sticti
 calis*)、マイマイガ属の種 (*Lymantria* spp.)、例えば、マイマイ
 ガ (*Lymantria dispar*)、ノンネマイマイ (*Lymantria mo
 nacha*)、モモハモグリガ (*Lymantria clerkella*)、オビカレハ
 (*Malacosoma neustria*)、マメストラ属の種 (*Mamestra
 spp.*)、例えば、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、モシス・レ
 パンダ (*Mocis repanda*)、アワヨトウ (*Mythimna separa
 ta*)、オルギア・プソイドツガタ (*Orgyia pseudotsugata*)、オ
 リア属の種 (*Oria* spp.)、オストリニア属の種 (*Ostrinia* spp.
)、例えば、オストリニア・ヌビラリス (*Ostrinia nubilalis*)、イ
 ネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、パノリス・フランメア (*Panolis
 flammea*)、ペクチノフォラ属の種 (*Pectinophora* spp.)
 、例えば、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、ニ
 セタマナヤガ (*Peridroma saucia*)、ファレラ・ブセファラ (*Phal
 era bucephala*)、フトリメーア属の種 (*Phthorimaea* spp.
)、例えば、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、ミ
 カンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*)、シロチョウ属の種
 (*Pieris* spp.)、例えば、オオモンシロチョウ (*Pieris brass
 icae*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ブラチペナ・スカブラ (*P
 lathypena scabra*)、プルテッラ・マクリペンニス (*Plutella
 maculipennis*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、
 プロデニア属の種 (*Prodenia* spp.)、プセウダレチア属の種 (*Pseud
 aletia* spp.)、プソイドブルシア・インクリデンス (*Pseudoplus
 ia includens*)、ピラウスタ・ヌビラリス (*Pyrausta nubil
 alis*)、リアキオニア・フルストラナ (*Rhyacionia frustrana*)、
 スクロビパルブラ・アブソルタ (*Scrobipalpula absoluta*)、
 バクガ (*Sitotroga cerealella*)、テングハマキ (*Sparga
 nothis pilleriana*)、スポドプテラ属の種 (*Spodoptera
 spp.*)、例えば、スポドプテラ・フルギベルダ (*Spodoptera frugi
 perda*)、スポドプテラ・リトラリス (*Spodoptera littorali*

s)、ハスモンヨトウ(*Spodoptera litura*)、タウマトボエア・ピチ
オカンパ(*Thaumatopoea pityocampa*)、テルメシア・ゲマタリ
ス(*Thermesia gemmatalis*)、チネア・ペリオネラ(*Tinea*
pellionella)、コイガ(*Tineola bisselliella*)、ト
ルトリクス・ビリダナ(*Tortrix viridana*)、トリコブルシア属の種(*Trichoplusia* spp.)、例えば、イラクサギンウワバ(*Trichop*
lusia ni)、ツタ・アブソルタ(*Tuta absoluta*)、及びゼイラフ
ェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)、

【0217】

カブトムシ(*beetles*) (甲虫類(*Coleoptera*))、例えば、インゲン
マメゾウムシ(*Acanthoscehdess obtectus*)、アドレツス属の種
(*Adoretus* spp.)、アゲラスティカ・アルニ(*Agelastica a*
lni)、アグリルス・シヌアツス(*Agriilus sinuatus*)、アグリオテ
ス属の種(*Agriotes* spp.)、例えば、アグリオテス・フシコリス(*Agri*
otes fuscicollis)、アグリオテス・リネアツス(*Agriotes*
lineatus)、アグリオテス・オブスクルス(*Agriotes obscur*
us)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(*Amphimallus solstit*
ialis)、アニサンドルス・ジスパル(*Anisandrus dispar*)、ア
ノビウム・プンクタツム(*Anobium punctatum*)、ヒメコガネ(*Ano*
mala rufocuprea)、アノプロフォラ属の種(*Anoplophora* 20
spp.)、例えば、ツヤハダゴマダラカミキリ(*Anoplophora glabr*
ipennis)、イチゴハナゾウムシ属の種(*Anthonomus* spp.)、例
えば、アントノムス・グランディス(*Anthonomus grandis*)、アント
ノムス・ポモルム(*Anthonomus pomorum*)、ヒメマルカツオブシムシ
属の種(*Anthrenus* spp.)、アフトナ・ユーホリダエ(*Aphthona*
euphoridae)、アボゴニア属の種(*Apogonia* spp.)、アソウ
ス・ハエモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア
属の種(*Atomaria* spp.)、例えば、アトマリア・リネアリス(*Atoma*
ria linearis)、アタゲヌス種の属(*Attagenus* spp.)、ウ
リハムシ(*Aulacophora femoralis*)、ブラストファガス・ピニペ
ルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダタ(*B*
litophaga undata)、ブルキディウス・オブテクタス(*Bruchid*
ius obtectus)、ブルーカス属の種(*Bruchus* spp.)、例えば
、ブルーカス・レンチス(*Bruchus lentis*)、エンドウゾウムシ(*Bru*
chus pisorum)、ソラマメゾウムシ(*Bruchus rufimanus*
)、ビクチスクス・ベツラ(*Byctiscus betulae*)、アズキマメゾウム
シ(*Callosobruchus chinensis*)、カメノコハムシ(*Cass*
ida nebulosa)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifur*
cata)、セトニア・アウラタ(*Cetonia aurata*)、ケウトリンクス
属の種(*Ceuthorrhynchus* spp.)、例えば、ケウトリンクス・アッシ
ミリス(*Ceuthorrhynchus assimilis*)、ケウトリンクス・ナ
ピ(*Ceuthorrhynchus napi*)、ケトクネマ・ティビアリス(*Cha*
etocnema tibialis)、クレオヌス・メンジクス(*Cleonus m*
endicus)、コノデルス種の属(*Conoderus* spp.)、例えば、コノ
デルス・ベスベルティヌス(*Conoderus vespertinus*)、コスモボ
リテス属の種(*Cosmopolites* spp.)、コステリトラ・ゼアランジカ(*Costelytra*
zealandica)、クリオセリス・アスパラギ(*Crioceris asparagi*)、ヤナギシリジロゾウムシ(*Cryptorhynchus*
lapathi)、クテニセラ(*Ctenicera*) 亜種、例えば、クテニセラ
・デストルクトル(*Ctenicera destructor*)、シギゾウムシ属の種 50

(*Curculio* spp.)、デクテス・テキサヌス(*Dectes texanus*)、デルメステス属の種(*Dermestes* spp.)、ジアブロチカ属の種(*Diabrotica* spp.)、例えば、ジアブロチカ12-ブンクタタ・ジアブロチカ・スペシオサ(*Diabrotica 12-punctata Diabrotica speciosa*)、ジアブロチカ・ロングコルニス(*Diabrotica longicornis*)、ジアブロチカ・セミブンクタタ(*Diabrotica semipunctata*)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(*Diabrotica virgifera*)、エピラクナ属の種(*Epilachna* spp.)、例えば、エピラクナ・バリベステイス(*Epilachna varivestis*)、オオニジウヤホシテントウ(*Epilachna vigintioctomaculata*)、エピトリックス属の種(*Epitrix* spp.)、例えば、エピトリックス・ヒルチペンニス(*Epitrix hirtipennis*)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、ファウスチヌス・クバエ(*Faustinus cubae*)、セマルヒョウホンムシ(*Gibbium psylloides*)、ヘテロニクス・アラトル(*Heteronychus arator*)、ヒラモルファ・エレガンス(*Hylamorpha elegans*)、ヒロビウス・アビエチス(*Hyllobius abietis*)、ヒロトルペス・バユルス(*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ・ブルネイペンニス(*Hypera brunneipennis*)、ヒペラ・ポスティカ(*Hypera postica*)、ハイボセネムス属の種(*Hypothenemus* spp.)、ヤツバキクイムシ(*Ips typographus*)、ラクノステルナ・コンサンゲイネア(*Lachnoster na consanguinea*)、レマ・ビリネアタ(*Lema bilineata*)、レマ・メラノプス(*Lema melanopus*)、レプチノタルサ属の種(*Leptinotarsa* spp.)、例えば、レプチノタルサ・デセムリネアタ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リモニウス・カリホルニカス(*Limoni us californicus*)、イネミズゾウムシ(*Lissorhopt rus oryzophilus*)、イネミズゾウムシ、リクサス属の種(*Lixus* spp.)、リクタス属の種(*Lyctus* spp.)、例えば、リクタス・ブルネウス(*Lyctus bruneus*)、メラノツス・コンムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス属の種(*Meligethes* spp.)、例えば、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ・ヒボカスタニ(*Melolontha hippocastani*)、メロロンタ・メロロンタ(*Melolontha melolontha*)、ミグドルス属の種(*Migdolu s* spp.)、モノシャムス属の種(*Monochamus* spp.)、例えば、マツノマダラカミキリ(*Monochamus alternatus*)、ナウバクツス・キサントグラフス(*Naupactus xanthographus*)、ニプトウス・ホロレウクス(*Niptus hololeucus*)、サイカブトムシ(*Orycte s rhinoceros*)、ノコギリヒラタムシ(*Oryzaephilus sur inamensis*)、オチオリンクス・スルカタス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オバタス(*Otiorrhynchus ovatus*)、オチオリンクス・スルカタス、イネドロオイムシ、コアオハナムグリ(*Oxyc etonia jucunda*)、ファエドン・コクレアリアエ(*Phaedon co chleariae*)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga* spp.)、フィロトレタ属の種(*Phyllot reta* spp.)、例えば、フィロトレタ・クリソセファラ(*Phyllotret a chrysocephala*)、フィロトレタ・ネモルム(*Phyllotreta nemorum*)、キスジノミハムシ(*Phyllotreta striolata*)、フィロファガ属の種、フィロペルタ・ホルチコラ、マメコガネ(*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属の種(*Premnotrypes* spp.)

、プシリオデス・クリンセファラ (*Psylliodes chrysocephala*)、プチナス属の種 (*Ptinus* spp.)、リゾビウス・ベントラリス (*Rhizobius ventralis*)、コナナガシンクイ (*Rhizopertha dominica*)、アカアシチピコフキゾウムシ (*Sitona lineatus*)、コクゾウムシ属の種 (*Sitophilus* spp.)、例えば、シトフィルス・グラナリア (*Sitophilus granaria*)、シトフィルス・ゼアマイス (*Sitophilus zeamais*)、スフェノフォラス属の種 (*Sphenophorus* spp.)、例えば、スフェノフォラス・レビス (*Sphenophorus leviss*)、ステルネクス属の種 (*Sternechus* spp.)、例えば、ステルネクス・スブシグナツス (*Sternechus subsignatus*)、シンフィレテス属の種 (*Symphyletes* spp.)、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、トリボリウム属の種 (*Tribolium* spp.)、例えば、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*)、トロゴデルマ属の種 (*Trogoderma* spp.)、チキアス属の種 (*Tychius* spp.)、トラカミキリ属の種 (*Xylotrechus* spp.)、及びザブルス属の種 (*Zabrus* spp.)、例えば、ザブルス・テネブリオイデス (*Zabrus tenebrioides*)、

ハエ (*flies*)、カ (*mosquitoes*) (双翅類 (*Diptera*))、例えば、ヤブカ属の種 (*Aedes* spp.)、例えば、ネツタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*)、キンイロヤブカ (*Aedes vexans*)、メキシコミバエ (*Anastrepha ludens*)、アノフェレス属の種 (*Anopheles* spp.)、例えば、アノフェレス・アルビマナス (*Anopheles albimanus*)、アノフェレス・クルキアン (*Anopheles crucians*)、アノフェレス・フレエボルニ (*Anopheles freeborni*)、アノフェレス・ガムビエ (*Anopheles gambiae*)、アノフェレス・ロイコスフィラス (*Anopheles leucosphyrus*)、アノフェレス・マキュリペンニス (*Anopheles maculipennis*)、アノフェレス・ミニマス (*Anopheles minimus*)、アノフェレス・クアドリマクラタス (*Anopheles quadrimaculatus*)、シナハマダラカ (*Anopheles sinensis*)、ビビオ・ホルツラヌス (*Bibio hortulanus*)、カリフォラ・エリスロセファラ (*Calliphora erythrocephala*)、カリフォラ・ビシナ (*Calliphora vicina*)、チチュウカイミバエ (*Cerafititis capitata*)、チチュウカイミバエ (*Ceratititis capitata*)、クリソミア属の種 (*Chrysomyia* spp.)、例えば、クリソミア・ベジアナ (*Chrysomya bezziana*)、クリソミア・ホミニボラキス (*Chrysomya hominivorax*)、クリソミア・マセラリア (*Chrysomya macellaria*)、クリソプス・アトランチクス (*Chrysops atlanticus*)、クリソプス・ディスカリス (*Chrysops discalis*)、クリソプス・シラセア (*Chrysops silacea*)、コクリオミヤ属の種 (*Cochliomyia* spp.)、例えば、コクリオミヤ・ホミニボラキス (*Cochliomyia hominivorax*)、コンタリニア属の種 (*Contarinia* spp.)、例えば、コンタリニア・ソルギコラ (*Contarinia sorghicola*)、コルディオロビア・アンソロポファガ (*Cordylobia anthropophaga*)、クレクス属の種 (*Culex* spp.)、例えば、クレクス・ニグリバルプス (*Culex nigripalpus*)、クレクス・ピピエン (*Culex pipiens*)、クレクス・クウィンクウェファスキアトゥス (*Culex quinquefasciatus*)、クレクス・タルサリス (*Culex tarsalis*)、クレクス・トリタエニオルヒュンクス (*Culex tritaeniorhynchus*)、クリコイデス・フレンス (*Culicoides furens*)、クリセタ・イノルナ

タ (*Culiseta inornata*)、クリセタ・メラヌラ (*Culiseta melanura*)、ウサギヒフバエ属の種 (*Cuterebra* spp.)、ウリミバエ (*Dacus cucurbitae*)、オリーブミバエ (*Dacus oleae*)、ダイコンタマバエ (*Dasineura brassicae*)、デリア属の種 (*Delia* spp.)、例えば、デリア・アンチクエ (*Delia antique*)、デリア・コアルクタタ (*Delia coarctata*)、タネバエ (*Delia platura*)、デリア・ラジクム (*Delia radicum*)、ヒトヒフバエ (*Dermatobia hominis*)、ドロソフィラ属の種 (*Drosophila* spp.)、ファニア属の種 (*Fannia* spp.)、例えば、ファニア・カニクラリス (*Fannia canicularis*)、ガステロフィルス属の種 (*Gasterophilus* spp.)、例えば、ガステロフィルス・インテスチナリス (*Gasterophilus intestinalis*)、ゲオミザ・トリプンクタタ (*Geomyza Tripunctata*)、グロッシナ・フスシペス (*Glossina fuscipes*)、グロッシナ・モラシタンス (*Glossina morsitans*)、グロッシナ・パルパリス (*Glossina palpalis*)、グロッシナ・タキノイデス (*Glossina tachinoides*)、ノサシバエ (*Haematobia irritans*)、ハプロジプロシス・エクエストリス (*Haplodiplosis equestris*)、ヒッペラテス属の種 (*Hippelates* spp.)、ヒレミア属の種 (*Hylemyia* spp.)、例えば、ヒレミア・ブラツラ (*Hylemyia platura*)、ヒフバエ属の種 (*Hypoderma* spp.)、例えば、キスジウシバエ (*Hypoderma lineata*)、ヒッポボスカ属の種 (*Hyppobosca* spp.)、レプトコノプス・トレンス (*Leptocnops torrens*)、リリオミザ属の種 (*Liriomyza* spp.)、例えば、トマトモグリバエ (*Liriomyza sativae*)、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifolii*)、ルシリア属の種 (*Lucilia* spp.)、例えば、ルシリア・カプリナ (*Lucilia caprina*)、ヒツジキンバエ (*Lucilia cuprina*)、ルシリア・セリカータ (*Lucilia sericata*)、リコリア・ペクトラリス (*Lycoria pectoralis*)、マンソニア・ティティラヌス (*Mansonnia titillanus*)、マイエチオラ属の種 (*Mayetiola* spp.)、例えば、マイエチオラ・デストルクトル (*Mayetiola destructor*)、イエバエ属の種 (*Musca* spp.)、例えば、ムスカ・オータムナリス (*Musca autumnalis*)、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Muscina stabulans*)、オエストルス属の種 (*Oestrus* spp.)、例えば、ヒツジバエ (*Oestrus ovis*)、オボミザ・フロルム (*Opomyza florum*)、オシネラ属の種 (*Oscinella* spp.)、例えば、オシネラ・フリト (*Oscinella frit*)、ペゴミア・ヒソシアミ (*Pegomya hysocyami*)、フレボトムス・アルゲンチペス (*Phlebotomus argentipes*)、ホルビア属の種 (*Phorbia* spp.)、例えば、ホルビア・アンチクア (*Phorbia antiqua*)、ホルビア・ブラッシカ (*Phorbia brassicae*)、ホルビア・コアルクタタ (*Phorbia coarctata*)、プロシムリウム・ミクスタム (*Prosimulium mixtum*)、ニンジンサビバエ (*Psila rosae*)、プソロフォラ・コルムビエ (*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ディスカラ (*Psorophora discolor*)、ヨーロッパアウトウミバエ (*Rhagoletis cerasi*)、リンゴミバエ (*Rhagoletis pomonella*)、サルコファガ属の種 (*Sarcophaga* spp.)、例えば、サルコファガ・ヘモロイダリス (*Sarcophaga hemorroidalis*)、シムリウム・ウィッタツム (*Simulium vittatum*)、ストモキシス属の種 (*Stomoxys* spp.)、例えば、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、タバヌス属の種 (*Tabanus* sp

p.)、例えば、タバヌス・アトラタス (*Tabanus atratus*)、タバヌス・ボビヌス (*Tabanus bovinus*)、タバヌス・リネオラ (*Tabanus lineola*)、タバナス・シミリス (*Tabanus similis*)、タニア属の種 (*Tannia* spp.)、チブラ・オレラセア (*Tipula oleracea*)、チブラ・パルドサ (*Tipula paludosa*)、及びウォルフアルティア属の種 (*Wohlfahrtia* spp.)、

【0218】

アザミウマ (*thrips*) (総翅類 (*Thysanoptera*))、例えば、バリオトリプス・ピフォルミス (*Baliothrips biformis*)、ジクロモトリプス・コルベッチ (*Dichromothrips corbetti*)、ジクロモトリプス (*Dichromothrips*) 亜種、エネオトリプス・フラベンス (*Enneothrips flavens*)、フランクリニエラ属の種 (*Frankliniella* spp.)、例えば、フランクリニエラ・フスカ (*Frankliniella fusca*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、フランクリニエラ・トリチシ (*Frankliniella tritici*)、ヘリオスリップス属の種 (*Heliothrips* spp.)、クリバネアザミウマ (*Hercinothrips femoralis*)、カコスリップス属の種 (*Kakothrips* spp.)、リピフォロスリップス・クルエンタツツス (*Rhipiphorothrips cruentatus*)、シルトスリップス属の種 (*Scirtothrips* spp.)、例えば、シルトスリップス・シトリ (*Scirtothrips citri*)、タエニオトリプス・カルダモニ (*Taeniothrips cardamoni*)、アザミウマ属の種、例えば、イネアザミウマ (*Thrips oryzae*)、ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、

【0219】

シロアリ (*termites*) (等翅類 (*Isoptera*))、例えば、カロテルメス・フラビコリス (*Calotermes flavicollis*)、イエシロアリ (*Optotermes formosanus*)、ヘテロテルメス・アウレウス (*Heterotermes aureus*)、ヘテロテルメス・ロンギセプス (*Heterotermes longiceps*)、ヘテロテルメス・テヌイス (*Heterotermes tenuis*)、ロイコテルメス・フラビペス (*Leucotermes flavipes*)、オドントテルメス属の種 (*Odontotermes* spp.)、ヤマトシロアリ属の種 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、ヤマトシロアリ (*Reticulitermes speratus*)、レディクリテルメス・フラウイペス (*Reticulitermes flavipes*)、レディクリテルメス・グラッセイ (*Reticulitermes grassei*)、レディクリテルメス・ルシフグス (*Reticulitermes lucifugus*)、レディクリテルメス・サントネンシス (*Reticulitermes santonensis*)、レディクリテルメス・ヴィルギニクス (*Reticulitermes virginicus*)、テルメス・ナタレンシス (*Termes natalensis*)、ゴキブリ (*cockroaches*) (ゴキブリ目 (*Blattaria*) - ゴキブリ亜目 (*Blattodea*))、例えば、アチェタ・ドメスティカス (*Acheta domesticus*)、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ブラテラ・アサヒナイ (*Blattella asahinae*)、ブラテラ・ゲルマニカ (*Blattella germanica*)、グリロタルバ属の種 (*Gryllotalpa* spp.)、マデイラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、ロクスタ属の種 (*Locusta* spp.)、メラノプルス属の種 (*Melanoplus* spp.)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、コワモンゴキブリ (*Periplaneta australasiae*)、トビイロゴキブリ (*Periplaneta brunnea*)、クロゴキブリ (*Periplanet*

10

20

30

40

50

a fuliginosa)、ヤマトゴキブリ(Periplaneta japonica)、

【0220】

カメムシ(bugs)、アブラムシ(aphids)、ヨコバイ(leafhoppers)、コナジラミ(whiteflies)、カイガラムシ(scale insects)、セミ(cicadas)(半翅類(Hemiptera))、例えば、アクロステルヌム属の種(Acrosternum spp.)、例えば、アクロステルヌム・ヒラレ(Acrosternum hilare)、アシルトシホン属の種(Acyrtosiphon spp.)、例えば、アシルトシホン・オノブリキス(Acyrtosiphon onobrychis)、エンドウヒゲナガアブラムシ(Acyrtosiphon pisum)、カラマツカサアブラムシ(Adelges laricis)、アエネオラミア属の種(Aeneolamia spp.)、アゴノセナ属の種(Agonoscena spp.)、アレウロデス属の種(Aleurodes spp.)、アレウロロブス・バロデンシス(Aleurolobus barodensis)、アレウロトリクス属の種(Aleurothrixus spp.)、アムラスカ属の種(Amrasca spp.)、アナサ・トリスチス(Anasa tristis)、アンテスティオプシス属の種(Antestiopsis spp.)、アヌラフィス・カルズイ(Anuraphis cardui)、アオニディエラ属の種(Aonidiella spp.)、アフアノスチグマ・ピリ(Aphanostigma piri)、アフイドウラ・ナスツルチイ(Aphidula nasturtii)、ワタアブラムシ属の種(Aphis spp.)、例えば、マメクロアブラムシ(Aphis fabae)、イチゴネアブラムシ(Aphis forbesi)、ワタアブラムシ(Aphis gossypii)、アフイス・グロスラリア(Aphis grossulariae)、アフイス・ボミ(Aphis pomi)、アフイス・サムブシ(Aphis sambuci)、アフイス・シュネイデリ(Aphis schneideri)、ユキヤナギアブラムシ(Aphis spiraeicola)、フタテンヒメヨコバイ(Arboridia apicalis)、ア rilル・クリスタツス(Arilus critatus)、アスピジエラ属の種(Aspidiella spp.)、アスピディオトゥス属の種(Aspidiotus spp.)、アタヌス属の種(Atanus spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ(Aulacorthum solani)、ベミシア属の種(Bemisia spp.)、例えば、シルバーリーフコナジラミ(Bemisia argentifolii)、タバココナジラミ(Bemisia tabaci)、ブリサス属の種(Blissus spp.)、例えば、ブリスス・ロイコプテルス(Blissus leucopterus)、ブラキカウズス・カルズイ(Brachycaudus cardui)、ムギワラギクオマルアブラムシ(Brachycaudus helichrysi)、ブラキカウズス・ペルシケ(Brachycaudus persicae)、ブラキカウズス・ブルニコラ(Brachycaudus prunicola)、ブラキコルス属の種(Brachycolus spp.)、ダイコンアブラムシ(Brevicoryne brassicae)、カリジボナ・マルギナタ(Calligypona marginata)、カロコリス属の種(Calocoris spp.)、キャンピロンマ・リビダ(Campylomma livida)、カピトフォルス・ホルニ(Capitophorus horni)、カルネオセファラ・フルギダ(Carneocephala fulgida)、カベレリウス属の種(Cavelerius spp.)、セロプラステス属の種(Ceraplastes spp.)、カンシャワタムシ(Ceratovacuna lanigera)、アワフキムシ科(Cercopidae)、セロシファ・ゴッシピイ(Cerosipha gossypii)、イチゴケナガアブラムシ(Chaetosiphon fragaefolii)、キオナスピス・テガレンシス(Chionaspis tegalensis)、クロリタ・オヌキイ(Chlorita onukii)、クロマフィス・ジュグランディコラ(Chromaphis juglandico

