

(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2015-501327

(P2015-501327A)

(43) 公表日 平成27年1月15日(2015.1.15)

(51) Int.Cl.	F 1	テーマコード (参考)
C07C 233/65 (2006.01)	C 07C 233/65	4 C 055
A61K 31/166 (2006.01)	A 61K 31/166	4 C 086
C07D 213/81 (2006.01)	C 07D 213/81	4 C 206
A61K 31/44 (2006.01)	A 61K 31/44	4 H 006
C07D 239/28 (2006.01)	C 07D 239/28	4 H 011

審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 122 頁) 最終頁に続く

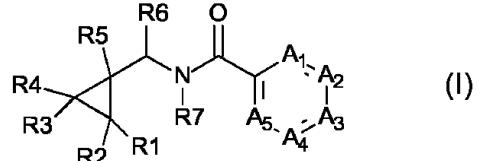
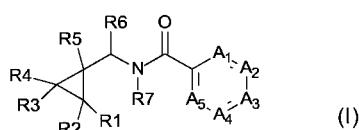
(21) 出願番号	特願2014-539320 (P2014-539320)	(71) 出願人	500584309 シンジエンタ パーティシペーションズ
(86) (22) 出願日	平成24年10月31日 (2012.10.31)		アクチエンゲゼルシャフト
(85) 翻訳文提出日	平成26年5月26日 (2014.5.26)		イスラエル, ツェーハー-4058 バーゼル, シュバルツバルトアレー 215
(86) 國際出願番号	PCT/EP2012/071525	(74) 代理人	100099759 弁理士 青木 篤
(87) 國際公開番号	W02013/064520	(74) 代理人	100077517 弁理士 石田 敬
(87) 國際公開日	平成25年5月10日 (2013.5.10)	(74) 代理人	100087871 弁理士 福本 積
(31) 優先権主張番号	11187914.4	(74) 代理人	100087413 弁理士 古賀 哲次
(32) 優先日	平成23年11月4日 (2011.11.4)	(74) 代理人	100117019 弁理士 渡辺 陽一
(33) 優先権主張国	歐州特許庁 (EP)		
(31) 優先