10

20

30

40

50

la)、クリソムファルス・フィクス(*Chrysomphalus ficus*)、シ
 カズリナ・ムビラ(*Cicadulina mbila*)、キメクス属の種(*Cimex*
spp.)、例えば、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、ト
 コジラミ(*Cimex lectularius*)、ココミティルス・ハリ(*Cocco*
mytilus halli)、コッカス属の種(*Coccus spp.*)、クレオン
 チアデス・ジルツス(*Creontiades dilutus*)、クリプトミザス・リ
 ビス(*Cryptomyzus ribis*)、クリプトミザス・リビス、シルトベルチ
 ス・ノタツス(*Cyrtopeltis notatus*)、ダルブルス属の種(*Dal*
bulus spp.)、ダシヌス・ピペリス(*Dasynus piperis*)、ジ
 アレウロデス属の種(*Dialeurades spp.*)、ジアホリナ属の種(*Dia*
phorina spp.)、ジアスピス属の種(*Diaspis spp.*)、ジケロ
 ブス・フルカツス(*Dichelops furcatus*)、ジコノコリス・ヘウエチ
 (*Diconocoris hewetti*)、ドラリス属の種(*Doralis sp*
p.)、ドレイフシア・ノルドマニアナ(*Dreyfusia nordmannian*
ae)、ドレイフシア・ピセア(*Dreyfusia piceae*)、ドロシカ属の種
 (*Drosicha spp.*)、ジサフィス属の種(*Dysaphis spp.*)、例
 えば、ジサフィス・ブランタギネア(*Dysaphis plantaginea*)、ジ
 サフィス・ピリ(*Dysaphis pyri*)、ジサフィス・ラジコラ(*Dysaph*
is radicola)、ジサウラコルトム・ブソイドソラニ(*Dysaulacor*
thum pseudosolani)、ジスデルクス属の種(*Dysdercus s*
pp.)、例えば、ジスデルクス・シングラツス(*Dysdercus cingula*
tus)、ジスデルクス・インテルメジウス(*Dysdercus intermedi*
us)、ジスミコックス属の種(*Dysmicoccus spp.*)、エンポアスカ属
 の種(*Empoasca spp.*)、例えば、エンポアスカ・ファバエ(*Empoas*
ca fabae)、エンポアスカ・ソラナ(*Empoasca solana*)、エリ
 オソマ属の種(*Eriosoma spp.*)、エリスロニューラ属の種(*Erythr*
oneura spp.)、ユリガステル属の種(*Eurygaster spp.*)、
 例えば、ユリガステル・インテグリセプス(*Eurygaster integrice*
ps)、ユーセリス・ビロパタス(*Euscelis bilobatus*)、エウスキ
 スツス属の種(*Euschistus spp.*)、例えば、エウスキスツス・ヘロス(
Euschistuos heros)、エウスキスツス・インピクチベントリス(*Eu*
schistus impictiventris)、エウスキスツス・セルプス(*Eu*
schistus servus)、ゲオコックス・コッフエアエ(*Geococcus*
coffaeae)、ハリオモルファ属の種(*Halyomorpha spp.*)、例
 えば、クサギカメムシ(*Halyomorpha halys*)、ヘリオベルチス属の種
 (*Heliopeletis spp.*)、ホマロジスカ・コアグラタ(*Homalodi*
sca coagulata)、ホルシアス・ノビレルス(*Horcias nobil*
ellus)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、チシャ
 ミドリアブラムシ(*Hyperomyzus lactucae*)、イセリヤ属の種(*I*
cerya spp.)、イジオセルス属の種(*Idiocerus spp.*)、イジ
 オスコプス属の種(*Idioscopus spp.*)、ラオデルファクス・ストリアテ
 ルス(*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属の種(*Leca*
nium spp.)、レピドサフェス属の種(*Lepidosaphes spp.*)
 、レプトコリス属の種(*Leptocorisa spp.*)、レプトグロスス・フィロ
 ブス(*Leptoglossus phyllopus*)、ニセダイコンアブラムシ(*L*
ipaphis erysimi)、リグス属の種(*Lygus spp.*)、例えば、
 リグス・ヘスペルス(*Lygus hesperus*)、リグス・リネオラリス(*Lyg*
us lineolaris)、リグス・プラテンシス(*Lygus pratensi*
s)、マクロペス・エクスカバツス(*Macropes excavatus*)、マクロ
 シフム属の種(*Macrosiphum spp.*)、例えば、マクロシフム・ロサエ(

Macrosiphum rosae)、マクロシフム・アベナエ (*Macrosiphum avenae*)、チューリップヒゲナガアブラムシ (*Macrosiphum euphorbiae*)、マハナルバ・フィムブリオラタ (*Mahanarva fimbriolata*)、タイワンマルカメムシ (*Megacopta cribraria*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ (*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス (*Melanaphis pyrrarius*)、メラナフィス・サッカリ (*Melanaphis sacchari*)、メトカルフィエラ属の種 (*Metcalfiella* spp.)、メトポロフィウム・ジルホヅム (*Metopolophium dirhodum*)、ミリダエ属の種 (*Miridae* spp.)、モネリア・コスタリス (*Monellia costalis*)、モネリオブシス・ペカニス (*Monelliopsis pecanidis*)、ミズス属の種 (*Myzus* spp.)、例えば、ミズス・アスカロニクス (*Myzus ascalonicus*)、ミズス・セラシ (*Myzus cerasi*)、ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*)、ミズス・バリアンス (*Myzus varians*)、ナソノビア・リビスニグリ (*Nasonovia ribis-nigri*)、ツマグロヨコバイ属の種 (*Nephotettix* spp.)、例えば、マラヤツマグロヨコバイ (*Nephotettix malayanus*)、クロスジツマグロヨコバイ (*Nephotettix nigropictus*)、ネフォテッティクス・パルヴス (*Nephotettix parvus*)、タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*)、ネザラ属の種 (*Nezara* spp.)、例えば、ミナミアオカメムシ (*Nezara viridula*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、オエバルス属の種 (*Oebalus* spp.)、オンコメトピア属の種 (*Oncometopia* spp.)、オルテジア・プラエロンガ (*Orthezia praelonga*)、パラベミシア・ミリカエ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ属の種 (*Paratrioza* spp.)、パルラトリア属の種 (*Parlatoria* spp.)、ペムフィグス属の種 (*Pemphigus* spp.)、例えば、ペムフィグス・ブルサリウス (*Pemphigus bursarius*)、カメムシ科 (*Pentomidae*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、クロフツノウンカ (*Perkinsiella saccharicida*)、フェナコックス属の種 (*Phenacoccus* spp.)、ドロノキワタアブラムシ (*Phloeomyzus passerinii*)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、ネアブラムシ属の種 (*Phylloxera* spp.)、ピエスマ・クアドラタ (*Piesma quadrata*)、ピエゾドルス属の種 (*Piezodorus* spp.)、例えば、ピエゾドルス・グイルディニ (*Piezodorus guildinii*)、ハランナガカイガラムシ (*Pinnaspis aspidistrae*)、ブラノコッカス属の種 (*Planococcus* spp.)、プロトブルビナリア・ピリホルミス (*Protopulvinaria pyriformis*)、プサルス・セリアツス (*Psallus seriatus*)、シューダシスタ・ペルセア (*Pseudacysta perseae*)、クワシロカイガラムシ (*Pseudaulacaspis pentagona*)、プソイドコッカス属の種 (*Pseudococcus* spp.)、例えば、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、キジラミ類の種 (*Psylla* spp.)、例えば、リンゴキジラミ (*Psylla mali*)、ブシラ・ピリ (*Psylla piri*)、プテロマルス属の種 (*Pteromalus* spp.)、ピリラ属の種 (*Pyrilla* spp.)、クアドラスピディオツス属の種 (*Quadraspidiotus* spp.)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、ラストロコッカス属の種 (*Rastrococcus* spp.)、レデュビウス・セニリス (*Reduvius senilis*)、ロドニウス属の種 (*Rhodnius* spp.)、ロパロミズス・アスカロニクス (*Rhopalomyzus ascalonicus*)、ロパロシファム属の種 (*Rhopalosiphum* spp.)、例えば、ニセダイコンアブ

ラムシ (*Rhopalosiphum pseudobrassicas*)、リングクビ
 レアブラムシ (*Rhopalosiphum insertum*)、トウモロコシアブラ
 ムシ (*Rhopalosiphum maidis*)、ムギクビレアブラムシ (*Rhop
 alosiphum padi*)、ソガトデス属の種 (*Sagatodes spp.*)
 、サールベルゲラ・シングュラリス (*Sahlbergella singularis*
)、サイセチア属の種 (*Saissetia spp.*)、サツパフィス・マラ (*Sap
 paphis mala*)、サツパフィス・マリ (*Sappaphis mali*)、ス
 カホイデス・チタヌ (*Scaphoides titanus*)、ムギミドリアブラム
 シ (*Schizaphis graminum*)、シゾネウラ・ラヌギノサ (*Schiz
 oneura lanuginosa*)、スコチノフォラ属の種 (*Scotinopho
 ra spp.*)、セレナスピズス・アルチクラツス (*Selenaspidus ar
 ticulatus*)、シトビオン・アベナエ (*Sitobion avenae*)、ソ
 ガタ属の種 (*Sogata spp.*)、セジロウンカ (*Sogatella furc
 ifera*)、ソルベア・インスラリス (*Solubea insularis*)、ナシ
 グンバイ (*Stephanitis nashi*)、スチクトセファラ・フェスチナ (*S
 tictocephala festina*)、テナラファラ・マラエンシス (*Tena
 laphara malayensis*)、チアンタ属の種 (*Thyanta spp.*
)、例えば、チアンタ・ペルジトル (*Thyanta perditor*)、チブラカ属
 の種 (*Tibraca spp.*)、チノカリス・カリアエホリアエ (*Tinocall
 is caryaefoliae*)、トマスビス属の種 (*Tomaspis spp.*)
 、トキシプテラ属の種 (*Toxoptera spp.*)、例えば、コミカンアブラムシ
 (*Toxoptera aurantii*)、トリアレウロデス (*Trialeurod
 es*) 属の種、例えば、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vapura
 riorum*)、トリアトマ属の種 (*Triatoma spp.*)、トリオザ属の種 (*Trioza spp.*)、チフロシバ属の種 (*Typhlocyba spp.*)、ウ
 ナスピス属の種 (*Unaspis spp.*)、例えば、ヤノネカイガラムシ (*Unas
 pis yanonensis*)、及びビテウス・ビチホリ (*Viteus vitif
 olii*)、
 【0221】
 アリ (*ants*)、ミツバチ (*bees*)、スズメバチ (*wasps*)、ハバチ (*saw
 flies*) (膜翅類 (*Hymenoptera*))、例えば、アタリア・ロサエ (*At
 halia rosae*)、アッタ・カピグアラ (*Atta capiguara*)、ア
 ッタ・ケファロテス (*Atta cephalotes*)、アッタ・ケファロテス、アッ
 タ・レビガータ (*Atta laevigata*)、アッタ・ロブスタ (*Atta ro
 busta*)、アッタ・セクデンス (*Atta sexdens*)、アッタ・テキサナ (*Atta texana*)、ボンブス属の種 (*Bombus spp.*)、カンボノトゥ
 ス・フロリダヌス (*Camponotus floridanus*)、クレマトガスター
 属の種 (*Crematogaster spp.*)、ダシムチラ・オッシデンタリス (*D
 asymutilla occidentalis*)、ジブリオン属の種 (*Diprio
 n spp.*)、ドリコベスブラ・マクラータ (*Dolichovespula mac
 ulata*)、ホプロカンパ属の種 (*Hoplocampa spp.*)、例えば、ホプ
 ロカンパ・ミヌタ (*Hoplocampa minuta*)、ホプロカンパ・テスツジネ
 ア (*Hoplocampa testudinea*)、ケアリ属の種 (*Lasius s
 pp.*)、例えば、トビイロケアリ (*Lasius niger*)、アルゼンチンアリ (*Linepithema humile*)、イエヒメアリ (*Monomorium ph
 araonis*)、パラベスブラ・ゲルマニカ (*Paravespula german
 ica*)、パラベスブラ・ペンシルバニカ (*Paravespula pennsylv
 anica*)、パラベスブラ・ブルガリス (*Paravespula vulgaris*
)、ツヤオオズアリ (*Pheidole megacephala*)、ボゴノミルメクス
 ・バルバツス (*Pogonomyrmex barbatulus*)、ボゴノミルメクス・カ

リフォルニクス (*Pogonomyrmex californicus*)、ポリステス・ルビギノサ (*Polistes rubiginosa*)、アカカミアリ (*Solenopsis geminata*)、ソレノプシス・インウィクタ (*Solenopsis invicta*)、ソレノプシス・リクテリ (*Solenopsis richteri*)、ソレノプシス・キシロニ (*Solenopsis xyloni*)、ベスパ属の種 (*Vespa* spp.)、例えば、モンズズメバチ (*Vespa crabro*)、及びヴェスブラ・スクアモサ (*Vespula squamosa*)、

【0222】

コオロギ (*crickets*)、バッタ (*grasshoppers*)、イナゴ (*locusts*) (バッタ目 (*Orthoptera*))、例えば、ヨーロッパイエコオロギ (*Acheta domestica*)、カリブタマス・イタリカス (*Calliptamus italicus*)、コルトイケテス・テルミニフェラ (*Chortoicetes terminifera*)、ドシオスタウラス・マロッカナス (*Dociostraurus maroccanus*)、グリロタルパ・アフリカーナ (*Gryllotalpa africana*)、グリロタルパ・グリロタルパ (*Gryllotalpa gryllotalpa*)、ヒエログリフス・ダガネンシス (*Hieroglyphus daganensis*)、クラウッサリア・アングリフェラ (*Kraussaria angulifera*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、ロクスタナ・パルダリナ (*Locustana pardalina*)、メラノブルス・ビビタタス (*Melanoplus bivittatus*)、メラノブルス・フェムルブラム (*Melanoplus femurrubrum*)、メラノブルス・メキシカヌス (*Melanoplus mexicanus*)、メラノブルス・サングイニペス (*Melanoplus sanguinipes*)、メラノブルス・スプレトゥス (*Melanoplus spretus*)、アカトビバッタ (*Nomadacris septemfasciata*)、オエダレウス・セネガレンシス (*Oedaleus senegalensis*)、シストセルカ・アメリカーナ (*Schistocerca americana*)、サバクトビバッタ (*Schistocerca gregaria*)、クラズミウマ (*Tachycines asynamorius*)、及びゾノゼラス・バリエガタス (*Zonozerus variegatus*)、

【0223】

蛛形類動物 (蛛形綱 (*Arachnida*))、例えば、ヒメダニ科 (*Argasidae*)、マダニ科 (*Ixodidae*) 及びヒゼンダニ科 (*Sarcoptidae*) の科の、例えば、ダニ類 (*Acarina*)、例えば、キララマダニ属の種 (*Amblyomma* spp.) (例えば、アムブリオマ・アメリカナム (*Amblyomma americanum*)、アムブリオマ・ファリエガツム (*Amblyomma variegatum*)、アムブリオマ・マクラツム (*Amblyomma maculatum*))、ヒメダニ属の種 (*Argas* spp.) (例えば、ナガヒメダニ (*Argas persicus*))、ウシマダニ属の種 (*Boophilus* spp.) (例えば、ブーフィラス・アニュラタス (*Boophilus annulatus*)、ブーフィラス・デコロラタス (*Boophilus decoloratus*)、オウシマダニ (*Boophilus microplus*))、デルマセントル・シルバルム (*Dermacentor silvarum*)、デルマセントル・アンデルソニ (*Dermacentor andersoni*)、デルマセントル・ヴァリアビリス (*Dermacentor variabilis*)、イボマダニ属の種 (*Hyalomma* spp.) (例えば、ヒアロムマ・トランカタム (*Hyalomma truncatum*))、イクソデス属の種 (*Ixodes* spp.) (例えば、イクソデス・リシヌス (*Ixodes ricinus*)、イクソデス・ルビキュンダス (*Ixodes rubicundus*)、イクソデス・スカプularis (*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロチクルス (*Ixodes holocyclus*)、イクソデス・パシフィカス (*Ixodes pacificus*))、オルニトドルス属の種 (*Ornithodoros*

spp.) (例えば、オルニトドルス・モウバタ (*Ornithodorus moubata*)、オルニトドルス・ヘルムシ (*Ornithodorus hermsi*)、オルニトドルス・ツリカタ (*Ornithodorus turicata*)、イエダニ (*Ornithonyssus bacoti*)、オトビウス・メグニニ (*Otobius megnini*)、ワクモ (*Dermanyssus gallinae*)、ブソロプテス属の種 (*Psoroptes* spp.) (例えば、ブソロプテス・オウイス (*Psoroptes ovis*)、コイタマダニ属の種 (*Rhipicephalus* spp.) (例えば、クリイロコイタマダニ (*Rhipicephalus sanguineus*)、リピセファラス・アペンディキュレイタス (*Rhipicephalus appendiculatus*)、リピセファラス・エベルトシ (*Rhipicephalus evertsi*)、リゾギルホス属の種 (*Rhizoglyphus* spp.)、サルコプテス属の種 (*Sarcoptes* spp.) (例えば、サルコプテス・スカビエイ (*Sarcoptes scabiei*)、及びフシダニ属の種 (*Eriophyidae* spp.)、例えば、アカリア・シェルドニ (*Acarisia sheldoni*)、アクロプス属の種 (*Aculops* spp.) (例えば、ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、アクルス属の種 (*Aculus* spp.) (例えば、アクルス・シュレクテンダリ (*Aculus schlechtendali*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)、フィロコプツルタ・オレイボラ (*Phyllocoptruta oleivora*) 及びエリオフィエス属の種 (*Eriophyes* spp.) (例えば、エリオフィエス・シェルドニ (*Eriophyes sheldoni*)、ホコリダニ属の種 (*Tarsonemidae* spp.)、例えば、ヘミタルソネムス属の種 (*Hemitarsonemus* spp.)、シクラメンホコリダニ (*Phytonemus pallidus*) 及びチャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*)、ステノタルソネムス属の種 (*Stenotarsonemus* spp.)、ヒメハダニ属の種 (*Tenuipalpidae* spp.)、例えば、ブレビバルプス属の種 (*Brevipalpus* spp.) (例えば、ブレビバルプス・ホエニシス (*Brevipalpus phoenicis*)、ハダニ属の種 (*Tetranychidae* spp.)、例えば、エオテトラニクス属の種 (*Eotetranychus* spp.)、エウテトラニクス属の種 (*Eutetranychus* spp.)、オリゴニクス属の種 (*Oligonychus* spp.)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)、テトラニクス・パキフィクス (*Tetranychus pacificus*)、テトラニクス・テラリウス (*Tetranychus telarius*) 及びナミハダニ (*Tetranychus urticae*)、クローバービラハダニ (*Bryobia praetiosa*)、パノニクス属の種 (*Panonychus* spp.) (例えば、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、メタテトラニクス属の種 (*Metatetranychus* spp.) 及びオリゴニクス属の種 (例えば、オリゴニクス・プラテンシス (*Oligonychus pratensis*)、ヴァサテス・リコベルシキ (*Vasates lycopersici*)、真正クモ目 (*Araneida*)、例えば、クロゴケグモ (*Latrodectus mactans*)、及びドクイトグモ (*Loxosceles reclusa*) 及びアシブトコナダニ (*Acarus siro*)、ショクヒヒゼンダニ属の種 (*Chorioptes* spp.)、スコルピオ・マウルス (*Scorpio maurus*)、

【0224】

ノミ (fleas) (ノミ目 (*Siphonaptera*))、例えば、ナガノミ属の種 (*Ceratophyllus* spp.)、ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、イヌノミ (*Ctenocephalides canis*)、ケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)、ヒトノミ (*Pulex ir*

ritans)、スナノミ(Tunga penetrans)、及びヨーロッパネズミノミ(Nosopsyllus fasciatus)、シミ(silverfish)、マダラシミ(firebrat)(総尾目(Thysanura))、例えば、セイヨウシミ(Lepisma saccharina)及びテルモビア・ドメスチカ(Thermobia domestica)、ムカデ(centipedes)(唇脚綱(Chilopoda))、例えば、ジムカデ属の種(Geophilus spp.)、スクティゲラ属の種(Scutigera spp.)、例えば、スクティゲラ・コレオプトラタ(Scutigera coleoptrata)、

【0225】

ヤスデ(millipedes)(倍脚綱(Diplopoda))、例えば、ブラニウルス・グツラツス(Blaniulus guttulatus)、ナルセウス属の種(Narceus spp.)、ハサミムシ(Earwigs)(革翅目(Dermaptera))、例えば、ヨーロッパギヌキハサミムシ(forficula auricularia)、シラミ(lice)(シラミ目(Phthiraptera))、例えば、ダマリニア属の種(Damalinia spp.)、シラミ属の種(Pediculus spp.)、例えば、アタマジラミ(Pediculus humanus capitis)、コロモジラミ(Pediculus humanus corporis)、ケジラミ(Pthirus pubis)、ブタジラミ属の種(Haematopinus spp.)、例えば、ウシジラミ(Haematopinus eurysternus)、ブタジラミ(Haematopinus suis)、ケモノホソジラミ属の種(Linognathus spp.)、例えば、ウシホソジラミ(Linognathus vituli)、ウシハジラミ(Bovicola bovis)、ニワトリハジラミ(Menopon gallinae)、ニワトリオオハジラミ(Menacanthus stramineus)及びケブカウシジラミ(Solenopotes capillatus)、ケモノハジラミ属の種(Trichodectes spp.)、トビムシ(springtails)(トビムシ目(Collembola))、例えば、オニキウルス(Onychiurus)亜種、例えば、オニキウルス・アルマツス(Onychiurus armatus)。

【0226】

これらはまた、線虫：植物寄生線虫、例えば、ネコブセンチュウ(root knot nematodes)、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)、及び他のキタネコブセンチュウ種(Meloidogyne species)、嚢腫を形成する線虫、ジャガイモシストセンチュウ(Globodera rostochiensis)及び他のグロボデラ(Globodera)属の種、ヘテロデラ・アベナエ(Heterodera avenae)、ヘテロデラ・グリシネス(Heterodera glycinis)、ヘテロデラ・シャクチイ(Heterodera schachtii)、ヘテロデラ・トリホリイ(Heterodera trifolii)、及び他のヘテロデラ属(Heterodera)の種、タネコブセンチュウ(Seed gall nematodes)、アングイナ(Anguina)属の種、茎及び葉線虫(Stem and foliar nematodes)、ハガレセンチュウ(Aphelenchoides)種、例えば、イネシンガレセンチュウ(Aphelenchoides besseyi)、刺毛線虫(Sting nematodes)、ペロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)及び他のペロノライムス(Belonolaimus)属の種、マツの線虫(Pine nematodes)、マツノザイセンチュウ(Bursaphelenchus lignicolus Mamiya et Kiyohara)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス(B

10

20

30

40

50

ursaphelenchus xylophilus) 及び他のブルサフェレンクス (Bursaphelenchus) 属の種、リング線虫 (Ring nematodes)、クリコネマ (Criconema) 属の種、クリコネメラ (Criconemella) 属の種、クリコネモイデス (Criconemoides) 属の種、メソクリコネマ (Mesocriconema) 属の種、ナミクキセンチュウ (Stem and bulb nematodes)、イモグサレセンチュウ (Ditylenchus destructor)、ジチレンクス・ジブサシ (Ditylenchus dipsaci) 及び他のジチレンクス (Ditylenchus) 属の種、オール線虫 (Awl nematodes)、ドリコドルス (Dolichodorus) 属の種、ラセン線虫 (Spiral nematodes)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス (Helioicotylenchus multicinctus) 及び他のエリコチレンクス (Helicotylenchus) 属の種、鞘及び鞘様線虫 (Sheath and sheathoid nematodes)、ヘミシクリオホラ (Hemicycliophora) 属の種及びヘミクリコネモイデス (Hemicriconemoides) 属の種、ヒルシュマンニエラ (Hirshmanniella) 属の種、ヤリ線虫 (Lance nematodes)、ホプロアイムス (Hoploaimus) 属の種、ニセネコブ線虫 (false rootknot nematodes)、ナコブス (Nacobbus) 属の種、ハリ線虫 (Needle nematodes)、ロンギドルス・エロンガトス (Longidorus elongatus) 及び他のロンギドルス (Longidorus) 属の種、ネグサレ線虫 (Lesion nematodes)、ブラチレンクス・ブラキウルス (Pratylenchus brachyurus)、ムギネグサレセンチュウ (Pratylenchus neglectus)、キタネグサレセンチュウ (Pratylenchus penetrans)、ブラチレンクス・クルビタツス (Pratylenchus curvittatus)、ブラチレンクス・ゴオデイ (Pratylenchus goodeyi) 及び他のブラチレンクス (Pratylenchus) 属の種、ネモグリ線虫 (Burrowing nematodes)、バナネモグリセンチュウ (Radopholus similis) 及び他のラドホルス (Radopholus) 属の種、ニセフクロ線虫 (Reniform nematodes)、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 (Rotylenchus) 属の種、スクテッロネマ (Scutellonema) 属の種、切り株線虫 (Stubby root nematodes)、バナネモグリセンチュウ (Trichodorus primitivus) 及び他のトリコドルス (Trichodorus) 属の種、パラトリコドルス (Paratrichodorus) 属の種、スタント線虫 (Stunt nematodes)、ティレンコリンクス・クライトニ (Tylenchorhynchus claytoni)、ティレンコリンクス・ズビウス (Tylenchorhynchus dubius) 及び他のティレンコリンクス (Tylenchorhynchus) 属の種、ミカンネ線虫 (Citrus nematodes)、チュレンクルス (Tylenchulus) 属の種、例えば、チュレンクルス・セミペネトランス (Tylenchulus semipenetrans)、オオハリセンチュウ (Dagger nematodes)、キシフィネマ (Xiphinema) 属の種、及び他の植物寄生線虫種を防除するのに適している。

【0227】

式 (I) の化合物によって防除し得るさらなる有害生物種の例には、双殻類 (Bivalva) のクラスから、例えば、カワホトトギスガイ属の種 (Dreissena spp.)、腹足綱 (Gastropoda) のクラスから、例えば、アリオン属の種 (Arion spp.)、ピオンファラリア属の種 (Biomphalaria spp.)、ブリヌス属の種 (Bulinus spp.)、デロセラ属の種 (Deroceras spp.)、ガルバ属の種 (Galba spp.)、リムナエア属の種 (Lymnaea spp.)

aea spp.)、オンコメラニア属の種 (*Oncomelania* spp.)、スクシネア属の種 (*Succinea* spp.)、蠕虫 (*helminths*) のクラスから、例えば、アンシロストーマ・デュオデナール (*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストーマ・ケイラニクム (*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストーマ・ブラジリエンス (*Ancylostoma braziliensis*)、アンシロストーマ属の種 (*Ancylostoma* spp.)、アスカリス・ルブリコイデス (*Ascaris lubricoides*)、アスカリス属の種 (*Ascaris* spp.)、ブルギア・マライ (*Brugia malayi*)、ブルギア・チモリ (*Brugia timori*)、ブノストムム属の種 (*Bunostomum* spp.)、カベルチア属の種 (*Chabertia* spp.)、クロノルキス属の種 (*Clonorchis* spp.)、クーペリア属の種 (*Cooperia* spp.)、ディクロコエリウム属の種 (*Dicrocoelium* spp.)、ディクチオカウルス・フィラリア (*Dictyocaulus filaria*)、広節裂頭条虫 (*Diphyllobothrium latum*)、メジナ虫 (*Dracunculus medinensis*)、単包条虫 (*Echinococcus granulosus*)、多包条虫 (*Echinococcus multilocularis*)、蟯虫 (*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属の種 (*Faciola* spp.)、ヘモンクス属の種 (*Haemonchus* spp.)、例えば、ヘモンクス・コントルタス (*Haemonchus contortus*)、ヘテラキス属の種 (*Heterakis* spp.)、小型条虫 (*Hymenolepis nana*)、ヒオストロングルス属の種 (*Hyostrongylus* spp.)、ロア糸状虫 (*Loa Loa*)、ネマトジルス属の種 (*Nematodirus* spp.)、エソファゴストム属の種 (*Oesophagostomum* spp.)、オピストルキス属の種 (*Opisthorchis* spp.)、回旋糸状虫 (*Onchoerca volvulus*)、オステルターグ属の種 (*Ostertagia* spp.)、パラゴニムス属の種 (*Paragonimus* spp.)、スキストソメン属の種 (*Schistosomen* spp.)、ストロングロイデス・フエレボルニ (*Strongyloides fuelleborni*)、ストロングロイデス・ステルコラリス (*Strongyloides stercoralis*)、ストロングロイデス属の種 (*Strongyloides* spp.)、無鉤条虫 (*Taenia saginata*)、有鉤条虫 (*Taenia solium*)、旋毛虫 (*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナチバ (*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ (*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ (*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・シュードブシラリス (*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属の種 (*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス・トリクリア (*Trichuris trichuria*)、パンクロフト糸状虫 (*Wuchereria bancrofti*)、等脚目 (*Isopoda*) の目から、例えば、オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgare*)、オニスカス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ワラジムシ (*Porcellio scaber*)、コムカデ目 (*Symphyla*) の目から、例えば、スクチゲレラ・イマクラタ (*Scutigere*) が含まれる。

【 0 2 2 8 】

式 (I) の化合物によって防除し得る有害生物種のさらなる例には、アニソプリア・アウストリアカ (*Anisoplia austriaca*)、アバメア属の種 (*Apamea* spp.)、アウストロアスカ・ヴィリジグリセア (*Austroasca viridigrisea*)、バリオトリプス・ピフォルミス、カエノラブディティス・エレガン (*Caenorhabditis elegans*)、セフス属の種 (*Cephus* spp.)、セウトロリンクス・ナピ (*Ceutorhynchus napi*)、カエトクネマ・アリヅラ (*Chaetocnema aridula*)、キロ・アウリキ

リウス (*Chilo auricilius*)、キロ・インジクス (*Chilo indicus*)、キロ・ポリクリス (*Chilo polychrysus*)、オーストラ
 リアトビバッタ (*Chortiocetes terminifera*)、コブノメイガ
 (*Cnaphalocroci medinalis*)、クナファロクロシス属の種 (*C
 naphalocrosis spp.*)、オオアメリカモンキチョウ (*Colias
 eurytheme*)、コロブス属の種 (*Collops spp.*)、コルニテルメス
 ・クムランス (*Cornitermes cumulans*)、クレオンチアデス属の種
 (*Creontiades spp.*)、シクロセファラ属の種 (*Cyclocephala
 spp.*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ノハラ
 ナメクジ (*Deraceras reticulatum*)、ジアトレア・サッカリス 10
 (*Diatrea saccharalis*)、ジケロブス・フルカツス (*Dichel
 ops furcatus*)、ディクラディスパ・アルミゲラ (*Dicladispa
 armigera*)、ジロボデルス属の種 (*Diloboderus spp.*)、例え
 ば、アブデルスツノカブト (*Diloboderus abderus*)、エデッサ属の
 種 (*Edessa spp.*)、エピノチア属の種 (*Epinotia spp.*)、ア
 リ科 (*Formicidae*)、ゲオコリス属の種 (*Geocoris spp.*)、グ
 ロビテルメス・スルフレウス (*Globitermes sulfureus*)、ケラ科
 (*Gryllotalpidae*)、ハロチデウス・デストルクトル (*Halotyde
 us destructor*)、ヒブノデス・ビコロール (*Hipnodes bicol
 or*)、トウヨウイネクキミギワバエ (*Hydrellia philippina*)、 20
 ジュルス属の種 (*Julus spp.*)、ラオデルファクス属の種 (*Laodelph
 ax spp.*)、レプトコルシア・アクタ (*Leptocorsia acuta*)、
 レプトコルシア・オラトリウス (*Leptocorsia oratorius*)、リオ
 ゲニス・フスクス (*Liogenys fuscus*)、ルシリア属の種 (*Lucill
 ia spp.*)、リオゲニス・フスクス (*Lyogenys fuscus*)、マハナ
 ルヴァ属の種 (*Mahanarva spp.*)、マラデラ・マトリダ (*Malader
 a matrida*)、マラスミア属の種 (*Marasmia spp.*)、マストテル
 メス属の種 (*Mastotermes spp.*)、コナカイガラムシ (*Mealybu
 gs*)、メガセリス (*Megascelis*) 亜種、メタマシウス・ヘミプテルス (*Me
 tamasius hemipterus*)、ミクロテカ属の種 (*Microtheca 30
 spp.*)、モシス・ラチペス (*Mocis latipes*)、ムルガンチア属の種
 (*Murgantia spp.*)、アワヨトウ (*Mythemina separata*)、
 ネオカプリテルメス・オパクス (*Neocapritermes opacus*)
 、ネオカプリテルメス・パルプス (*Neocapritermes parvus*)、ネ
 オメガロトマス属の種 (*Neomegalotomus spp.*)、ネオテルメス属の
 種 (*Neotermes spp.*)、ニンフラ・デブクタリス (*Nymphula
 depunctalis*)、オエバルス・ブグナキス (*Oebalus pugnax*)
 、オルセオリア属の種 (*Orseolia spp.*)、例えば、オルセオリア・オリゼ
 (*Orseolia oryzae*)、オキシカラエヌス・ヒアリニペンニス (*Oxyc
 araenus hyalinipennis*)、ブルシア属の種 (*Plusia sp 40
 p.*)、スクミリングガイ (*Pomacea canaliculata*)、プロコルニ
 テルメス (*Procornitermes*) 亜種、プロコルニテルメス・トリアシフェル
 (*Procornitermes triacifer*)、プシロイデス属の種 (*Psy
 lloides spp.*)、ラチブルシア属の種 (*Rachiplusia spp.
 .*)、ラドフォルス属の種 (*Rhodopholus spp.*)、スカプトコリス・カス
 タネア (*Scaptocoris castanea*)、スカプトコリス属の種 (*Sca
 ptocoris spp.*)、スキルポファガ属の種 (*Scirpophaga sp
 p.*)、例えば、サンカメイチュウ ((サンカメイガ) *Scirpophaga in
 certulas*)、スキルポファガ・イノタタ (*Scirpophaga innot
 ata*)、スコチノファラ属の種 (*Scotinophara spp.*)、例えば、ス 50

コティノファラ・コアルクタタ (*Scotinophara coarctata*)、セサミア属の種 (*Sesamia* spp.)、例えば、イネヨトウ (*Sesamia inferens*)、セジロウンカ (*Sogaella fructifera*)、アカカミアリ (*Solenapsis geminata*)、スピシスチルス属の種 (*Spissistilus* spp.)、ストークボーラー (*Stalk borer*)、イネアザミウマ (*Stenchaetothrips biformis*)、ステネオタルソネムス・スピンキ (*Steneotarsonemus spiniki*)、シレプタ・デロガタ (*Sylepta derogata*)、テレヒン・リクス (*Telehin licus*)、トリコストロンギルス属の種 (*Trichostrongylus* spp.) が含まれる。

10

【0229】

本発明の化合物は、その塩、立体異性体及び互変異性体を含めて、昆虫、好ましくは鱗翅目、鞘翅目 (*Coleoptera*) 及び半翅目 (*Hemiptera*) の属、特に鱗翅目、鞘翅目及び半翅類の昆虫からの昆虫などの吸汁性又は刺性昆虫、及び咀嚼昆虫、及び刺咬昆虫を防除するのに特に有用である。

本発明の化合物は、その塩、立体異性体及び互変異性体を含めて、総翅目 (*Thysanoptera*)、双翅目 (*Diptera*) (とりわけハエ、カ)、膜翅目 (*Hymenoptera*) (とりわけ、アリ)、及び等翅目 (*Isoptera*) (とりわけシロアリ) の昆虫を防除するのにさらに有用である。

20

【0230】

本発明の化合物は、その塩、立体異性体及び互変異性体を含めて、鱗翅目及び鞘翅目の昆虫を防除するのに特に有用である。

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

農薬組成物は、殺有害生物有効量の化合物Iを含む。用語「有効量」とは、栽培植物に対する有害な菌を防除するため、又は材料の保護において十分であり、及び処理された植物に実質的な損害をもたらし、組成物又は化合物Iの量を意味する。こうした量は、広い範囲内で変えることができ、防除すべき種、処理される栽培植物又は資材、気候条件及び使用される特定の化合物Iなどの様々な要因に依存する。

30

【0231】

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

40

【0232】

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

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

50

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

【0233】

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

適切な界面活性剤は、陰イオン性、陽イオン性、非イオン性及び両性界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、及びそれらの混合物などの表面活性化合物である。こうした界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド、又はアジュバントとして使用することができる。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.)に列挙されている。

【0234】

適切な陰イオン性界面活性剤は、スルホン酸、硫酸、リン酸、カルボン酸のアルカリ塩、アルカリ土類塩又はアンモニウム塩、及びそれらの混合物である。スルホン酸塩の例は、アルキルアリールスルホン酸塩、ジフェニルスルホン酸塩、アルファ-オレフィンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、脂肪酸及び脂肪油のスルホン酸塩、エトキシ化アルキルフェノールのスルホン酸塩、アルコキシ化アリールフェノールのスルホン酸塩、縮合ナフタレンのスルホン酸塩、ドデシル及びトリデシルベンゼンのスルホン酸塩、ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホン酸塩、スルホコハク酸塩、又はスルホスクシナメートである。硫酸塩の例は、脂肪酸及び脂肪油、エトキシ化アルキルフェノール、アルコール、エトキシ化アルコール、又は脂肪酸エステルの硫酸塩である。リン酸塩の例は、リン酸エステルである。カルボン酸塩の例は、アルキルカルボン酸塩及びカルボキシル化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレートである。

【0235】

適切な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖をベースとする界面活性剤、ポリマー界面活性剤、及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1～50当量でアルコキシ化されている、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸又は脂肪酸エステルなどの化合物である。エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシド、好ましくはエチレンオキシドが、アルコキシ化に使用され得る。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は、脂肪酸エステル、グリセリンエステル又はモノグリセリドである。糖をベースとする界面活性剤の例は、ソルビタン、エトキシ化ソルビタン、スクロースエステル及びグルコースエステル、又はアルキルポリグルコシドである。ポリマー界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール、若しくは酢酸ビニルのホモポリマー又はコポリマーである。

【0236】

適切な陽イオン性界面活性剤は、第四級界面活性剤、例えば、1つ若しくは2つの疎水性基を有する第四級アンモニウム化合物、又は長鎖第一級アミンの塩である。適切な両性界面活性剤は、アルキルベタイン及びイミダゾリンである。適切なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B若しくはA-

10

20

30

40

50

B - A タイプのブロックポリマー、又はアルカノール、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドを含む A - B - C タイプのブロックポリマーである。適切な高分子電解質は、ポリ酸又はポリ塩基である。ポリ酸の例は、ポリアクリル酸又はポリ酸の櫛形ポリマーのアルカリ塩である。ポリ塩基の例は、ポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

適切なアジュバントは、それ自体無視できる程の殺有害生物活性しか有していないか又は殺有害生物活性さえ有しておらず、標的に対する化合物 I の生物的性能を改善する化合物である。例は、界面活性剤、鉱物油又は植物油、及び他の補助剤である。さらなる例は、Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5により列挙されている。

10

【0237】

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

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

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

適切な抗発泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール、及び脂肪酸の塩である。

20

【0238】

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

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

【0239】

組成物のタイプ及びそれらの調製に関する例は以下の通りである。

i) 水溶剤（SL、LS）

30

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

ii) 分散剤（DC）

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

iii) 乳剤（EC）

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

40

【0240】

iv) エマルジョン剤（EW、EO、ES）

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

v) 懸濁剤（SC、OD、FS）

50

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

v i) 顆粒水和剤及び顆粒水溶剤 (W G 、 S G)

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

10

【 0 2 4 1 】

v i i) 粉末水和剤及び粉末水溶剤 (W P 、 S P 、 W S)

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

【 0 2 4 2 】

v i i i) ゲル製剤 (G W 、 G F)

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

20

i v) マイクロエマルション製剤 (M E)

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

30

【 0 2 4 3 】

i v) マイクロカプセル剤 (C S)

5～50質量%の本発明による化合物I、0～40質量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）、2～15質量%のアクリルモノマー（例えば、メタクリル酸メチル、メタクリル酸、及びジ又はトリアクリレート）を含む油相を保護コロイド（例えば、ポリビニルアルコール）の水溶液に分散させる。ラジカル開始剤により開始されるラジカル重合により、ポリ（メタ）アクリレートのマイクロカプセルが形成する。或いは、5～50質量%の本発明による化合物I、0～40質量%の水不溶性有機溶媒（例えば、芳香族炭化水素）、及びイソシアネートモノマー（例えば、ジフェニルメテン - 4 , 4 ' - ジイソシアナタエ (d i p h e n y l m e t h e n e - 4 , 4 ' - d i i s o c y a n a t a e) ）を含む油相を保護コロイド（例えば、ポリビニルアルコール）の水溶液に分散させる。ポリアミン（例えば、ヘキサメチレンジアミン）の添加により、ポリ尿素のマイクロカプセルが形成する。モノマーは、合計1～10質量%になる。質量%は、CS組成物の総量に關する。

40

【 0 2 4 4 】

i x) 粉剤 (D P 、 D S)

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

x) 粒剤 (G R 、 F G)

0.5～30質量%の本発明による化合物Iを微粉碎し、100質量%になる固体担体

50

(例えば、シリケート)と一緒にする。顆粒は、押出し、スプレードライ、又は流動床により得られる。

x i) 超微量溶液剤 (UL)

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

【0245】

組成物タイプ i) ~ x i) は、0.1 ~ 1 質量%の殺菌剤、5 ~ 15 質量%の抗凍結剤、0.1 ~ 1 質量%の抗発泡剤、及び 0.1 ~ 1 質量%の着色剤などのさらなる補助剤を含んでいてもよい。

農薬組成物は、一般に、0.01 ~ 95 質量%の間、好ましくは 0.1 ~ 90 質量%の間、特に 0.5 ~ 75 質量%の間の活性物質を含む。これらの活性物質は、90% ~ 100%、好ましくは 95% ~ 100% (NMR スペクトルによる) の純度で使用する。

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

【0246】

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

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

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

【0247】

様々なタイプの油、湿潤剤、アジュバント、肥料、又は微量栄養素、及びさらなる殺有害生物剤 (例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、生長調節剤、毒性緩和剤) を、活性物質若しくはプレミックスとしてそれらを含む組成物に添加してもよく、又は適宜、使用直前まで加えなくてもよい (タンクミックス)。これらの作用剤は、本発明による組成物と、1 : 100 ~ 100 : 1、好ましくは 1 : 10 ~ 10 : 1 の質量比で混合することができる。

使用者は、本発明による組成物を、通常、事前に投与量を設定できる (predose) デバイス、背負い式噴霧器、噴霧タンク、噴霧飛行機、又は灌漑システムから施用する。通常、農薬組成物は、所望の施用濃度にするための水、緩衝剤、及び / 又はさらなる補助剤により構成され、こうして本発明による即時使用可能な噴霧用液又は農薬組成物が得られる。通常、農業的に有用な区域 1 ヘクタールあたり、即時使用可能な噴霧用液 20 ~ 2000 リットル、好ましくは 50 ~ 400 リットルが施用される。

【 0 2 4 8 】

一実施形態によれば、キットのパーツ又は二成分若しくは三成分混合物のパーツなどの本発明による組成物の個々の成分を、噴霧タンク中で使用者自身により混合してもよく、さらなる補助剤を適宜加えてもよい。

さらなる実施形態では、本発明による組成物の個々の成分又は一部事前混合済み成分（例えば、化合物 I 及び / 又はグループ M）若しくは F）（以下を参照されたい）からの活性物質を含む成分）のどちらか一方を、噴霧タンク中で使用者により混合してもよく、さらなる補助剤及び添加剤を適宜加えてもよい。

【 0 2 4 9 】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の個々の成分又は一部事前混合済み成分（例えば、化合物 I 及び / 又はグループ M . 1 から M . U N . X、若しくは F . I から F . X I I からの活性物質を含む成分）のどちらか一方を、一緒に（例えば、タンク混合した後）又は連続して施用することができる。

本発明による化合物と一緒に使用可能で、且つ相乗効果を生じる可能性があり、殺虫剤抵抗性対策委員会（Insecticide Resistance Action Committee）（IRAC）の作用機序分類によって分類されている以下の殺有害生物剤のリスト M は、可能な組合せを例示することを意図したものであり、何らかの限定を設けるものではない。

【 0 2 5 0 】

M . 1 アセチルコリンエステラーゼ（AChE）阻害剤であって、以下の分類からのもの

M . 1 A カルバメート系、例えばアルジカルブ、アラニカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、プトカルボキシム、プトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、エチオフエンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタネート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトミル、メトルカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロボクスル、チオジカルブ、チオフアノクス、トリメタカルブ、X M C、キシリルカルブ、及びトリアザメート；

又は、以下の分類からのもの

【 0 2 5 1 】

M . 1 B 有機リン系、例えばアセフェート、アザメチホス、アジンホス - エチル、アジンホスメチル、カデュサホス、クロルエトキシホス、クロルフエンピンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス - メチル、クマホス、シアノホス、デメトン - S - メチル、ジアジノン、ジクロルボス / D D V P、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルピンホス、ジスルホトン、E P N、エチオン、エトプロホス、ファミフル、フェナミホス、フェントロチオン、フェンチオン、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イミシアホス、イソフェンホス、イソプロピル O - （メトキシアミノチオ - ホスホリル）サリチレート、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メタミドホス、メチダチオン、メピンホス、モノクロトホス、ナレド、オメトエート、オキシデメトン - メチル、パラチオン、パラチオン - メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス - メチル、プロフェノホス、プロベタムホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリダフェンチオン、クイナルホス、スルホテップ、テブピリムホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルピンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン及びバミドチオン；

【 0 2 5 2 】

M . 2 . 以下のものなどの G A B A 作動性塩素イオンチャネルアンタゴニスト；

M . 2 A 例えばエンドスルファン又はクロルダンとしてのシクロジエン有機塩素化合物；

又は

M . 2 B 例えばエチプロール、フィプロニル、フルフィプロール、ピラフルプロール及びピリプロールとしてのフィプロール系（フェニルピラゾール系）；

10

20

30

40

50

M . 3 以下の分類からのナトリウムチャンネルモジュレーター

M . 3 A ピレスロイド系、例えばアクリナトリン、アレトリン、d - シス - トランスアレトリン、d - トランスアレトリン、ピフェントリン、ピオアレトリン、ピオアレトリン

S - シクロペンテニル、パイオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、ベータ - シフルトリン、シハロトリン、ラムダ - シハロトリン、ガンマ - シハロトリン、シペルメトリン、アルファ - シペルメトリン、ベータ - シペルメトリン、シータ - シペルメトリン、ゼータ - シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロクス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、タウ - フルバリネート、ハルフェンプロクス、イミプロトリン、メペルフルトリン、メトフルトリン、モンフルオロトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン (ピレトルム)、レスメトリン、シラフルオフエン、テフルトリン、テトラメチルフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、及びトランスフルトリン；又は

M . 3 B DDT又はメトキシクロルなどのナトリウムチャンネルモジュレーター；

M . 4 以下の分類からのニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト (n A C h R)

M . 4 A ネオニコチノイド系、例えばアクテアミプリド (a c t e a m i p r i d)、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロブリド、ニテンピラム、チアクロブリド、及びチアメトキサム；又は化合物

M . 4 A . 1 : 1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジニル) メチル] - 2 , 3 , 5 , 6 , 7 , 8 - ヘキサヒドロ - 9 - ニトロ - (5 S , 8 R) - 5 , 8 - エボキシ - 1 H - イミダゾ [1 , 2 - a] アゼピン；又は

M . 4 A . 2 : 1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ニトロ - 1 - [(E) - ペンチリデンアミノ] グアニジン；又は

M 4 . A . 3 : 1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 7 - メチル - 8 - ニトロ - 5 - プロボキシ - 3 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 2 H - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン；

又は M . 4 B ニコチン。

【 0 2 5 3 】

M . 5 スピノシン系、例えばスピノサド又はスピネトラムの分類からのニコチン性アセチルコリン受容体アロステリック活性化剤；

M . 6 アベルメクチン系及びミルベマイシン系、例えばアバメクチン、エマメクチン安息香酸、イベルメクチン、レピメクチン又はミルベメクチンの分類からの塩素イオンチャンネル活性化剤；

M . 7 以下などの幼若ホルモン類似物

M 7 A ヒドロプレン、キノプレン及びメトプレンとしての幼若ホルモン類似体；又は、

M . 7 B フェノキシカルブ、又は M . 7 C ピリプロキシフェンとしての他のもの；

【 0 2 5 4 】

M . 8 様々な非特異性 (マルチサイト) の阻害剤、例えば

M 8 A 臭化メチル及び他のハロゲン化アルキルとしてのハロゲン化アルキル、又は

M . 8 B クロロピクリン、又は M . 8 C フッ化スルフリル、又は M . 8 D ホウ砂、又は M . 8 E 吐酒石；

M . 9 同翅目選択的摂食遮断剤、例えば

M . 9 B ピメトロジン、又は M . 9 C フロニカミド；

M . 1 0 ダニ成長阻害剤、例えば

M . 1 0 A クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、及びジフロピダジン、又は M . 1 0 B エトキサゾール；

【 0 2 5 5 】

M . 1 1 昆虫の中腸膜の微生物攪乱剤、例えばバチルス・チューリングエンシス (b a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s) 又はバチルス・スファエリクス (b a c i l l u s s p h a e r i c u s)、及びそれらの菌が産生する殺虫性 (i n s e c t

10

20

30

40

50

i c d a l) タンパク質 (バチルス・チューリングエンシス亜種イスラエレンシス (b a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p . i s r a e l e n s i s) 、バチルス・スファエリクス (b a c i l l u s s p h a e r i c u s) 、バチルス・チューリングエンシス亜種アイザワイ (b a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p . a i z a w a i) 、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスタキ (b a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p . k u r s t a k i) 、及びバチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス (b a c i l l u s t h u r i n g i e n s i s s u b s p . t e n e b r i o n i s) など) 、又は B t 作物タンパク質 : C r y 1 A b 、 C r y 1 A c 、 C r y 1 F a 、 C r y 2 A b 、 m C r y 3 A 、 C r y 3 A b 、 C r y 3 B b 、及び C r y 3 4 / 3 5 A b 1 ;

10

M . 1 2 ミトコンドリアの A T P シンターゼの阻害剤、例えば、

M . 1 2 A ジアフエンチウロン、又は

M . 1 2 B 有機スズ殺ダニ剤、例えば、アゾシクロチン、シヘキサチン若しくは酸化フェンブタズ、又は M . 1 2 C プロバルギット、又は M . 1 2 D テトラジホン ;

M . 1 3 プロトン勾配の攪乱による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えばクロルフェナピル、D N O C 、又はスルフラミド ;

【 0 2 5 6 】

M . 1 4 ニコチン性アセチルコリン受容体 (n A C h R) チャネル遮断剤、例えばベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、チオシクラム、又はチオスルタップナトリウムとしてのゴカイ毒素類似体 ;

20

M . 1 5 例えば、ピストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフエヌロン、ノバルロン、ノピフルムロン、テフルベンズロン、又はトリフルムロンとしてのベンゾイル尿素などのキチン生合成タイプ 0 の阻害剤 ;

M . 1 6 例えば、ブプロフェジンとしてのキチン生合成タイプ 1 の阻害剤 ;

M . 1 7 例えば、シロマジンとしての脱皮攪乱物質、双翅類 (D i p t e r a n) ;

M . 1 8 ジアシルヒドラジン系、例えばメトキシフェノジド、テブフェノジド、ハロフェノジド、フフェノジド、又はクロマフェノジドなどのエクジソン受容体アゴニスト ;

M . 1 9 例えば、アミトラズとしてのオクトパミン受容体アゴニスト ;

M . 2 0 ミトコンドリア複合体 I I I 電子伝達阻害剤、例えば、

30

M . 2 0 A ヒドラメチルノン、又は M . 2 0 B アセキノシル、又は M . 2 0 C フルアクリピリム ;

【 0 2 5 7 】

M . 2 1 ミトコンドリア複合体 I 電子伝達阻害剤、例えば、

M . 2 1 A フェナザクイン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダベン、テブフェンピラド、若しくはトルフェンピラドなどの M E T I 殺ダニ剤及び殺虫剤、又は M . 2 1 B ロテノン ;

M . 2 2 電位依存ナトリウムチャネル遮断剤、例えば

M . 2 2 A インドキサカルブ、又は M . 2 2 B メタフルミゾン又は M . 2 2 C 1 - [(E) - [2 - (4 - シアノフェニル) - 1 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] エチリデン] アミノ] - 3 - [4 - (ジフルオロメトキシ) フェニル] 尿素 ;

40

M . 2 3 アセチル C o A カルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロン酸及びテトラミン酸誘導体、例えば、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、又はスピロテトラマト ;

M . 2 4 ミトコンドリア複合体 I V 電子伝達阻害剤、例えば

M . 2 4 A リン化アルミニウム、リン化カルシウム、ホスフィンなどのホスフィン、若しくはリン化亜鉛、又は M . 2 4 B シアニド。

【 0 2 5 8 】

M . 2 5 ベータ - ケトニトリル誘導体、例えばシエノピラフェン又はシフルメトフェンなどのミトコンドリア複合体 I I 電子伝達阻害剤 ;

50

M. 28 例えば、フルベンジアミド、クロラントラニリプロール (r y n a x y p y r (登録商標))、シアントラニリプロール (c y a z y p y r (登録商標)) としてのジアミド系、又は、フタルアミド化合物

の分類からのリアノジン受容体モジュレーター、

M. 28. 1 : (R) - 3 - クロロ (C h l o r) - N 1 - { 2 - メチル - 4 - [1 , 2 , 2 , 2 - テトラフルオロ (t e t r a f l u o r) - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル } - N 2 - (1 - メチル - 2 - メチルスルホニルエチル) フタルアミド (p h t h a l a m i d) 、及び

M. 28. 2 : (S) - 3 - クロロ - N 1 - { 2 - メチル - 4 - [1 , 2 , 2 , 2 - テトラフルオロ - 1 - (トリフルオロメチル) エチル] フェニル } - N 2 - (1 - メチル - 2 - メチルスルホニルエチル) フタルアミド、又は以下の化合物

M. 28. 3 : 3 - ブロモ - N - { 2 - ブロモ - 4 - クロロ - 6 - [(1 - シクロプロピルエチル) カルバモイル] フェニル } - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - カルボキサミド (提案される I S O 名 : シクラニリプロール) 、又は以下の化合物

【 0 2 5 9 】

M. 28. 4 : メチル - 2 - [3 , 5 - ジブロモ - 2 - ({ [3 - ブロモ - 1 - (3 - クロロピリジン - 2 - イル) - 1 H - ピラゾール - 5 - イル] カルボニル } アミノ) ベンゾイル] - 1 , 2 - ジメチルヒドラジンカルボキシレート ; 又は M. 28. 5 a) ~ M. 28. 5 l) から選択される化合物 ;

M. 28. 5 a) N - [4 , 6 - ジクロロ - 2 - [(ジエチル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 b) N - [4 - クロロ - 2 - [(ジエチル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - 6 - メチル - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 c) N - [4 - クロロ - 2 - [(ジ - 2 - プロピル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - 6 - メチル - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 d) N - [4 , 6 - ジクロロ - 2 - [(ジ - 2 - プロピル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 e) N - [4 , 6 - ジクロロ - 2 - [(ジエチル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (ジフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

【 0 2 6 0 】

M. 28. 5 f) N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - [(ジ - 2 - プロピル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 g) N - [4 - クロロ - 2 - [(ジ - 2 - プロピル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - 6 - シアノ - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 h) N - [4 , 6 - ジブロモ - 2 - [(ジエチル - 4 - スルファニリデン) カルバモイル] - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (トリフルオロメチル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 i) N - [2 - (5 - アミノ - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 4 - クロロ - 6 - メチル - フェニル] - 5 - ブロモ - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;

M. 28. 5 j) 5 - クロロ - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - N - [2 , 4 - ジクロロ - 6 - [(1 - シアノ - 1 - メチル - エチル) カルバモイル] フェニル] ピラゾール

10

20

30

40

50

- 3 - カルボキサミド ;

【 0 2 6 1 】

M . 2 8 . 5 k) 5 - ブロモ - N - [2 , 4 - ジクロロ - 6 - (メチルカルバモイル) フェニル] - 2 - (3 , 5 - ジクロロ - 2 - ピリジル) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ;
 M . 2 8 . 5 l) N - [2 - (t e r t - ブチルカルバモイル) - 4 - クロロ - 6 - メチル - フェニル] - 2 - (3 - クロロ - 2 - ピリジル) - 5 - (フルオロメトキシ) ピラゾール - 3 - カルボキサミド ; 又は M . 2 8 . 6 N 2 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エチル) - N 1 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - 3 - ヨード - フタルアミド ; 又は
 M . 2 8 . 7 3 - クロロ - N 2 - (1 - シアノ - 1 - メチル - エチル) - N 1 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) フタルアミドから選択される化合物。

10

【 0 2 6 2 】

M . U N . X . 例 えばアザジラクチン、アミドフルメット、ベンゾキシメート、ピフェナゼート、プロモプロピレート、キノメチオナート、氷晶石、ジコホル、フルフェネリム、フロメトキン、フルエンシルホン、フルピラジフロン、ピペロニルブトキシド、ピリダリル、ピリフルキナゾン、スルホキサフロル、ピフルブミドとしての作用機構が未知又は不確かな殺虫活性化合物、又は以下の化合物

M . U N . X . 1 : 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 5 - トリフルオロメチル - 4 , 5 - ジヒドロ - イソオキサゾール - 3 - イル] - 2 - メチル - N - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エチルカルバモイル) - メチル] - ベンズアミド、又は以下の化合物
 M . U N . X . 2 : シクロプロパン酢酸、 1 , 1 ' - [(3 S , 4 R , 4 a R , 6 S , 6 a S , 1 2 R , 1 2 a S , 1 2 b S) - 4 - [[(2 - シクロプロピルアセチル) オキシ] メチル] - 1 , 3 , 4 , 4 a , 5 , 6 , 6 a , 1 2 , 1 2 a , 1 2 b - デカヒドロ - 1 2 - ヒドロキシ - 4 , 6 a , 1 2 b - トリメチル - 1 1 - オキソ - 9 - (3 - ピリジニル) - 2 H , 1 1 H - ナフト [2 , 1 - b] ピラノ [3 , 4 - e] ピラン - 3 , 6 - ジイル] エステル、又は以下の化合物

20

【 0 2 6 3 】

M . U N . X . 3 : 1 1 - (4 - クロロ - 2 , 6 - ジメチルフェニル) - 1 2 - ヒドロキシ - 1 , 4 - ジオキサ - 9 - アザジスピロ [4 . 2 . 4 . 2] - テトラデカ - 1 1 - エン - 1 0 - オン、又は以下の化合物

M . U N . X . 4 : 3 - (4 ' - フルオロ - 2 , 4 - ジメチルピフェニル - 3 - イル) - 4 - ヒドロキシ - 8 - オキサ - 1 - アザスピロ [4 . 5] デカ - 3 - エン - 2 - オン、又は以下の化合物

30

M . U N . X . 5 : 1 - [2 - フルオロ - 4 - メチル - 5 - [(2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル) スルフィニル] フェニル] - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 5 - アミン、又はバチルス・フィルムス (b a c i l l u s f i r m u s) (V o t i v o , I - 1 5 8 2) を基にした活性物 (a c t i v e) 、又は

M . U N . X . 6 ; M . U N . X . 6 a) (E / Z) - N - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセトアミド ;
 M . U N . X . 6 b) (E / Z) - N - [1 - [(6 - クロロ - 5 - フルオロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセトアミド ;
 M . U N . X . 6 c) (E / Z) - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - N - [1 - [(6 - フルオロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] アセトアミド ;

40

【 0 2 6 4 】

M . U N . X . 6 d) (E / Z) - N - [1 - [(6 - ブロモ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセトアミド ;

M . U N . X . 6 e) (E / Z) - N - [1 - [1 - (6 - クロロ - 3 - ピリジル) エチル] - 2 - ピリジリデン] - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセトアミド ;

M . U N . X . 6 f) (E / Z) - N - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジル) メチル] - 2 - ピリジリデン] - 2 , 2 - ジフルオロ - アセトアミド ;

M . U N . X . 6 g) (E / Z) - 2 - クロロ - N - [1 - [(6 - クロロ - 3 - ピリジ

50

ル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド;
 M. UN. X. 6 h) (E/Z)-N-[1-[(2-クロロピリミジン-5-イル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド及び
 M. UN. X. 6 i) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-プロパンアミド)の群から選択される化合物、

又は、化合物

M. UN. X. 7:3-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-オキソ-1-(ピリミジン-5-イルメチル)ピリド[1,2-a]ピリミジン-1-イウム-2-オレート;又は

M. UN. X. 8:8-クロロ-N-[2-クロロ-5-メトキシフェニル)スルホニル]-6-トリフルオロメチル)-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド;
 ;又は

M. UN. X. 9:4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(1-オキソチエタン-3-イル)ベンズアミド;又は

M. UN. X. 10:5-[3-[2,6-ジクロロ-4-(3,3-ジクロロアリルオキシ)フェノキシ]プロポキシ]-1H-ピラゾール;又は

M. UN. X. 11:4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチル]ベンズアミド;又は

M. UN. X. 12:4-[5-[3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル]-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-N-[2-オキソ-2-(2,2,2-トリフルオロエチルアミノ)エチル]ナフタレン-1-カルボキサミド。

【0265】

市販されている、上に列挙したグループMの化合物は、いくつかある刊行物の中でも特に、The Pesticide Manual, 15th Edition, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011)に見いだすことができる。

【0266】

キノリン誘導体フロメトキンは、WO2006/013896において示されている。アミノフラノン化合物フルピラジフロンは、WO2007/115644から公知である。スルホキシミン化合物スルホキサフロルは、WO2007/149134から公知である。殺ダニ剤ピフルブミドはWO2007/020986から公知である。イソキサゾリン化合物は以下に記載されている: WO2005/085216においてM. UN. X. 1、WO2013/050317においてM. UN. X. 9、WO2005/085216においてM. UN. X. 11、並びにWO2009/002809及びWO2011/149749においてM. UN. X. 。ピリピロベン誘導体M. UN. X. 2は、WO2006/129714において記載されている。スピロケタールにより置換されている環式ケトエノール誘導体M. UN. X. 3は、WO2006/089633から公知であり、ピフェニルにより置換されているスピロ環式ケトエノール誘導体M. UN. X. 4は、WO2008/067911から公知である。最後に、M. UN. X. 5のようなトリアゾイルフェニルスルフィドは、WO2006/043635において記載されており、バチルス・フィルムスに基づく生物的防除剤は、WO2009/124707において記載されている。ネオニコチノイド系4A. 1は、WO20120/069266及びWO2011/06946から、M. 4. A. 2はWO2013/003977から、M 4. A. 3. はWO2010/069266から公知である。

【0267】

メタフルミゾン類似体M. 22Cは、CN10171577において記載されている。フタルアミド系M. 28. 1及びM. 28. 2はどちらもWO2007/101540か

10

20

30

40

50

ら公知である。アントラニルアミドM. 28. 3は、WO 2005 / 077934において記載されている。ヒドラジド化合物M. 28. 4は、WO 2007 / 043677において記載されている。アントラニルアミド系M. 28. 5a) ~ M. 28. 5h) は、WO 2007 / 006670、WO 2013 / 024009及びWO 2013 / 024010において記載されている通りに調製することができ、アントラニルアミドM. 28. 5i) は、WO 2011 / 085575において、M. 28. 5j) はWO 2008 / 134969において、M. 28. 5k) はUS 2011 / 046186において、及びM. 28. 5l) はWO 2012 / 034403において記載されている。ジアミド化合物M. 28. 6及びM. 28. 7は、CN 102613183において見いだすことができる。

10

【0268】

M. UN. X. 6に列挙されている化合物M. UN. X. 6a) ~ M. UN. X. 6i) は、WO 2012 / 029672において記載されている。メソイオン性アンタゴニスト化合物M. UN. X. 7は、WO 2012 / 092115において、殺線虫剤M. UN. X. 8はWO 2013 / 055584において、及びピリダリル型類似体M. UN. X. 10はWO 2010 / 060379において記載された。

好ましいさらなる有害生物活性成分は、IRACのグループ1であるアセチルコリンエステラーゼ (AChE) 阻害剤であり、本明細書ではグループ1A (カルバメート系) からのチオジカルブ、メトミル及びカルバリル、グループ1B (有機リン系) からのとりわけアセフェート、クロルピリホス (Chlorpyrifos) 及びジメトエート、グループ2Bからのフィプロール系、ここではとりわけエチプロール及びフィプロニル、グループ3からのピレスロイド系、ここではとりわけラムダ - シハロトリン、アルファ - シペルメトリン又はデルタメトリン、並びにグループ4Aからのネオニコチノイド系、ここではとりわけアセタミプリド、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、ニテンピラム、チアクロプリド又はティオメトキサムから選択されるものである。

20

とりわけ、本発明の化合物と、フィプロール系、ネオニコチノイド系又はピレスロイド系とを組み合わせると、カメムシ、特に

エウスキスツス (Euschistus)、例えば

エウスキスツス・ヘロス (Euschistus heros) の相乗的防除 (コルビーの式による) を示す可能性がある。

30

本発明による化合物と組み合わせて使用することができる、以下の活性物質のリストFは、可能な組合せを例示することを意図しており、それらを限定するものではない。

【0269】

F. I) 呼吸阻害剤

F. I - 1) Qo部位における複合体IIIの阻害剤:

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

40

オキサゾリジンジオン系及びイミダゾリノン系: ファモキサドン、フェナミドン;

【0270】

F. I - 2) 複合体IIIの阻害剤 (例えば、カルボキサミド系):

カルボキシアニリド系: ベノダニル、ベンゾビンジフルピル、ピキサフェン、ボスカリド、カルボキシン、フェンフラム、フェンヘキサミド、フルオピラム、フルトラニル、フラメトピル、イソピラザム、イソチアニル、メプロニル、オキシカルボキシン、ペンフルフェン、ベンチオピラド、セダキサン、テクロフタラム、チフルザミド、チアジニル、2 -

50

アミノ - 4 メチル - チアゾール - 5 - カルボキシアニリド、N - (3 ' , 4 ' , 5 ' トリフルオロピフェニル - 2 - イル) - 3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - カルボキサミド (フルキサピロキサド)、N - (4 ' - トリフルオロメチルチオピフェニル - 2 - イル) - 3 ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1 H ピラゾール - 4 - カルボキサミド、N - (2 - (1 , 3 , 3 - トリメチル - ブチル) - フェニル) - 1 , 3 - ジメチル - 5 フルオロ - 1 H - ピラゾール - 4 カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (トリフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、1 , 3 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (トリフルオロメチル) - 1 , 5 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - 1 , 5 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (トリフルオロメチル) - 1 - メチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、1 , 3 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (トリフルオロメチル) - 1 , 5 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、3 - (ジフルオロメチル) - 1 , 5 - ジメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド、1 , 3 , 5 - トリメチル - N - (1 , 1 , 3 - トリメチルインダン - 4 - イル) ピラゾール - 4 - カルボキサミド ;

10

20

30

40

50

【 0 2 7 1 】

F . I - 3) Q i 部位での複合体 I I I の阻害剤 : シアゾファミド、アミスルプロム、[(3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [(3 - アセトキシ - 4 - メトキシ - ピリジン - 2 - カルボニル) アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル] 2 - メチルプロパノエート、[(3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [[3 - (アセトキシメトキシ) - 4 - メトキシ - ピリジン - 2 - カルボニル] アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル] 2 - メチルプロパノエート、[(3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [(3 - イソプロトキシカルボニルオキシ - 4 - メトキシ - ピリジン - 2 - カルボニル) アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル] 2 - メチルプロパノエート、[(3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 8 - ベンジル - 3 - [[3 - (1 , 3 - ベンゾジオキソール - 5 - イルメトキシ) - 4 - メトキシ - ピリジン - 2 - カルボニル] アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル] 2 - メチルプロパノエート、3 S , 6 S , 7 R , 8 R) - 3 - [[(3 - ヒドロキシ - 4 - メトキシ - 2 - ピリジニル) カルボニル] アミノ] - 6 - メチル - 4 , 9 - ジオキソ - 8 - (フェニルメチル) - 1 , 5 - ジオキソナン - 7 - イル 2 - メチルプロパノエート ;

【 0 2 7 2 】

F . I - 4) 他の呼吸阻害剤 (複合体 I 、脱共役剤) ジフルメトリム ; (5 , 8 - ジフルオロキナゾリン - 4 - イル) - { 2 - [2 - フルオロ - 4 - (4 - トリフルオロメチルピリジン - 2 - イルオキシ) - フェニル] - エチル } - アミン、テクナゼン、アメトクトラジン、シルチオフアム、ニトロフェニル誘導体 : ビナバクリル、ジノブトン、ジノカップ、フルアジナム、フェリムゾン、ニトルタール - イソプロピル、及び有機金属化合物を含むもの : フェンチンアセテート、塩化フェンチン又は水酸化フェンチンなどのフェンチン塩 ;

【 0 2 7 3 】

F . I I) ステロール生合成阻害剤 (S B I 殺菌剤)

F . I I - 1) C 1 4 デメチラーゼ阻害剤 (D M I 殺菌剤、例えばトリアゾール系、イミ

ダゾール系)

トリアゾール系：アザコナゾール、ピテルタノール、ブロムコナゾール、シブロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、ジニコナゾール - M、エボキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキンコナゾール、フルシラゾール、フルトリアホール、ヘキサコナゾール、イミベンコナゾール、イブコナゾール、メトコナゾール、マイクロブタニル、パクロブトラゾール、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロチオコナゾール、シメコナゾール、テブコナゾール、テトラコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリチコナゾール、ウニコナゾール、1 - [r e l - (2 S ; 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - オキシラニルメチル] - 5 - チオシアナト - 1 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール、2 - [r e l - (2 S ; 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - オキシラニルメチル] - 2 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - チオール；

イミダゾール系：イマザリル、ペフラゾエート、オキスポコナゾール、プロクロラズ、トリフルミゾール；

ピリミジン系、ピリジン系及びピペラジン系：フェナリモール、ヌアリモール、ピリフェノックス、トリホリン、1 - [r e l - (2 S ; 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - オキシラニルメチル] - 5 - チオシアナト - 1 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール、2 - [r e l - (2 S ; 3 R) - 3 - (2 - クロロフェニル) - 2 - (2 , 4 - ジフルオロフェニル) - オキシラニルメチル] - 2 H - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 3 - チオール；

【 0 2 7 4 】

F . I I - 2) デルタ 1 4 - レダクターゼ阻害剤 (アミン系、例えばモルホリン系、ピペリジン系)

モルホリン系：アルジモルフ、ドデモルフ、ドデモルフ - アセテート、フェンブプロピモルフ、トリデモルフ；

ピペリジン系：フェンブプロピジン；ピペラリン、スピロケタラミン系：スピロキサミン；
F . I I - 3) 3 - ケトレダクターゼの阻害剤：ヒドロキシアニリド系：フェンヘキサミド；

【 0 2 7 5 】

F . I I I) 核酸合成阻害剤

F . I I I - 1) R N A 、 D N A 合成

フェニルアミド系又はアシルアミノ酸殺菌剤：ベナラキシル、ベナラキシル - M、キララキシル、メタラキシル、メタラキシル - M (メフェノキサム)、オフラセ、オキサジキシル；

イソオキサゾール系及びイソチアゾロン系：ヒメキサゾール、オクチリノン；

F . I I I - 2) D N A トポイソメラーゼ阻害剤：オキソリン酸；

F . I I I - 3) ヌクレオチド代謝 (例えばアデノシン - デアミナーゼ)、ヒドロキシ (2 - アミノ) - ピリミジン系：ブピリメート；

【 0 2 7 6 】

F . I V) 細胞分裂及び又は細胞骨格の阻害剤

F . I V - 1) チュープリン阻害剤：ベンゾイミダゾール系及びチオフアネート系：ベノミル、カルベンダジウム、フベリダゾール、チアベンダゾール、チオフアネート - メチル；
チアゾロピリミジン系：5 - クロロ - 7 (4 - メチルピペリジン - 1 - イル) - 6 - (2 , 4 , 6 - トリフルオロフェニル) - [1 , 2 , 4] トリアゾロ [1 , 5 a] ピリミジン；

F . I V - 2) 他の細胞分裂阻害剤

ベンズアミド系及びフェニルアセトアミド系：ジエトフェンカルブ、エタボキサム、ペンシクロン、フルオピコリド、ゾキサミド；

F . I V - 3) アクチン阻害剤：ベンゾフェノン系：メトラフェノン、ピリオフェノン；

【 0 2 7 7 】

10

20

30

40

50

F . V) アミノ酸及びタンパク質合成の阻害剤

F . V - 1) メチオニン合成阻害剤 (アニリノ - ピリミジン系)

アニリノ - ピリミジン系 : シプロジニル、メバニピリム、ニトラピリン、ピリメタニル ;

F . V - 2) タンパク質合成阻害剤 (アニリノ - ピリミジン系)

抗生物質 : プラスチシジン - S S、カスガマイシン、カスガマイシン塩酸塩 - 水和物、ミルジオマイシン、ストレプトマイシン、オキシテトラサイクリン、ポリオキシシン、バリダマイシン A ;

【 0 2 7 8 】

F . V I) シグナル伝達阻害剤

F . V I - 1) M A P / ヒスチジンキナーゼ阻害剤 (例えば、アニリノ - ピリミジン系)

ジカルボキシイミド系 : フルオロイミド、イプロジオン、プロシミドン、ピンクロゾリン ;

フェニルピロール系 : フェンピクロニル、フルジオキソニル ;

F . V I - 2) G タンパク質阻害剤 : キノリン系 : キノキシフェン ;

【 0 2 7 9 】

F . V I I) 脂質及び膜合成阻害剤

F . V I I - 1) リン脂質生合成阻害剤

有機リン化合物 : エジフェンホス、イプロベンホス、ピラゾホス ;

ジチオラン系 : イソプロチオラン ;

F . V I I - 2) 脂質過酸化 : 芳香族炭化水素系 : ジクロラン、キントゼン、テクナゼン、トルクロホス - メチル、ピフェニル、クロロネブ、エトリジアゾール ;

F . V I I - 3) カルボキシル酸アミド系 (C A A 殺菌剤)

ケイ皮酸アミド系又はマンデル酸アミド系 : ジメトモルフ、フルモルフ、マンジプロアミド、ピリモルフ ;

バリンアミドカルバメート系 : ベンチアバリカルブ、イプロバリカルブ、ピリベンカルブ、バリフェナレート及び N - (1 - (1 - (4 - シアノ - フェニル) エタンスルホニル) - ブタ - 2 - イル) カルバミン酸 (4 - フルオロフェニル) エステル ;

F . V I I - 4) 細胞膜透過性及び脂肪酸に影響を及ぼす化合物 :

1 - [4 - [4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - チアゾリル] - 1 - ピペリジニル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン、カルバメート系 : プロバモカルブ、プロバモカルブ - 塩酸塩、

F . V I I - 5) 脂肪酸アミドヒドロラーゼ阻害剤 : 1 - [4 - [4 - [5 - (2 , 6 - ジフルオロフェニル) - 4 , 5 - ジヒドロ - 3 - イソオキサゾリル] - 2 - チアゾリル] - 1 - ピペリジニル] - 2 - [5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1 H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン ;

【 0 2 8 0 】

F . V I I I) 多部位に作用する阻害剤

F . V I I I - 1) 無機活性物質 : ボルドー混合液、酢酸銅、水酸化銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅、硫黄 ;

F . V I I I - 2) チオ及びジチオカルバメート系 : フェルバム、マンコゼブ、マネブ、メタム、メタスルホカルブ、メチラム、プロピネブ、チラム、ジネブ、ジラム ;

F . V I I I - 3) 有機塩素化合物 (例えば、フタルイミド系、スルファミド系、クロロニトリル系) :

アニラジン、クロロタロニル、カプタホル、カプタン、フォルベット、ジクロフルアニド、ジクロロフェン、フルスルファミド、ヘキサクロロベンゼン、ペンタクロロフェノール及びその塩、フタリド、トリルフルアニド、N - (4 - クロロ - 2 - ニトロ - フェニル) - N - エチル - 4 - メチル - ベンゼンスルホンアミド ;

F . V I I I - 4) グアニジン系及び他のもの : グアニジン、ドジン、ドジン遊離塩基、グアザチン、グアザチン - アセテート、イミノクタジン、イミノクタジン - トリアセター

10

20

30

40

50

ト、イミノクタジン - トリス (アルベシレート)、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) - テトラオン ;

F . V I I I - 5) アントラキノン (A h t r a q u i n o n e) 系 : ジチアノン ;

【 0 2 8 1 】

F . I X) 細胞壁合成阻害剤

F . I X - 1) グルカンの合成阻害剤 : バリダマイシン、ポリオキシシン B ;

F . I X - 2) メラニン合成阻害剤 : ピロキロン、トリシクラゾール、カルプロパミド、ジシクロメット、フェノキサニル ;

F . X) 植物防御誘導剤

F . X - 1) サリチル酸経路 : アシベンゾラル - S - メチル ;

F . X - 2) 他のもの : プロベナゾール、イソチアニル、チアジニル、プロヘキサジオン - カルシウム ;

ホスホネート系 : ホセチル、ホセチル - アルミニウム、亜リン酸及びその塩 ;

【 0 2 8 2 】

F . X I) 未知の作用機序 : プロノポール、キノメチオネート、シフルフェナミド、シモキサニル、ダゾメット、デバカルブ、ジクロメジン、ジフェンゾコート、ジフェンゾコート - メチルサルフェート、ジフェニルアミン、フェンピラザミン、フルメトベル、フルスルファミド、フルチアニル、メタスルホカルブ、ニトラピリン、ニトロタル - イソプロピル、オキサチアピプロリン、オキシシン - 銅、プロキナジド、テブフロキン、テクロフタラム、トリアゾキシド、2 - ブトキシ - 6 - ヨード - 3 - プロピルクロメン - 4 - オン、N - (シクロプロピルメトキシイミノ - (6 - ジフルオロ - メトキシ - 2, 3 - ジフルオロ - フェニル) - メチル) - 2 - フェニルアセトアミド、N' - (4 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 2, 5 - ジメチル - フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムアミジン、N' - (4 - (4 - フルオロ - 3 - トリフルオロメチル - フェノキシ) - 2, 5 - ジメチル - フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムアミジン、N' - (2 - メチル - 5 - トリフルオロメチル - 4 - (3 - トリメチルシラニル - プロボキシ) - フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムアミジン、N' - (5 - ジフルオロメチル - 2 - メチル - 4 - (3 - トリメチルシラニル - プロボキシ) - フェニル) - N - エチル - N - メチルホルムアミジン、2 - { 1 - [2 - (5 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル) - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチル - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イル) - アミド、2 - { 1 - [2 - (5 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - ピラゾール - 1 - イル) - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - チアゾール - 4 - カルボン酸メチル - (R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - ナフタレン - 1 - イル - アミド、メトキシ - 酢酸 6 - t e r t - ブチル - 8 - フルオロ - 2, 3 - ジメチル - キノリン - 4 - イルエステル及び N - メチル - 2 - { 1 - [(5 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 1 - イル) - アセチル] - ピペリジン - 4 - イル } - N - [(1 R) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル] - 4 - チアゾールカルボキサミド、3 - [5 - (4 - クロロ - フェニル) - 2, 3 - ジメチル - イソオキサゾリジン - 3 イル] - ピリジン、ピリソキサゾール、5 - アミノ - 2 - イソプロピル - 3 - オキソ - 4 - オルト - トリル - 2, 3 - ジヒドロ - ピラゾール - 1 - カルボチオ酸 S - アリルエステル、N - (6 - メトキシ - ピリジン - 3 - イル) シクロプロパンカルボン酸アミド、5 - クロロ - 1 (4, 6 - ジメトキシ - ピリミジン - 2 - イル) - 2 - メチル - 1 H - ベンゾイミダゾール、2 - (4 - クロロ - フェニル) - N - [4 - (3, 4 - ジメトキシ - フェニル) - イソオキサゾール - 5 - イル] - 2 - プロパ - 2 - イニルオキシ - アセトアミド、

【 0 2 8 3 】

F . X I I) 生長調節剤 : アブシジン酸、アミドクロル、アンシミドール、6 - ベンジルアミノプリン、ブラシノリド、ブトラリン、クロルメクワット (クロルメクワットクロリド)、コリンクロリド、シクラニリド、ダミノジド、ジケグラック、ジメチピン、2,

10

20

30

40

50

6 - ジメチルブリジン、エテホン、フルメトラリン、フルルブリミドール、フルチアセット、ホルクロルフエヌロン、ジベレリン酸、イナベンフィド、インドール - 3 - 酢酸、マレイン酸ヒドラジド、メフルイジド、メピクワット (メピクワットクロリド)、ナフタレン酢酸、N 6 - ベンジルアデニン、パクロブトラゾール、プロヘキサジオン (プロヘキサジオン - カルシウム)、プロヒドロジャスモン、チジアズロン、トリアペンテノール、トリブチルホスホロトリチオエート、2, 3, 5トリヨード安息香酸、トリネキサパック - エチル及びウニコナゾール;

【0284】

F. XIIII) 生物的防除剤

アンペロミセス・クイスクアリス (*Ampelomyces quisqualis*) (例
例えば、AQ10 (登録商標)、Intrachem Bio GmbH & Co. KG、
ドイツ)、アスペルギルス・フラブス (*Aspergillus flavus*) (例
例えば、AFLAGUARD (登録商標)、Syngenta、スイス)、アウレオバシディ
ウム・プルランス (*Aureobasidium pullulans*) (例
例えば、BOTECTOR (登録商標)、bio-ferm GmbH、ドイツ)、バチルス・プミ
ルス (*Bacillus pumilus*) (例
例えば、SONATA (登録商標) 及びBAL
LLAD (登録商標) Plus におけるNRRL受託番号B-30087、AgraQu
est Inc.、米国)、バチルス・スブチリス (*Bacillus subtilis*) (例
例えば、RHAPSODY (登録商標)、SERENADE (登録商標) MAX 及
びSERENADE (登録商標) ASO における単離物NRRL-Nr. B-21661
、AgraQuest Inc.、米国)、バチルス・スブチリス変種アミロリクエファ
シエンス (*Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens*) FZB24 (例
例えば、TAEGRO (登録商標)、Novozyme Bio
logicals, Inc.、米国)、カンディダ・オレオフィラ (*Candida oleophila*) I-82 (例
例えば、ASPIRE (登録商標)、Ecogen Inc.、米国)、カンディダ・サイトアナ (*Candida saitoana*) (例
例えば、BIOCURE (登録商標) (リゾチームとの混合物中) 及びBIOCOAT (登録
商標)、Micro Flo Company、米国 (BASF SE) 及びArysta
)、キトサン (例
例えば、ARMOUR-ZEN、BotriZen Ltd.、ニュー
ーランド)、グリオクラディウム・カテヌラツム (*Gliocladium caten
ulatum*) と呼ばれる、クロノスタキス・ロゼアフ・カテヌラタ (*Clonost
achys rosea* f. *catenulata*) (例
例えば、単離物J1446: P
RESTOP (登録商標)、Verdera、フィンランド)、コニオチリウム・ミニタ
ンス (*Coniothyrium minitans*) (例
例えば、CONTANS (登録
商標)、Prophyta、ドイツ)、クリホネクトリア・パラシチカ (*Cryphon
ectria parasitica*) (例
例えば、エンドチア・パラシチカ (*Endot
hia parasitica*)、CNICM、フランス)、クリプトコックス・アルビ
ドゥス (*Cryptococcus albidus*) (例
例えば、YIELD PLUS
(登録商標)、Anchor Bio-Technologies、南アフリカ)、フサ
リウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) (例
例えば、BIOF
OX (登録商標)、S.I.A.P.A.、イタリア、FUSACLEAN (登録商標)
、Natural Plant Protection、フランス)、メトスチニコピア
・フルクチコラ (*Metschnikowia fructicola*) (例
例えば、SH
EMER (登録商標)、Agrogreen、イスラエル)、ミクロドキウム・ジメルム
(*Microdochium dimerum*) (例
例えば、ANTI BOT (登録商標)
)、Agrauxine、フランス)、プレビオプシス・ギガンテア (*Phlebiop
sis gigantea*) (例
例えば、ROTSOP (登録商標)、Verdera、フ
インランド)、シュードジマ・フロクロサ (*Pseudozyma flocculos
a*) (例
例えば、SPORODEX (登録商標)、Plant Products Co.
Ltd.、カナダ)、ピチウム・オリガンドルム (*Pythium oligandru*

m) DV74 (例えば、POLYVERSUM (登録商標)、Remeslo SSRO、Biopreparaty、チェコ)、レイノウトリア・サキリネンシス (Reynoutria sachlinensis) (例えば、REGALIA (登録商標)、Marrone BioInnovations、米国)、タラロマイセス・フラプス (Talaromyces flavus) V117b (例えば、PROTUS (登録商標)、Prophyta、ドイツ)、トリコデルマ・アスペレルム (Trichoderma asperellum) SKT-1 (例えば、ECO-HOPE (登録商標)、クミアイ化学工業株式会社、日本)、T.アトロビリデ (T.atroviride) LC52 (例えば、SENTINEL (登録商標)、Agrimm Technologies Ltd、ニュージーランド)、T.ハルジアヌム (T.harzianum) T-22 (例えば、PLANTSHIELD (登録商標)、der Firma BioWorks Inc.、米国)、T.ハルジアヌム TH35 (例えば、ROOT PRO (登録商標)、Mycontrol Ltd.、イスラエル)、T.ハルジアヌム T-39 (例えば、TRICHODEX (登録商標) 及び TRICHODERMA 2000 (登録商標)、Mycontrol Ltd.、イスラエル及び Makhteshim Ltd.、イスラエル)、T.ハルジアヌム 及び T.ビリデ (T.viride) (例えば、TRICHOPEL、Agrimm Technologies Ltd、ニュージーランド)、T.ハルジアヌム ICC012 及び T.ビリデ ICC080 (例えば、REMEDIER (登録商標) WP、Isagro Ricerca、イタリア)、T.ポリスボルム (T.polysporum) 及び T.ハルジアヌム (例えば、BINAB (登録商標)、BINAB Bio-Innovation AB、スエーデン)、T.ストロマチウム (T.stromaticum) (例えば、TRICOVAB (登録商標)、C.E.P.L.A.C.、ブラジル)、T.ビレンス (T.virens) GL-21 (例えば、SOILGARD (登録商標)、Certis LLC、米国)、T.ビリデ (例えば、TRIECO (登録商標)、Ecosense Labs. (インド)、Pvt. Ltd.、Indiene、BIO-CURE (登録商標) F、T.Stanes & Co. Ltd.、Indiene)、T.ビリデ TV1 (例えば、T.ビリデ TV1、Agribiotecc srl、イタリア)、ウロクラディウム・オウデマンシイ (Ulocladium oudemansii) HRU3 (例えば、BOTRY-ZEN (登録商標)、Botry-Zen Ltd、ニュージーランド)。

【0285】

上で列挙したグループ F の市販化合物 II は、とりわけ刊行物の中でも、The Pesticide Manual, 15th Edition, C. D. S. Tomlin, British Crop Protection Council (2011) に見いだすことができる。有害な菌に対するそれらの調製及びそれらの活性は公知である (参照: <http://www.alanwood.net/pesticides/>) ; これらの物質は市販されている。IUPAC 命名法により記載されている化合物、それらの調製、及びそれらの殺菌活性もまた公知である (参照、Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968、欧州特許出願公開第 141317 号、欧州特許出願公開第 152031 号、欧州特許出願公開第 226917 号、欧州特許出願公開第 243970 号、欧州特許出願公開第 256503 号、欧州特許出願公開第 428941 号、欧州特許出願公開第 532022 号、欧州特許出願公開第 1028125 号、欧州特許出願公開第 1035122 号、欧州特許出願公開第 1201648 号、欧州特許出願公開第 1122244 号、JP2002316902、DE19650197、DE10021412、DE102005009458、US3,296,272、US3,325,503、WO98/46608、WO99/14187、WO99/24413、WO99/27783、WO00/29404、WO00/46148、WO00/65913、WO01/54501、WO01/56358、WO02/22583、WO02/40431、WO03/10149、WO03/11853、WO03/14103、WO03/16286、WO03/53145、WO03/61388、WO03/66609、WO03/74491、WO04/49804、WO04/83193、WO05/120234、WO05/123689、WO05/12369

0、WO 05 / 6 3 7 2 1、WO 05 / 8 7 7 7 2、WO 05 / 8 7 7 7 3、WO 06 / 1 5 8 6 6、WO 06 / 8 7 3 2 5、WO 06 / 8 7 3 4 3、WO 07 / 8 2 0 9 8、WO 07 / 9 0 6 2 4、WO 11 / 0 2 8 6 5 7)。

【0286】

本発明の化合物は、種子伝染性、土壌伝染性又は葉面の菌類の病害に対して植物を保護するために、土壌、ピート又は他の根付け用媒体 (r o o t i n g m e d i a) と混合してもよい。

【0287】

組成物中で使用するための適切な相乗剤の例には、ピペロニルブトキシド、セサメクス、サフロキサシ及びドデシルイミダゾールが含まれる。

10

組成物中に含むための適切な除草剤及び植物生長調節剤は、所期の標的及び必要とする効果に依存する。

含むことができるイネの選択的な除草剤の一例は、プロパニルである。ワタに使用するための植物生長調節剤の一例は、P I X (商標) である。

一部の混合物は、かなり異なる物理的、化学的又は生物的特性を有するので、同じものには容易に適さない活性成分を含むことができる。

無脊椎有害生物 (「動物有害生物」とも称される)、すなわち、昆虫、クモ形類及び線虫、植物、植物が生長中若しくは生長することができる土壌又は水を、当技術分野で公知の任意の施用方法によって、本発明の化合物又はそれを含む組成物に接触させることができる。したがって、「接触」には、直接接触 (本化合物 / 組成物を無脊椎有害生物又は植物、通常、該植物の葉、茎又は根へ直接施用) と間接接触 (本化合物 / 組成物を無脊椎有害生物又は植物の発生場所へ施用) の両方が含まれる。

20

本発明の化合物又はそれを含む殺有害生物組成物は、生長中の植物 / 作物を殺有害生物有効量の本発明の化合物に接触させることにより、動物有害生物、とりわけ昆虫、ダニ類又はクモ形類による攻撃又は侵襲から該植物及び作物を保護するために使用することができる。「作物」という用語は、生長中の作物及び収穫済みの作物の両方を指す。

【0288】

本発明の化合物及びそれを含む組成物は、穀物、根作物、油料作物、野菜、香辛料、観賞植物、例えばデュラムコムギ及び他のコムギ、オオムギ、オートムギ、ライムギ、トウモロコシ (飼料用トウモロコシ及び砂糖用トウモロコシ / スイートコーン及びフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、アブラナ、カブ、サトウダイコン、飼料用ピート、ナス、ジャガイモ、イネ科草、芝地、芝生、飼料用イネ科草、トマト、リーキ、カボチャ / スカッシュ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ科属の種 (B r a s s i c a s p e c i e s)、メロン、ピーズ、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、ジャガイモなどの塊茎植物、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム / テンジクアオイ、パンジー、並びにインパチェンスの種子などの様々な栽培植物に対して、多くの昆虫を防除するのに、特に重要である。

30

【0289】

本発明の化合物は、殺虫性の攻撃から保護すべき、昆虫又は植物、種子、土壌、表面、資材若しくは部屋などの植物繁殖材料を、殺虫有効量の活性化合物で処理することにより、そのまま又は組成物の形態で使用される。この施用は、昆虫による、植物、種子、土壌、表面、資材又は部屋などの植物繁殖材料の感染前及び感染後の両方に実施することができる。

40

さらに、無脊椎有害生物は、標的とする有害生物、その餌供給源、生息地、繁殖地又はその発生場所を、殺有害生物有効量の本発明の化合物に接触させることによって防除することができる。こうして、この施用は、有害生物による、発生場所、生長中の作物若しくは収穫済みの作物の感染前又は感染後に行うことができる。

本発明の化合物はまた、有害生物の発生が予期される場所に予防的に施用することもできる。

50

本発明の化合物はまた、生長中の植物を殺有害生物有効量の本発明の化合物に接触させることにより、有害生物による攻撃又は侵襲から該植物を保護するために使用することもできる。したがって、「接触」には、直接接触（本化合物／組成物を有害生物及び／又は植物、通常、該植物の葉、茎又は根へ直接施用）と間接接触（本化合物／組成物を有害生物及び／又は植物の発生場所へ施用）の両方が含まれる。

【0290】

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

一般に、「殺有害生物有効量」とは、標的生物の壊死、死滅、成長遅延、予防及び除去、破壊、その他にはその発生及び活動の低減という効果を含めた、成長に対する観察可能な効果を達成するために必要な活性成分の量を意味する。殺有害生物有効量は、本発明において使用される様々な化合物／組成物について変えることができる。本組成物の殺有害生物有効量は、所望の殺有害生物効果及び持続時間、天候、標的種、発生場所、施用様式などの一般条件に応じて変動することにもなる。

土壌処理の場合、又は有害生物が生息している場所又は巣への施用の場合、活性成分の量は、 100 m^2 あたり $0.0001\sim500\text{ g}$ 、好ましくは 100 m^2 あたり $0.001\sim20\text{ g}$ の範囲である。

【0291】

資材を保護する際の慣用的な施用量は、例えば、処理される資材 1 m^2 あたり活性化合物 $0.01\text{ g}\sim1000\text{ g}$ 、望ましくは 1 m^2 あたり $0.1\text{ g}\sim50\text{ g}$ である。

資材の含浸に使用するための殺虫剤組成物は、少なくとも1つの忌避剤及び／又は殺虫剤を、通常、 $0.001\sim95\text{ 質量}\%$ 、好ましくは $0.1\sim45\text{ 質量}\%$ 、より好ましくは $1\sim25\text{ 質量}\%$ 含有する。

作物植物を処理する場合、本発明の活性成分の施用量は、1ヘクタールあたり $0.1\text{ g}\sim4000\text{ g}$ 、望ましくは1ヘクタールあたり $5\text{ g}\sim500\text{ g}$ 、より望ましくは1ヘクタールあたり $5\text{ g}\sim200\text{ g}$ の範囲とすることができる。

本発明の化合物は接触（土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、植物の一部又は動物の一部を介する）と摂取（餌又は植物部分）のどちらによっても効果的である。

本発明の化合物はまた、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、カ、コオロギ又はゴキブリなどの非作物害虫に対して施用することもできる。前記非作物有害生物に対する使用の場合、本発明の化合物は、餌組成物中で好ましくは使用される。

【0292】

この餌は液状、固体又は半固体の調製物（例えば、ゲル製剤）とすることができる。固体の餌は、個々の施用に適した、様々な形状及び形態、例えば粒状、塊状、棒状、円板状に形成することができる。液状の餌は、適切な施用を確実にするための様々なデバイス、例えば、開放容器、噴霧デバイス、液滴供給源、又は蒸気供給源に充填することができる。ゲル製剤は、水性又は油性のマトリクスをベースとすることができ、粘性、水分保持又はエージング特性の点で特定の必需品に配合することができる。

組成物中に使用される餌は、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、カ、コオロギなどの昆虫、又はゴキブリがその餌を食べるように駆り立てるのに十分誘引性のある製品である。この誘引性は、摂食刺激物質又は性フェロモンを用いることにより操作することができる。食餌刺激物質は、例えば、限定するものではないが、動物及び／又は植物タンパク質（肉粉、魚粉又は血粉、昆虫の一部、卵黄）から、動物及び／又は植物由来の油脂、又は有機単糖、有機オリゴ糖若しくは有機多糖から、とりわけスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチン、又はさらには糖蜜若しくは蜂蜜からも選択される。果実、作物、植物、動物、昆虫若しくはそれらの特定部分の新鮮な部分又は腐りかけの部分も、摂食刺激物質としての役割を果たすことができる。性フェロモンは、より昆虫特異的であることが知られている。特異的フェロモンは、文献に記載されており、当業者に公知である。

【0293】

餌組成物における使用の場合、活性成分の一般的な含有量は、活性成分が 0.001 質量% ~ 15 質量%、望ましくは 0.001 質量% ~ 5 質量%である。

エアゾール剤（例えば、スプレー缶中）、油性スプレー剤又はボンブスプレー剤としての本発明の化合物の製剤は、ハエ、ノミ、マダニ、カ又はゴキブリなどの有害生物を防除するため、非専門使用者にとって非常に適している。エアゾール剤の処方物は、好ましくは、本活性化合物、低級アルコール（例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール）、ケトン（例えば、アセトン、メチルエチルケトン）、沸点範囲が約 50 ~ 250 を有するパラフィン系炭化水素（例えば、灯油）、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素（トルエン、キシレンなど）、水などの溶媒、さらには、モノオレイン酸ソルビトール、3 ~ 7 mol のエチレンオキシドを有するオレイルエトキシレート、脂肪アルコールエトキシレートなどの乳化剤、エーテル油、中鎖脂肪酸の低級アルコールとのエステル、芳香族カルボニル化合物などの香油、適切な場合、安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチルなどの安定化剤、及び必要に応じて、プロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、一酸化二窒素、又はこれらのガスの混合物など噴射剤などの補助剤からなる。

【0294】

油性スプレー製剤は、噴射剤を使用しない点で、エアゾール剤の処方物とは異なる。

スプレー用組成物における使用の場合、活性成分の含有量は、0.001 ~ 80 質量%、好ましくは 0.01 ~ 50 質量%、最も好ましくは 0.01 ~ 15 質量%である。

本発明の化合物及びその個々の組成物はまた、蚊取線香及び燻蒸線香、発煙カートリッジ、気化器プレート又は長期間型気化器、さらにまた虫取り紙、虫用パッド又は他の加熱非依存型気化器システムで使用することもできる。

【0295】

本発明の化合物及びその個々の組成物を用いて、昆虫により媒介される感染症（例えば、マラリア、デング熱及び黄熱病、リンパ性系状虫症、及びリーシュマニア症）を防除する方法はまた、小屋及び家屋の表面処理、カーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェバエ用捕獲具などの空気噴霧及び含浸も含む。繊維、織物、ニット製品、不織布、ネット状材料又はホイル及び防水布に施用するための殺虫剤組成物は、本殺虫剤を含み、忌避剤及び少なくとも 1 種の結合剤を含んでもよい混合物を含むのが好ましい。適切な忌避剤には、例えば、N, N - ジエチル - メタ - トルアミド (DEET)、N, N - ジエチルフェニルアセトアミド (DEPA)、1 - (3 - シクロヘキサン - 1 - イル - カルボニル) - 2 - メチルピペリン、(2 - ヒドロキシメチルシクロヘキシル) 酢酸ラクトン、2 - エチル - 1, 3 - ヘキサジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド (MNDA)、{ (+ / -) - 3 - アリル - 2 - メチル - 4 - オキシシクロペンタ - 2 - (+) - エニル - (+) - trans - クリサンテメート (エスピオトリン) などの昆虫防除用ではないピレスロイド、リモネン、オイゲノール、(+) - ユーカマロール (1)、(-) - 1 - エピ - ユーカマロールのような植物抽出物から誘導されるか若しくはそれと同一の忌避剤、又はスポッテッドガム (*Eucalyptus maculata*)、ハマゴウ (*Vitex rotundifolia*)、パルマローザ (*Cymbopogon martinii*)、シムボガン・シトラツス (*Cymbopogon citratus*) (レモングラス)、シモボガン・ナルトドゥス (*Cymbopogon nardus*) (シトロネラ) のような植物からの粗製植物抽出物がある。好適な結合剤は、例えば、脂肪酸のビニルエステル (酢酸ビニル及びビニルベルサレートなど)、アクリル酸ブチル、2 - エチルヘキシルアクリレート及びアクリル酸メチルなどのアルコールのアクリル酸及びメタクリル酸エステル、スチレンなどのモノエチレン性及びジエチレン性不飽和炭化水素、及びブタジエンなどの脂肪族ジエンのポリマー並びにコポリマーから選択される。

【0296】

カーテン及び蚊帳の含浸は、一般に、その繊維材料を殺虫剤のエマルジョン又は分散液に浸漬するか、又は蚊帳上にそれらをスプレーすることにより行われる。

10

20

30

40

50

本発明の化合物及びその組成物は、木製材料（木、板塀、枕木など）、及び建物（家屋、納屋、工場など）だけではなく、建築材料、家具、皮革、繊維、ビニル用品、電線、及びケーブルなどもアリ及び／又はシロアリから保護するため、並びに作物又はヒトに害を加えること（例えば、有害生物が家屋及び公共施設に侵入する場合）からアリ及びシロアリを防除するために使用することができる。本発明の化合物は、木製材料を保護するために、周囲の土壌表面又は床下の土壌中に施用されるだけではなく、床下コンクリート、床柱、梁、合板、家具などの表面などの製材物品、パーティクルボード、ハーフボードなどの木製物品、及び被覆電線、ビニルシートなどのビニル物品、スチレン発泡体などの熱絶縁材料にも施用することができる。作物又はヒトに害を与えるアリに対して施用する場合、本発明のアリ防除器は、作物又は周囲の土壌に施用されるか、又はアリの巣などに直接施用される。

10

【0297】

本発明の化合物はまた、植物繁殖材料を害虫から、特に土壌生息害虫から保護するために、該材料、とりわけ種子の処理、並びに土壌有害生物及び葉面昆虫に対して、得られた植物の根及び苗条を処理するのにも適している。

本発明の化合物は、土壌有害生物からの種子を保護する、並びに土壌有害生物及び葉面昆虫に対して、得られた植物の根及び苗条を保護するのに特に有用である。得られた植物の根及び苗条の保護が好ましい。より好ましいのは、得られた植物の苗条の、刺性及び吸汁性昆虫からの保護であり、アブラムシからの保護が最も好ましい。

したがって、本発明は、昆虫、特に土壌昆虫から種子を保護する、並びに昆虫、特に土壌昆虫及び葉面昆虫から苗の根及び苗条を保護する方法であって、播種前及び／又は予備発芽（*pregermi nation*）後の種子を本発明の化合物（その塩を含む）に接触させるステップを含む、方法を含む。特に好ましいのは、植物の根及び苗条が保護される方法であり、より好ましくは、植物の苗条が刺性及び吸汁性昆虫から（*form*）保護される方法であり、最も好ましくは、植物の苗条がアブラムシから保護される方法である。

20

【0298】

種子という用語は、種子、及び以下に限定されないが、まさに種子そのもの、種子片、吸枝、球茎、鱗茎、果実、塊茎、子実、挿し木、切り苗条などを含むすべての種類の植物繁殖体を包含し、好ましい実施形態では、まさに種子そのものを意味する。

30

種子処理という用語は、種子粉衣、種子コーティング、種子散粉、種子浸漬及び種子ペレット化などの当分野で公知の適切な種子処理技法のすべてを含む。

本発明はまた、活性化化合物によりコーティングされているか、又はそれを含有している種子も含む。

「コーティングされている及び／又は含有している」という用語は、活性成分の大部分が、施用時に繁殖製品の表面上に存在しているが、多量又は少量の該成分が、施用方法に応じて繁殖製品の内部に浸透し得ることを一般に意味する。前記繁殖製品が（再び）植えられる際に、活性成分を吸収することがある。

【0299】

適切な種子は、穀物、根作物、油料作物、野菜、香辛料、観賞植物、例えばデュラムコムギ及び他のコムギ、オオムギ、オートムギ、ライムギ、トウモロコシ（飼料用トウモロコシ及び砂糖用トウモロコシ／スイートコーン及びフィールドコーン）、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、アブラナ、カブ、サトウダイコン、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科草、芝地、芝生、飼料用イネ科草、トマト、リーキ、カボチャ／スカッシュ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ科属の種、メロン、ピーズ、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、ジャガイモなどの塊茎植物、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム／テンジクアオイ、パンジー及びインパチェンスの種子である。

40

【0300】

さらに、活性化化合物はまた、遺伝子工学的方法を含む育種による除草剤又は殺菌剤又は

50

殺虫剤の作用に耐容する植物由来の種子を処理するためにも使用することができる。

例えば、本活性化合物は、スルホニル尿素系、イミダゾリノン系、グルホシネート・アンモニウム又はグリホセート・イソプロピルアンモニウム、及び類似の活性物質（例えば、欧州特許出願公開第242236号、欧州特許出願公開第242246号を参照されたい）（WO92/00377）（欧州特許出願公開第257993号及びU.S. 5,013,659）からなる群からの除草剤に耐性を示す植物由来の種子の処理、又は植物にある種の有害生物に対する耐性をもたらすバチルス・チューリンゲンシス毒素（Bt毒素）を産生する能力を有するトランスジェニック作物植物、例えば、ワタにおいて使用することができる（欧州特許出願公開第142924号、欧州特許出願公開第193259号）。

10

【0301】

さらに、本活性化合物は、既存の植物構成体（c o n s i s t）と比較して、改変特性を有する植物由来の種子の処理にも使用することができ、その特性は、例えば、従来の育種方法及び／若しくは変異体の発生によって、又は組換え手順によって生じ得る。例えば、植物中で合成されるデンプンを改変するための作物植物の組換え改変（例えば、WO92/11376、WO92/14827、WO91/19806）、又は改変された脂肪酸組成物を有するトランスジェニック作物植物（WO91/13972）の多くの例が記載されている。

活性化合物の種子処理施用は、植物の播種前及び植物の出芽前の種子にスプレー又は散粉することによって行われる。

20

種子処理にとりわけ有用な組成物は、例えば、以下である：

- A 液剤（SL、LS）
- D エマルジョン製剤（EW、EO、ES）
- E 懸濁製剤（SC、OD、FS）
- F 顆粒水和剤及び顆粒水溶剤（WG、SG）
- G 粉末水和剤及び粉末水溶剤（WP、SP、WS）
- H ゲル製剤（GF）
- I 粉剤（DP、DS）

【0302】

従来の種子処理用製剤には、例えば、フロアブル剤FS、液剤LS、乾燥処理用粉剤DS、スラリー処理用水和剤WS、粉末水溶剤SS、並びにエマルジョン製剤ES及びEC、並びにゲル製剤GFが含まれる。これらの製剤は、希釈されるか又は希釈されずに種子に施用することができる。種子への施用は、播種前に種子に、直接又は種子が予備発芽した後のいずれかで行われる。

30

好ましい実施形態では、FS製剤が種子処理に使用される。通常、FS製剤は1～800g/lの活性成分、1～200g/lの界面活性剤、0～200g/lの抗凍結剤、0～400g/lの結合剤、0～200g/lの顔料、及び最大で1リットルの溶媒、好ましくは水を含むことができる。

【0303】

とりわけ、種子処理用の本発明の化合物の好ましいFS製剤は、活性成分を0.1～80質量%（1～800g/l）、少なくとも1種の界面活性剤を0.1～20質量%（1～200g/l）、例えば、湿潤剤を0.05～5質量%及び分散剤を0.5～15質量%、抗凍結剤を最大20質量%、例えば5～20質量%、顔料及び／又は色素を0～15質量%、例えば、1～15質量%、結合剤（展着剤／粘着剤）を0～40質量%、例えば1～40質量%、通常含み、増粘剤を最大5質量%、例えば0.1～5質量%含んでもよく、消泡剤を0.1～2%含んでもよく、殺生物剤、酸化防止剤などの保存剤を例えば0.01～1質量%の量で含んでもよく、さらに充填剤／ビヒクルを最大100質量%含む。

40

【0304】

種子処理用製剤はまた、さらに結合剤を含んでもよく、着色剤を含んでもよい。

50

処理後の種子への活性物質の付着を改善するために、結合剤を添加することができる。適した結合剤は、エチレンオキシド又はプロピレンオキシドの様なアルキレンオキシド由来のホモポリマー及びコポリマー、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン及びそれらのコポリマー、エチレン-酢酸ビニルコポリマー、アクリル酸ホモポリマー及びコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド及びポリエチレンジイミン、セルロース、チロース及びデンプンの様な多糖、オレフィン/無水マレイン酸コポリマーの様なポリオレフィンホモポリマー及びコポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモポリマー及びコポリマーである。

【0305】

製剤にさらに着色剤も含まれてもよい。種子処理用製剤に適した着色剤又は色素は、ローダミンB、C、I、ピグメントレッド112、C、I、ソルベントレッド1、ピグメントブルー15:4、ピグメントブルー15:3、ピグメントブルー15:2、ピグメントブルー15:1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48:2、ピグメントレッド48:1、ピグメントレッド57:1、ピグメントレッド53:1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108である。

【0306】

ゲル化剤の例は、カラゲーン(carrageen)(Satiage1(登録商標))である。

種子の処理において、本発明の化合物の施用量は、一般に、種子100kgあたり0.01g~10kg、好ましくは種子100kgあたり0.05g~5kg、より好ましくは種子100kgあたり0.1g~1000g、特に種子100kgあたり0.1g~200gである。

したがって、本発明はまた、本明細書で定義した通り、本発明の化合物(農業的に有用なその塩を含む)を含む種子にも関する。本発明の化合物(農業的に有用なその塩を含む)の量は、一般に、種子100kgあたり0.01g~10kg、好ましくは種子100kgあたり0.05g~5kg、特に種子100kgあたり0.1g~1000gで変動することになる。レタスなどの特定の作物の場合、施用量はより多くすることができる。

【0307】

種子を処理するために使用することができる方法は、原則として、すべての適切な種子処理、とりわけ、種子コーティング(例えば、種子ペレット化)、種子散粉及び種子吸水(例えば、種子浸漬)などの当分野で公知の種子粉衣技法である。ここでは、「種子処理」とは、種子と本発明の化合物とを互いに接触させるすべての方法を指し、「種子粉衣」とは、本発明の化合物のある量を種子に供給する、すなわち、本発明の化合物を含む種子を生じさせる種子処理の方法を指す。原則として、この処理は、種子の収穫から種子の播種までのいかなる時でも種子に施用することができる。種子は、例えば「プランターボックス」法を用いて、種子の栽植直前、又は栽植中に処理することができる。しかし、この処理はまた、実質的な有効性の低下が観察されることなく、種子の栽植の数週間前又は数か月前、例えば最大12か月前に、例えば種子粉衣処理の形態で行うこともできる。

便宜的に、処理は未播種の種子に対して施用する。本明細書中で使用する場合、「未播種の種子」という用語は、種子の収穫から植物を発芽させて生長させるために種子を土に播種するまでの任意の時期の種子を含むことを意味する。

具体的には、手順は、適切なデバイス中、例えば固体又は固体/液体混合パートナーのための混合用デバイスで、種子を所望量の種子処理用製剤とそのまま又はあらかじめ水で希釈した後のどちらかで、この組成物が種子上に均一に分布されるまで混合するという処理に従う。適切な場合、その後に乾燥ステップが続く。

10

20

30

40

50

本発明の化合物は、その立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN - オキシドを含めて、特に、動物の体内及び体表の寄生生物を駆除するための使用にも適している。

【0308】

したがって、本発明の目的は、動物の体内及び体表の寄生生物を防除する新たな方法を提供することでもある。本発明の別の目的は、より安全な動物用の殺有害生物剤を提供することである。本発明の別の目的は、さらに、既存の殺有害生物剤よりも低用量で使用することができる動物用の殺有害生物剤を提供することである。また、本発明の別の目的は、寄生生物の防除が長く残る動物用の殺有害生物剤を提供することである。

本発明はまた、動物の体内及び体表の寄生生物を駆除するための、殺寄生生物有効量の本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩、又はN - オキシドを含む）、及び許容される担体を含む組成物にも関する。

本発明はまた、寄生生物による侵襲及び感染に対して動物を処置、防除、予防及び保護するための方法であって、殺寄生生物有効量の本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN - オキシドを含む）又はそれを含む組成物を、動物に経口、局所若しくは非経口投与するか又は施用するステップを含む、方法も提供する。

本発明はまた、無脊椎有害生物により侵襲若しくは感染を受けた動物を処置するか又は無脊椎有害生物による侵襲若しくは感染から動物を保護するための、本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩又はN - オキシドを含む）の使用も提供する。

本発明はまた、寄生生物による侵襲又は感染に対して動物を処置、防除、予防又は保護するための組成物を調製する方法であって、殺寄生生物有効量の本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩、又はN - オキシドを含む）又はそれを含む組成物を含む、方法も提供する。

【0309】

農業的の有害生物に対する化合物の活性は、例えば、経口施用の場合の低い非催吐投与量、動物との代謝適合性、低毒性及び取扱いの安全性を必要とする、動物の体内及び体表の内部寄生生物及び外部寄生生物の防除に関する、それらの適性を示唆するものではない。

驚くべきことに、式（I）の化合物、並びにその立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体及びN - オキシドは、動物の体内及び体表の内部寄生生物及び外部寄生生物の駆除に適していることが、今や見いだされた。

【0310】

本発明の化合物、とりわけ式（I）の化合物、並びにその立体異性体、獣医学的に許容される塩、互変異性体及びN - オキシド、並びにそれらを含む組成物は、温血動物（ヒトを含む）及び魚類を含む動物における侵襲及び感染の防除及び予防に使用するのが好ましい。それらは、例えば、ウシ、ヒツジ、イノシシ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、トリ、ウサギ、ヤギ、イヌ及びネコ、水牛、ロバ、ダマジカ、並びにトナカイなどの哺乳動物において、さらにまた、ミンク、チンチラ及びアライグマなどの毛皮動物において、メンドリ、ガチョウ、シチメンチョウ及びアヒルなどの鳥類、並びにマス、コイ及びウナギなどの淡水魚及び海水魚などの魚類において、侵襲及び感染を防除並びに予防するのに適している。

本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩、又はN - オキシドを含む）及びそれらを含む組成物は、イヌ又はネコなどの家庭用動物における侵襲及び感染を防除並びに予防するために使用するのが好ましい。

【0311】

温血動物及び魚類における侵襲には、以下に限定されないが、シラミ、ハジラミ、マダニ、ハナウマバエ、ヒツジシラミバエ、刺咬性ハエ、キンバエ、ハエ、ハエウジ、ツツガムシ、ブヨ、カ及びノミが含まれる。

本発明の化合物（その立体異性体、獣医学的に許容される塩、又はN - オキシドを含む）及びそれらを含む組成物は、外部寄生生物及び／又は内部寄生生物の浸透性及び／又は非浸透性防除に適している。それらは、発育段階のすべて又は一部に対して活性である。

本発明の化合物は、それぞれ以下の目及び種の寄生生物の駆除にとりわけ有用である：

【0312】

ノミ（ノミ目（*Siphonaptera*））、例えば、ネコノミ（*Ctenocephalides felis*）、イヌノミ（*Ctenocephalides canis*）、ケオプスネズミノミ（*Xenopsylla cheopis*）、ヒトノミ（*Pulex irritans*）、スナノミ（*Tunga penetrans*）、及びヨーロッパネズミノミ（*Nosopsyllus fasciatus*）、

【0313】

ゴキブリ（ゴキブリ目（*Blattaria*） - ゴキブリ亜目（*Blattodea*））、例えば、ブラテラ・ゲルマニカ（*Blattella germanica*）、ブラテラ・アサヒナイ（*Blattella asahinae*）、ワモンゴキブリ（*Periplaneta americana*）、ヤマトゴキブリ（*Periplaneta japonica*）、トビイロゴキブリ（*Periplaneta brunnea*）、クロゴキブリ（*Periplaneta fuliginosa*）、コワモンゴキブリ（*Periplaneta australasiae*）、及びトウヨウゴキブリ（*Blattella orientalis*）、

【0314】

ハエ、蚊（双翅目）、例えば、ネッタイシマカ（*Aedes aegypti*）、ヒトスジシマカ（*Aedes albopictus*）、キンイロヤブカ（*Aedes vexans*）、メキシコミバエ（*Anastrepha ludens*）、アノフェレス・マキュリペンニス（*Anopheles maculipennis*）、アノフェレス・クルキアンス（*Anopheles crucians*）、アノフェレス・アルビマナス（*Anopheles albimanus*）、アノフェレス・ガムビエ（*Anopheles gambiae*）、アノフェレス・フレエボルニ（*Anopheles freeborni*）、アノフェレス・ロイコスフィラス（*Anopheles leucosphyrus*）、アノフェレス・ミニマス（*Anopheles minimus*）、アノフェレス・クアドリマクラタス（*Anopheles quadrimaculatus*）、カリフォラ・ビシナ（*Calliphora vicina*）、クリソミア・ベジアナ（*Chrysomya bezziana*）、クリソミア・ホミニボラキス（*Chrysomya hominivorax*）、クリソミア・マセラリア（*Chrysomya macellaria*）、クリソプス・ディスカリス（*Chrysops discalis*）、クリソプス・シラセア（*Chrysops silacea*）、クリソプス・アトランチクス（*Chrysops atlanticus*）、コクリオミヤ・ホミニボラキス（*Cochliomyia hominivorax*）、コルディオロピア・アンソロポファガ（*Cordylobia anthropophaga*）、クリコイデス・フレンス（*Culicoides furens*）、クレクス・ピピエンス（*Culex pipiens*）、クレクス・ニグリパルプス（*Culex nigripalpus*）、クレクス・クウィンクウェファスキアトウス（*Culex quinquefasciatus*）、クレクス・タルサリス（*Culex tarsalis*）、クリセタ・イノルナタ（*Culiseta inornata*）、クリセタ・メラヌラ（*Culiseta melanura*）、ヒトヒフバエ（*Dermatobia hominis*）、ファニア・カニクラリス（*Fannia canicularis*）、ガステロフィルス・インテスチナリス（*Gasterophilus intestinalis*）、グロッシナ・モラシタンス（*Glossina morsitans*）、グロッシナ・パルパリス（*Glossina palpalis*）、グロッシナ・フスシペス（*Glossina fuscipes*）、グロッシナ・タキノイデス（*Glossina tachinoides*）、ノサシバエ（*Haematobia irritans*）、ハプロジプロシス・エクエストリス（*Haplodiplosis equestris*）、ヒッペラテス属の種（*Hippelates* spp.）、キスジウシバエ（*Hypoderma lineata*）、レプトコノプス・トレンス（*Leptoconops tor*

10

20

30

40

50

rens)、ルシリア・カブリナ(Lucilia caprina)、ヒツジキンバエ(Lucilia cuprina)、ルシリア・セリカータ(Lucilia sericata)、リコリア・ペクトラリス(Lycoria pectoralis)、マンソニア属の種(Mansonias spp.)、イエバエ(Musca domestica)、オオイエバエ(Muscina stabulans)、ヒツジバエ(Oestrus ovis)、フレボトムス・アルゲンチペス(Phlebotomus argentipes)、プソロフォラ・コルumbiエ(Psorophora columbiae)、プソロフォラ・ディスカラ(Psorophora discolor)、プロシムリウム・ミクスタム(Prosimulium mixtum)、サルコファガ・ヘモロイダリス(Sarcophaga haemorrhoidalis)、サルコファガ種(Sarcophaga sp.)、シムリウム・ウィッタツム(Simulium vittatum)、サシバエ(Stomoxys calcitrans)、タバヌス・ボビヌス(Tabanus bovinus)、タバヌス・アトラタス(Tabanus atratus)、タバヌス・リネオラ(Tabanus lineola)及びタバナス・シミリス(Tabanus similis)、

10

【0315】

シラミ(シラミ目(Phthiraptera))、例えば、アタマジラミ(Pediculus humanus capitis)、コロモジラミ(Pediculus humanus corporis)、ケジラミ(Phthirus pubis)、ウシジラミ(Haematopinus eurysternus)、ブタジラミ(Haematopinus suis)、ウシホソジラミ(Linognathus vituli)、ウシハジラミ(Bovicola bovis)、ニワトリハジラミ(Menopon gallinae)、ニワトリオオハジラミ(Menacanthus stramineus)及びケブカウシジラミ(Solenopotes capillatus)。

20

【0316】

ダニ及び寄生性ダニ(ダニ目(Parasitiformes)): マダニ(マダニ科(Ixodidae))、例えば、イクソデス・スカプラリス(Ixodes scapularis)、イクソデス・ホロチクルス(Ixodes holocyclus)、イクソデス・パシフィカス(Ixodes pacificus)、クリイロコイタマダニ(Rhiphicephalus sanguineus)、デルマセントル・アンデルソニ(Dermacentor andersoni)、デルマセントル・ヴァリアビリス(Dermacentor variabilis)、アムブリオマ・アメリカナム(Amblyomma americanum)、アムブリオマ・マクラツム(Amblyomma maculatum)、オルニトドルス・ヘルムシ(Ornithodoros hermsi)、オルニトドルス・ツリカタ(Ornithodoros turicata)、及び寄生性ダニ(トゲダニ亜目(Mesostigmata))、例えば、イエダニ(Ornithonyssus bacoti)及びワクモ(Dermanyssus gallinae)、

30

【0317】

ケダニ亜目(Actinedida)(前気門亜目(Prostigmata))及びコナダニ下目(Acaridida)(コナダニ亜目(Astigmata))、例えば、アカラピス属の種(Acarapis spp.)、ツメダニ属の種(Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア属の種(Ornithocheyletiella spp.)、ミオビア属の種(Myobia spp.)、プソレルガテス属の種(Psorergates spp.)、ニキビダニ属の種(Demodex spp.)、ツツガムシ属の種(Trombicula spp.)、リストロホルス属の種(Liostrophorus spp.)、アカルス属の種(Acarus spp.)、ケナガコナダニ属の種(Tyrophagus spp.)、ゴミコナダニ属の種(Caloglyphus spp.)、ヒボデクテ属の種(Hypodectes spp.)、

40

50

プテロリクス属の種 (*Pterolichus* spp.)、ブソロブテス属の種 (*Psoroptes* spp.)、ショクヒヒゼンダニ属の種 (*Chorioptes* spp.)、ミミヒゼンダニ属の種 (*Otodectes* spp.)、サルコブテス属の種 (*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属の種 (*Notoedres* spp.)、クネミドコブテス属の種 (*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属の種 (*Cytodites* spp.)、及びラミノシオブテス属の種 (*Lamino sioptes* spp.)、

【0318】

半翅類 (bug) (異翅目 (*Heteropterida*)): トコジラミ (*Cimex lectularius*)、ネツタイトコジラミ (*Cimex hemipterus*)、レデュビウス・セニリス (*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種 (*Triatoma* spp.)、ロドニウス属の種 (*Rhodnius* spp.)、パンストロギルス属の種 (*Panstrongylus* spp.)、及びアリルス・クリスタツス (*Arilus cristatus*)、

10

【0319】

シラミ目 (*Anoplurida*)、例えば、ブタジラミ属の種 (*Haematopinus* spp.)、ケモノホソジラミ属の種 (*Linognathus* spp.)、シラミ属の種 (*Pediculus* spp.)、プチルス属の種 (*Phthirus* spp.)、及びソレノポテス属の種 (*Solenopotes* spp.)、

20

【0320】

ハジラミ目 (*Mallophagida*) (マルツノハジラミ亜目 (*Arnblycerina*) 及びホソツノハジラミ亜目 (*Ischnocerina*))、例えば、トリメノポン属の種 (*Trimenopon* spp.)、メノポン属の種 (*Menopon* spp.)、トリノトン属の種 (*Trinoton* spp.)、ボビコラ属の種 (*Bovicola* spp.)、ウェルネキエラ属の種 (*Werneckiella* spp.)、レピケントロン属の種 (*Lepikentron* spp.)、ケモノハジラミ属の種 (*Trichodectes* spp.)、及びフェリコラ属の種 (*Felicola* spp.)、

回虫線形動物 (Roundworms Nematoda):

【0321】

ワイプワーム (*Wipeworm*) 及び旋毛虫 (*Trichinosis*) (毛管目 (*Trichosyringida*))、例えば、毛形虫科 (*Trichinellidae*) (旋毛虫属の種 (*Trichinella* spp.))、(鞭虫科 (*Trichuridae*))、トリクリス属の種 (*Trichuris* spp.)、カピラリア属の種 (*Capillaria* spp.)、

30

桿線虫目 (*Rhabditida*)、例えば、ラブディチス属の種 (*Rhabditis* spp.)、糞線虫属の種 (*Strongyloides* spp.)、ヘリセファロプス属の種 (*Helicephalobus* spp.)、

円虫目 (*Strongylida*)、例えば、ストロンギルス属の種 (*Strongylus* spp.)、アンシロストーマ属の種 (*Ancylostoma* spp.)、アメリカ鉤虫 (*Necator americanus*)、ブノストムム属の種 (*Bunostomum* spp.) (鉤虫)、トリコストロンギルス属の種 (*Trichostrongylus* spp.)、ヘモンクス・コントルタス (*Haemonchus contortus*)、オステルターグ属の種 (*Ostertagia* spp.)、クーペリア属の種 (*Cooperia* spp.)、ネマトジルス属の種 (*Nematodirus* spp.)、ジクチオカウルス属の種 (*Dictyocaulus* spp.)、シアトストマ属の種 (*Cyathostoma* spp.)、エソファゴストム属の種 (*Oesophagostomum* spp.)、ブタ腎虫 (*Stephanurus dentatus*)、オルラヌス属の種 (*Ollulanus* spp.)、カベルチア属の種 (*Chabertia* spp.)、ブタ腎虫、開嘴虫 (*Syngamus tra*

40

50

chea)、アンシロストーマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属の種(*Uncinaria* spp.)、グロボセファルス属の種(*Globoccephalus* spp.)、ネカトル属の種(*Necator* spp.)、メタストロンギルス属の種(*Metastrongylus* spp.)、毛細肺虫(*Muelleries capillaris*)、プロトストロンギルス属の種(*Protostrongylus* spp.)、アンギオストロンギルス属の種(*Angiostrongylus* spp.)、パレラフォストロンギルス属の種(*Parelaphostrongylus* spp.)、ネコ肺虫(*Aleurostrongylus abstrusus*)、及び腎虫(*Dioctophyma renale*)、

【0322】

10

腸管寄生回虫(回虫目(*Ascaridida*))、例えば、ヒト回虫(*Ascaris lumbricoides*)、ブタ回虫(*Ascaris suum*)、ニワトリ回虫(*Ascaridia galli*)、ウマ回虫(*Parascaris equorum*)、蟯虫(*Enterobius vermicularis*) (蟯虫)、イヌ回虫(*Toxocara canis*)、ライオン回虫(*Toxascaris leonine*)、スクルジャビネマ属の種(*Skrjabinema* spp.)、及びウマ蟯虫(*oxyuris equi*)、

【0323】

20

カマラヌス目(*Camallanida*)、例えば、メジナ虫(*Dracunculus medinensis*) (ギニア虫)

旋尾線虫目(*Spirurida*)、例えば、テラジア属の種(*Thelazia* spp.)、ウケレリア属の種(*Wuchereria* spp.)、ブルギア属の種(*Brugia* spp.)、オンコセルカ属の種(*Onchocerca* spp.)、ディロフィラリア属の種(*Dirofilaria* spp.)、ディペタロネーマ属の種(*Dipetalonema* spp.)、セタリア属の種(*Setaria* spp.)、エレオフォラ属の種(*Elaeophora* spp.)、血色食道虫(*Spirocerca lupi*)、及びハプロネーマ属の種(*Habronema* spp.)、

【0324】

30

鉤頭虫(鉤頭動物門(*Acanthocephala*))、例えば、アカントケファルス属の種(*Acanthocephalus* spp.)、大鉤頭虫(*Macracanthorhynchus hirudinaceus*) 及びオンキコラ属の種(*Oncicola* spp.)、

【0325】

プラナリア(扁形動物門(*Plathelminthes*)):

吸虫(吸虫綱(*Trematoda*))、例えば、肝蛭属の種(*Fasciola* spp.)、ファスシオロイデス・マグナ(*Fascioloides magna*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、ディクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium* spp.)、肥大吸虫(*Fasciolopsis buski*)、肝吸虫(*Clonorchis sinensis*)、住血吸虫属の種(*Schistosoma* spp.)、トリコビルハルジア属の種(*Trichobilharzia* spp.)、吸虫(*Alaria alata*)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、及びナノサイエテス属の種(*Nanocyetes* spp.)、

40

セルコメロモルファ(*Cercomeromorpha*)、特に条虫綱(*Cestoda*) (条虫)、例えば、広節裂頭条虫属の種(*Diphyllobothrium* spp.)、テニア属の種(*Tenia* spp.)、エキノコックス属の種(*Echinococcus* spp.)、イヌ条虫(*Dipylidium caninum*)、ムルチセプス属の種(*Multiceps* spp.)、膜様条虫属の種(*Hymenolepis* spp.)、有線条虫属の種(*Mesocestoides* spp.)、バムピロレピス属の種(*Vampirolepis* spp.)、モニエジア属の種(*Moni*

50

e z i a s p p .)、裸頭条虫属の種 (A n o p l o c e p h a l a s p p .)、シロメトラ属の種 (S i r o m e t r a s p p .)、裸頭条虫属の種、及び膜様条虫属の種。

【 0 3 2 6 】

本発明は、動物の体内及び / 又は体表の寄生生物を防除する及び / 又は駆除するための本発明の化合物及びそれを含む組成物の治療的使用及び非治療的使用に関する。本発明の化合物及びそれを含む組成物は、動物を殺寄生生物有効量の本発明の化合物及びそれを含有する組成物に接触させることにより、寄生生物による攻撃又は侵襲から該動物を保護するために使用することができる。

本発明の化合物及びそれを含む組成物は、接触（土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、毛布又は動物の一部を介する）と摂取（例えば餌）の両方により有効となり得る。したがって、「接触」は、直接接触（本発明の化合物を含有している殺有害生物混合物 / 組成物を寄生生物に直接施用することであり、その発生場所 P における間接接触を含むことができ、保護すべき動物の体表に直接、殺有害生物混合物 / 組成物を投与することも含んでもよい）と、間接接触（寄生生物の発生場所に本化合物 / 組成物を施用する）の両方を含む。寄生生物の発生場所への施用による該寄生生物の接触は、本発明の化合物の非治療的使用の一例である。上で使用される「発生場所 P」とは、生息地、餌供給源、繁殖地、区域、資材、又は動物の体外で寄生生物が成長中の又は成長する可能性がある環境を意味する。

【 0 3 2 7 】

一般に、「殺寄生生物有効量」とは、標的生物の壊死、死滅、成長遅延、予防及び除去、破壊、その他にはその発生及び活動の低減という効果を含めた、成長に対する観察可能な効果を達成するために必要な活性成分の量を意味する。殺寄生生物有効量は、本発明の様々な化合物 / 組成物について変わり得る。本組成物の殺寄生生物有効量は、所望の殺寄生生物効果及び持続時間、標的種、施用様式などの一般条件に応じて変動することにもなる。

本発明の化合物はまた、有害生物又は寄生生物の発生が予期される場所に予防的に施用することもできる。

投与は、予防的と治療的のどちらでも実施することができる。

本活性化合物の投与は、直接又は適切な調製物の形態で、経口的、局所的 / 経皮的に、又は非経口的に行われる。

本発明のイソチアゾリン化合物は、土壌中の残留性が高く、こうしてそこに蓄積する従来技術の化合物、とりわけ従来技術のイソオキサゾリン殺虫剤よりも残留性、生体内蓄積性及び / 又は毒性が低い。

【 実施例 】

【 0 3 2 8 】

これから、以下の例により、本発明に何らかの限定を設けることなく、本発明をさらに詳細に例示する。

調製例

化合物は、例えば、連結した高速液体クロマトグラフィー / 質量分析法 (H P L C / M S) により、¹H - N M R により、及び / 又はそれらの融点により特徴付けることができる。

分析用 H P L C カラム :

方法 : 分析用 U P L C カラム : P h e n o m e n e x K i n e t e x 1 , 7 μ m X B - C 1 8 1 0 0 A 、 5 0 × 2 . 1 m m 、 P h e n o m e n e x 製、ドイツ。溶出 : 6 0 、 1 . 5 分間で、アセトニトリル + 0 . 1 % トリフルオロ酢酸 (T F A) / 水 + 0 . 1 % トリフルオロ酢酸 (T F A) を 5 : 9 5 ~ 1 0 0 : 0 の比。流速 : 1 . 5 分間で 0 . 8 m L / 分 ~ 1 m L / 分。M S 法 : E S I ポジティブ。

【 0 3 2 9 】

¹H - N M R : シグナルは、テトラメチルシラン (¹³C - N M R の場合、それぞれ C D

10

20

30

40

50

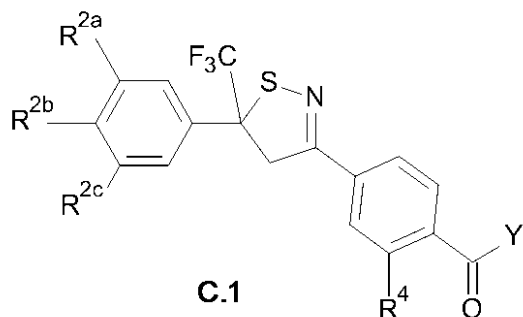
C 1₃) に対する化学シフト (ppm、 [デルタ]) により、それらの多重度により及びそれらの積分値 (所与の水素原子の相対数) により特徴付けた。シグナルの多重度を特徴付けるために、以下の略語を使用する。m = マルチプレット、q = カルテット、t = トリプレット、d = ダブルレット、及び s = シングレット。

【 0 3 3 0 】

C . 1 化合物例

化合物例 1 - 1 ~ 1 - 4 2 は、式 C . 1 の化合物に対応する。

【 化 3 2 】



10

(式中、各合成化合物の R^{2a}、R^{2b}、R^{2c}、R⁴及びYは、以下の表C . 1の1つの行に定義されている)


【 0 3 3 1 】

20

これらの化合物は、合成例 S . 1 と同様に合成した。

【表 2】

表C.1

例	R ^{2a} , R ^{2b} , R ^{2c}	R ⁴	Y	HPLC-MS: R _t (分) & [M+H] ⁺	
1-1	Cl, Cl, Cl	H	アゼチジン-1-イル	1.431	495.1
1-2	Cl, Cl, Cl	H	ピロリジン-1-イル	1.461	507.1
1-3	Cl, F, Cl	Cl	3,3-ジフルオロ-ピロリジン-1-イル	1.447	562.9
1-4	Cl, F, Cl	Cl	3,3,4,4-テトラフルオロ-ピロリジン-1-イル	1.498	597.0
1-5	Cl, F, Cl	Cl	4,4-ジフルオロ-ピペリジン-1-イル	1.485	575.1
1-6	Cl, F, Cl	Cl	3,3-ジフルオロ-アゼチジン-1-イル	1.451	549.1
1-7	Cl, F, Cl	Cl	4-シアノ-1-ピペリジル	1.408	566.1
1-8	Cl, F, Cl	Cl	3-アセトアミドピロリジン-1-イル	1.33	584.4
1-9	Cl, F, Cl	Cl	2-メトキシカルボニルアジリジン-1-イル	1.517	557.3
1-10	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]-ピロリジン-1-イル	1.455	638.4
1-11	Cl, F, Cl	Cl	4-アセチルピペラジン-1-イル	1.366	584.5
1-12	Cl, F, Cl	Cl	3-シアノピロリジン-1-イル	1.424	550.6
1-13	Cl, F, Cl	Cl	2-(メチルカルバモイル)-ピロリジン-1-イル	1.362	583.6
1-14	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-トリフルオロエチルカルバモイル)-ピロリジン-1-イル	1.447	651.6
1-15	Cl, F, Cl	Cl	2,2,6,6-テトラフルオロモルホリン-4-イル	1.54	612.7
1-16	Cl, F, Cl	Cl	3-シアノアゼチジン-1-イル	1.418	538.4
1-17	Cl, F, Cl	Cl	2-メトキシカルボニルアゼチジン-1-イル	1.451	571.4
1-18	Cl, F, Cl	Cl	3-メチル-4-オキソ-イミダゾリジン-1-イル	1.351	555.6
1-19	Cl, F, Cl	Cl	3-シアノ-1-ピペリジル	1.447	563.8
1-20	Cl, F, Cl	Cl	3-(メチルカルバモイル)-ピロリジン-1-イル	1.33	584.4
1-21	Cl, F, Cl	Cl	3-(メチルカルバモイル)-1-ピペリジル	1.377	598.5
1-22	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-トリフルオロエチルカルバモイル)-アゼチジン-1-イル	1.434	636.7
1-23	Cl, F, Cl	Cl		1.35	602.6
1-24	Cl, F, Cl	Cl	4-(メチルカルバモイル)-1-ピペリジル	1.341	596.7
1-25	Cl, F, Cl	Cl	2-(メチルカルバモイル)-1-アゼチジニル	1.330	569.6
1-26	Cl, F, Cl	Cl	3-(エチルカルバモイルアミノ)-1-ピロリジニル	1.326	612.6

10

20

30

40

1-27	Cl, F, Cl	Cl	3-(3,3,3-トリフルオロプロパノイルアミノ)-1-ピロリジニル	1.393	651.5
1-28	Cl, F, Cl	Cl	3-(プロパノイルアミノ)-1-ピロリジニル	1.349	598.7
1-29	Cl, F, Cl	Cl	3-(メトキシカルボニルアミノ)-1-ピロリジニル	1.374	600.7
1-30	Cl, F, Cl	Cl	3-アセトアミドアゼチジン-1-イル	1.298	567.7
1-31	Cl, F, Cl	Cl	3-(メチルカルバモイルアミノ)ピロリジン-1-イル	1.311	599.7
1-32	Cl, F, Cl	Cl	3-(2,2,2-トリフルオロエチルカルバモイル)ピロリジン-1-イル	1.377	651.5
1-33	Cl, F, Cl	Cl	2-オキソ-3-(2,2,2-トリフルオロエチル)イミダゾリジン-1-イル	1.514	623.6
1-34	Cl, F, Cl	Cl	アジリジン-1-イル	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): δ 7.9-7.8 (m, 2H), 7.8-7.6 (m, 1H), 7.35-7.25 (m, 2H), 4.6-4.4 (m, 2H), 4.3-4.1 (m, 3H), 3.9 (d, 1H)	
1-35	Cl, F, Cl	Cl	アゼチジン-1-イル	1.480	513.1
1-36	Cl, F, Cl	Cl	2-シアノピロリジン-1-イル	1.478	552.1
1-37	Cl, F, Cl	Cl	2-(2,2,2-トリフルオロエチルカルバモイル)アジリジン-1-イル	1.507	624.0
1-38	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2,2,2-トリフルオロアセチル)アミノ]アゼチジン-1-イル	1.417	621.8
1-39	Cl, F, Cl	Cl	3-(シクロブタンカルボニルアミノ)アゼチジン-1-イル	1.395	609.8
1-40	Cl, F, Cl	Cl	3-[(2-メトキシアセチル)アミノ]アゼチジン-1-イル	1.329	599.8
1-41	Cl, F, Cl	Cl	3-(プロパノイルアミノ)アゼチジン-1-イル	1.364	584.0
1-42	Cl, F, Cl	Cl	3-(シクロプロパンカルボニルアミノ)アゼチジン-1-イル	1.357	594.8

10

20

30

40

50

【 0 3 3 2 】

合成例 S . 1

【 0 3 3 3 】

[2 - クロロ - 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソチアゾール - 3 - イル] フェニル] - (4 , 4 - ジフルオロ - 1 - ピペリジル) メタノン

(化合物例 1 - 5 ; R^{2a}及びR^{2c}がC 1であり、R^{2b}がFであり、R⁴がC 1であり、R⁵及びR⁶が、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、4 , 4 - ジフルオロ - 1 - ピペリジルとなる、式 I A の化合物)

ステップ 1 : 1 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - エタノン

1 , 3 - ジクロロ - 2 - フルオロ - 5 - ヨード - ベンゼン (C A S 1 3 3 3 0 7 - 0 8 - 1 , 5 0 g) 及び 2 , 2 , 2 - トリフルオロ - N - メトキシ - N - メチル - アセトアミ

ド (40 . 5 g) の T H F (800 m L) 溶液に、 - 78 で n - B u L i (82 . 5 m L 、ヘキサン中 2 . 5 M) を加えた。この反応物を 20 分間、撹拌し、次に飽和 N H ₄ C l 水溶液によりクエンチし、酢酸エチルにより抽出した。有機層を乾燥 (N a ₂ S O ₄) してろ過し、濃縮した。残さをシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーにより精製すると、生成物 (24 g 、 53 %) が得られた。

¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃): 8.0 (m, 2H).

【 0 3 3 4 】

ステップ 2 : t e r t - ブチル 4 - アセチル - 2 - クロロ - ベンゾエート

t e r t - ブチル 4 - プロモ - 2 - クロロ - ベンゾエート (C A S 929000 - 18 - 0、85 g) のキシレン (600 m L) 溶液に、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム (0) (「 P d ₂ (d b a) ₃」、4.3 g)、1, 1' - ビナフタレン - 2, 2' - ジイル) ビス (ジフェニルホスフィン) (「 B I N A P」、3.7 g) 及びトリブチル (1 - エトキシビニル) スズ (126 . 6 g) を加えた。この混合物を N₂ 下、150 で一晩、撹拌し、次に、この混合物を濃縮し、残さを T H F 及び 2 M H C l 水溶液に溶解し、室温で 2 時間、撹拌した。この混合物を酢酸エチルにより抽出し、有機層を濃縮すると残さが得られ、これをシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーにより精製すると、生成物 (60 g 、 81 %) が得られた。

¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃): 7.9 (s, 1H), 7.8 (d, 1H), 7.7 (d, 1H), 2.6 (s, 3H), 1.6 (s, 9H).

【 0 3 3 5 】

ステップ 3 : t e r t - ブチル 2 - クロロ - 4 - [3 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 3 - ヒドロキシ - ブタノイル] ベンゾエート

ステップ 1 の生成物 (30 g) 及びステップ 2 の生成物 (23 . 4 g) のトリエチルアミン (10 m L) とヘプタン (300 m L) との混合溶液を 70 で一晩、撹拌した。次に、この混合物を濃縮した。残さをシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーにより精製すると、生成物 (37 . 5 g 、 63 %) が得られた。

¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃): 7.9 (s, 1H), 7.8 (m, 2H), 7.5 (m, 2H), 5.5 (s, 1H), 3.7 (d, 1H), 3.6 (d, 1H), 1.6 (s, 9H).

【 0 3 3 6 】

ステップ 4 : t e r t - ブチル 2 - クロロ - 4 - [3 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - ブタ - 2 - エノイル] ベンゾエート

ピリジン (27 g) 及びトルエン (400 m L) 中のステップ 4 の生成物 (50 g) に、 60 で塩化チオニル (45 g) を加えた。次に、この混合物を 80 で 5 時間、加熱し、濃縮した。残さをシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィーにより精製すると、生成物 (42 g 、 87 %) が E / Z 異性体の混合物として得られた。

¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃): 7.9- 6.8 (m, 6H), 1.6 (s, 9H).

【 0 3 3 7 】

ステップ 5 : t e r t - ブチル 2 - クロロ - 4 - [3 - (3, 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 4, 4, 4 - トリフルオロ - 3 - スルファニル - ブタノイル] ベンゾエート

C H ₂ C l ₂ (500 m L) 中のステップ 4 の生成物 (56 g 、 E / Z 異性体の混合物) をトリエチルアミン (114 g) により処理した。この溶液が飽和されるまで 0 で、硫化水素 (H ₂ S) ガスを上記の溶液にバブリングした。この混合物を 0 でさらに 1 時間、撹拌し、次に C H ₂ C l ₂ (200 m L) により希釈した。有機層を 10 % 塩酸水溶液 (3 x) により洗浄し、乾燥 (N a ₂ S O ₄) してろ過し、濃縮すると粗生成物 (59 . 9 g 、定量的) が得られ、これをさらなる精製を何ら行うことなく、次のステップに使用した。

¹H NMR (400 MHz, C D C l ₃): 7.9 (s, 1H), 7.8 (m, 2H), 7.6 (d, 2H), 4.2 (d, 1H), 3.9 (d, 1H), 3.2 (s, 1H (SH)), 1.6 (s, 9H).

【 0 3 3 8 】

ステップ 6 : t e r t - ブチル 2 - クロロ - 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソチアゾール - 3 - イル] ベンゾエート

- 1 5 において、 CH_2Cl_2 (6 0 0 m L) 中のステップ 5 の生成物 (5 9 . 9 g) を、トリエチルアミン (4 5 . 6 g)、及びヒドロキシルアミン - O - スルホン酸 (「 H O S A 」、1 5 . 3 g) の水溶液 (2 0 m L) で処理した。この反応物を 0 に温め、0 で 1 時間攪拌し、次に CH_2Cl_2 (3 0 0 m L) で希釈した。有機層を飽和 NH_4Cl 水溶液 (3 x) で洗浄し、乾燥 (Na_2SO_4) してろ過した。得られた溶液にパラ - トルエンスルホン酸 (「 p - T s O H 」、0 . 5 g) を加え、この混合物を室温で 2 時間、攪拌した。次に、この反応物を 5 % K_2CO_3 水溶液 (3 x) により洗浄して乾燥 (Na_2SO_4) し、濃縮した。得られた残さを粉末化 (ヘキサン / CH_2Cl_2) により精製すると、白色固体 (3 4 . 4 g、5 8 %) が得られた。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.8 (m, 2H), 7.7 (m, 1H), 7.4 (m, 2H), 4.2 (d, 1H), 3.9 (d, 1H), 1.6 (s, 9H).

【 0 3 3 9 】

ステップ 7 : 2 - クロロ - 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソチアゾール - 3 - イル] 安息香酸

0 で、 CH_2Cl_2 (1 2 0 m L) 中のステップ 6 の生成物 (1 6 . 2 g) をトリフルオロ酢酸 (「 T F A 」、6 0 m L) により処理し、この混合物を室温で一晩、攪拌した。この反応物を濃縮し、 CH_2Cl_2 により共蒸発 (5 x) させると、淡黄色固体が得られた。この残さを粉末化 (石油エーテル / 酢酸エチル) により精製すると、生成物 (1 4 . 1 g、9 7 %) が得られた。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8.1 (d, 1H), 7.8 (s, 1H), 7.7 (d, 1H), 7.4 (m, 2H), 4.2 (d, 1H), 3.9 (d, 1H).

【 0 3 4 0 】

ステップ 8 : [2 - クロロ - 4 - [5 - (3 , 5 - ジクロロ - 4 - フルオロ - フェニル) - 5 - (トリフルオロメチル) - 4 H - イソチアゾール - 3 - イル] フェニル] - (4 , 4 - ジフルオロ - 1 - ピペリジル) メタノン

ステップ 7 の生成物 (0 . 4 g) の CH_2Cl_2 / トルエン (1 : 1、2 0 m L) 溶液に、室温で N , N - ジメチルホルムアミド (d i m e t h y l f o r m a m i d) (「 D M F 」、1 滴) 及び塩化オキサリル (0 . 2 1 g) を加えた。この反応物を室温で一晩、攪拌し、濃縮した。残さを CH_2Cl_2 により共蒸発 (5 x) させ、さらなる精製を何ら行うことなく次のステップに使用した (0 . 4 1 g、 「 酸塩化物 」)。

【 0 3 4 1 】

4 , 4 - ジフルオロピペリジン塩酸塩 (8 0 m g) の T H F (1 0 m L) 溶液に、0 で 「 酸塩化物 」 (0 . 2 g) の T H F (1 0 m L) 溶液を加えた。得られた溶液を室温で 6 6 時間、攪拌し、次にろ過して濃縮した。残さをシリカゲル上のフラッシュクロマトグラフィー (酢酸エチル / シクロヘキサン) により精製すると、生成物 (0 . 1 2 g、5 1 %) が得られた。

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.9-7.6 (m, 2H), 7.4 (m, 3H), 4.2 (d, 1H), 3.8 (m, 2H), 3.4 (m, 1H), 3.3 (m, 1H), 2.2-2.0 (m, 3H), 2.0-1.8 (m, 1H).

【 0 3 4 2 】

I I . 殺有害生物活性の評価 :

本発明の式 I の化合物の活性は、以下の生物試験により実証して評価することができる。

B . 1 コナガ (プルテラ・キシロステラ (P l u t e l l a x y l o s t e l l a))

ハクサイの葉を試験溶液に浸して空気乾燥した。湿潤ろ紙を敷いたペトリ皿に、処理した葉を置いた。致死率を処理の 2 4、7 2 及び 1 2 0 時間後に記録した。

この試験において、500 ppmにおいて化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、及び1-34はそれぞれ、未処理対照と比べて少なくとも75%の致死率を示した。

B.2 モモアカアブラムシ (ミズス・ペルシカエ (*Myzus persicae*))

浸透的手段によるモモアカアブラムシ (ミズス・ペルシカエ) の防除を評価するため、人工膜下で人工液状餌食を含有している96ウェル・マイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75% v/v及びDMSO 25% v/vを含有している溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物を、注文製のピペッターを使用して2連でアブラムシ用餌食にピペット注入した。

【0343】

施用後、5~8匹の成体アブラムシをマイクロタイタープレートウェル内部の人工膜上に置いた。次に、処理済みアブラムシ用餌食をアブラムシに吸汁させて、約 23 ± 1 及び相対湿度約 $50 \pm 5\%$ で3日間インキュベートした。その後、アブラムシの致死率及び繁殖性を目視で評価した。

この試験では、2500 ppmにおいて、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、及び1-37はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0344】

B.3 チチュウカイミバエ (ケラティティス・カピタタ (*Ceratitis capitata*))

チチュウカイミバエ (ケラティティス・カピタタ) の防除を評価するため、昆虫用餌食及び50~80個のC.カピタタの卵を含有するマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75% v/v及びDMSO 25% v/vを含有している溶液を使用して配合した。注文製のマイクロ噴霧器を使用して、様々な濃度の配合化合物5 μ を2連で昆虫用餌食にスプレーした。

施用後、マイクロタイタープレートを約 28 ± 1 及び相対湿度約 $80 \pm 5\%$ で5日間インキュベートした。その後、卵及び幼虫の致死率を目視で評価した。

この試験では、2500 ppmにおいて、化合物1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-12、1-13、1-16、1-18、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-32、1-34、1-35、及び1-36はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0345】

B.4 ランアザミウマ (ジクロモトリプス・コルベッティ (*dichromothrips corsicobettii*))

バイオアッセイに使用する成体ジクロモトリプス・コルベッティを実験室条件下で連続的に維持したコロニーから得た。試験目的のため、試験化合物をアセトン：水の1：1 (体積：体積) の混合物及び0.01% (体積/体積) のKinetic (登録商標) 界面活性剤に、500 ppmの濃度 (化合物の質量：希釈剤の体積) に希釈した。

【0346】

各化合物のアザミウマへの効力は、花浸漬技術を用いて評価した。試験場所としてプラスチック製ペトリ皿を用いた。健全な個々のランの花の花卉をすべて処理溶液に浸漬し、

10

20

30

40

50

乾燥した。処理した花を、10～15匹の成体アザミウマと一緒に各ペトリ皿に入れた。次に、このペトリ皿を蓋で覆った。アッセイの間、すべての試験場所を、連続光及び約28℃の温度下にて保持した。4日後、各花上及び各ペトリ皿の内壁に沿って生存しているアザミウマ数を数えた。処理前のアザミウマ数からアザミウマ致死率レベルを推定した。

この試験では、500ppmにおける化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-31、1-32、1-33、及び1-34はそれぞれ、未処理対照と比べて少なくとも75%の致死率を示した。

【0347】

B.5 イネツマグロヨコバイ (タイワンツマグロヨコバイ (*Nephotettix virescens*))

スプレーの24時間前に、イネの苗木をきれいにし洗浄した。活性化合物を50:50 (体積:体積)のアセトン:水中に配合し、0.1% (体積/体積)の界面活性剤 (EL620)を加えた。鉢植えのイネ苗木に5mlの試験溶液をスプレーして空気乾燥し、ケージ内に入れ、10匹の成体を接種した。処理したイネ植物を約28～29℃、及び相対湿度約50～60%で保持した。72時間後にパーセント致死率を記録した。

【0348】

この試験では、500ppmにおいて、化合物1-3、1-4、1-5、1-12、1-16、1-17、1-18、1-22、1-25及び1-29はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

B.6 ソラマメヒゲナガアブラムシ (メゴウラ・ウィキアエ (*Megoura viciae*))

接触手段又は浸透的手段によりソラマメヒゲナガアブラムシ (メゴウラ・ウィキアエ)の防除を評価するため、ソラマメの葉の幅広いディスクを含有する24ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75% v/v及びDMSO 25% v/vを含有する溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物2.5µlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して2連で葉のディスクにスプレーした。

施用後、葉のディスクを空気乾燥し、マイクロタイタープレートウェル内部の葉のディスク上に5～8匹の成体アブラムシを入れた。次に、処理済みの葉のディスクをアブラムシに吸汁させて、約23±1℃及び相対湿度約50±5%で5日間インキュベートした。その後、アブラムシの致死率及び繁殖性を目視で評価した。

この試験では、2500ppmにおいて、化合物1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-9、1-10、1-12、1-13、1-16、1-17、1-18、1-19、1-22、1-25、1-28、1-29、1-33、1-34、1-35、1-36、及び1-37はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0349】

B.7 オオタバコガ (ヘリオティス・ウィレスケンス (*Heliothis virescens*))

オオタバコガ (ヘリオティス・ウィレスケンス)の防除を評価するために、昆虫用餌食及び15～25個のH.ウィレスケンスの卵を含有する96ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75% v/v及びDMSO 25% v/vを含有している溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物10µlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して、2連で昆虫用餌食にスプレーした。

施用後、マイクロタイタープレートを約28±1℃及び相対湿度約80±5%で5日間インキュベートした。次に、卵及び幼虫の致死率を目視で評価した。

10

20

30

40

50

この試験では、2500ppmにおいて、化合物1-1、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、及び1-35はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0350】

B.8 ワタミハナゾウムシ（アントノムス・グランディス（*Anthonomus grandis*））

ワタミハナゾウムシ（アントノムス・グランディス）の防除を評価するため、昆虫用餌食及び20～30個のA.グランディスの卵を含有する24ウェルマイクロタイタープレートからなる試験ユニットを構成した。

本化合物は、水75%v/v及びDMSO25%v/vを含有している溶液を使用して配合した。様々な濃度の配合化合物20μlを、注文製のマイクロ噴霧器を使用して2連で昆虫用餌食にスプレーした。

施用後、マイクロタイタープレートを約23±1及び相対湿度約50±5%で5日間インキュベートした。その後、卵及び幼虫の致死率を目視で評価した。

この試験では、2500ppmにおいて、化合物1-1、1-2、1-3、1-4、1-5、1-6、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-13、1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-19、1-20、1-21、1-22、1-23、1-24、1-25、1-26、1-27、1-28、1-29、1-30、1-31、1-32、1-33、1-34、1-35、1-36、及び1-37はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0351】

B.9 ハダニ（カンザワハダニ（*Tetranychus kanzawai*））

活性化合物は、1:1（v/v）の蒸留水：アセトンの混合物中に所望の濃度で溶解した。0.1%（v/v）の割合で界面活性剤（Alkamuls（登録商標）EL620）を加えた。

【0352】

7～10日齢の鉢植えカウピービーンズを水道水で洗い、空気駆動式携帯型噴霧器を使用して試験溶液5mlをスプレーした。処理植物を空気乾燥し、その後、既知のダニ集団を含むキャッサバの葉の領域を切り取ることにより、20匹以上のダニを接種した。処理植物を約25～27及び相対湿度約50～60%の維持室内部に置いた。

【0353】

致死率は、生存するダニ（72HAT）を数えることにより判定した。72時間後にパーセント致死率を評価した。

【0354】

この試験では、500ppmにおいて、化合物1-3、1-4、1-5、1-6、1-17、1-18、1-22、1-25、1-29及び1-34はそれぞれ、未処理対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2014/063106

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D417/10 A01N43/80 C07D495/10
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, EMBASE, BEILSTEIN Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 1 731 512 A1 (NISSAN CHEMICAL IND LTD [JP]) 13 December 2006 (2006-12-13) claims 1, 9, 10; tables 8, 10, 12 -----	1-35
Y	WO 2011/092287 A1 (BASF SE [DE]; KOERBER KARSTEN [DE]; KAISER FLORIAN [DE]; DEYN WOLFGANG) 4 August 2011 (2011-08-04) Comparative tables 1-3; claims 1, 22-33 -----	1-35
A	WO 2013/037626 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG [CH]; CASSAYRE JEROME YVES [CH]; EL QACEMI) 21 March 2013 (2013-03-21) claims 1, 12-15 -----	1-35
X,P	WO 2013/092943 A1 (BASF SE [DE]) 27 June 2013 (2013-06-27) inter alia compounds 2-31, 2-69, 2-70; claims 1, 53-61; table C.2 -----	1-35



Further documents are listed in the continuation of Box C.



See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

12 August 2014

Date of mailing of the international search report

21/08/2014

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Moriggi, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2014/063106

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 1731512	A1	13-12-2006	AU	2005219788 A1	15-09-2005
			AU	2010212450 A1	09-09-2010
			BR	PI0508140 A	24-07-2007
			CA	2558848 A1	15-09-2005
			CN	101768129 A	07-07-2010
			CN	102532048 A	04-07-2012
			CN	102558082 A	11-07-2012
			EA	200601639 A1	27-02-2007
			EA	200900197 A1	30-06-2009
			EP	1731512 A1	13-12-2006
			IL	177949 A	28-02-2013
			JP	4883296 B2	22-02-2012
			JP	5321856 B2	23-10-2013
			JP	2012006944 A	12-01-2012
			KR	20070010145 A	22-01-2007
			KR	20110132638 A	08-12-2011
			TW	I355896 B	11-01-2012
			US	2007066617 A1	22-03-2007
			US	2009312330 A1	17-12-2009
			US	2011251398 A1	13-10-2011
			US	2012172615 A1	05-07-2012
			US	2013296559 A1	07-11-2013
			WO	2005085216 A1	15-09-2005

WO 2011092287	A1	04-08-2011	CN	102762543 A	31-10-2012
			EP	2531493 A1	12-12-2012
			JP	2013518084 A	20-05-2013
			KR	20120125332 A	14-11-2012
			US	2012309620 A1	06-12-2012
			WO	2011092287 A1	04-08-2011

WO 2013037626	A1	21-03-2013	CN	103842358 A	04-06-2014
			EP	2755969 A1	23-07-2014
			UY	34318 A	30-04-2013
			WO	2013037626 A1	21-03-2013

WO 2013092943	A1	27-06-2013	AU	2012356947 A1	10-07-2014
			WO	2013092943 A1	27-06-2013

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
C 0 7 D 495/10 (2006.01)	C 0 7 D 495/10	
A 6 1 P 33/00 (2006.01)	A 6 1 P 33/00	1 7 1
A 0 1 N 43/80 (2006.01)	A 0 1 N 43/80	1 0 2
A 0 1 N 43/90 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 2
A 0 1 N 43/84 (2006.01)	A 0 1 N 43/84	1 0 1
A 0 1 P 7/04 (2006.01)	A 0 1 N 43/84	1 0 2
A 0 1 P 7/02 (2006.01)	A 0 1 N 43/90	1 0 3
	A 0 1 P 7/04	
	A 0 1 P 7/02	

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LT,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US

(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

(74)代理人 100137626

弁理士 田代 玄

(72)発明者 ビントシェートラー パスカル

ドイツ連邦共和国 6 7 3 5 4 レーマーベルク ガルテンシュトラッセ 3 4 アー

(72)発明者 ヴォン ダイン ヴォルフガング

ドイツ連邦共和国 6 7 4 3 5 ノイシュタット アン デア ブライヒェ 2 4

(72)発明者 ケーバー カルステン

ドイツ連邦共和国 6 9 2 1 4 エッペルハイム ヒンテレ リスゲヴァン 2 6

(72)発明者 カルバートソン デボラ エル

アメリカ合衆国 ノースカロライナ州 2 7 5 2 6 フキー ヴァリナ ヴィンテージ リッジ
レーン 6 4 0 0

(72)発明者 ブラウン フランツ ジョセフ

アメリカ合衆国 ノースカロライナ州 2 7 7 0 3 ダラム ロング リッジ ロード 3 6 0 2

(72)発明者 ゲンジマ コウシ

愛知県豊橋市白河町 9 7 ハイツタカラ - 3 2 0 5

F ターム(参考) 4C033 AA05 AA17 AA20

4C063 AA01 BB06 CC61 DD02 DD03 DD10 DD23 DD54 EE01 EE03

4C071 AA04 BB01 CC01 CC21 EE11 FF01 GG01 JJ04 LL01 LL02

4C086 AA01 AA02 AA03 BC79 CB26 GA07 GA10 GA12 MA01 MA04

NA14 ZB37 ZC61

4H011 AC01 AC04 BB10 DA12 DD03 DE15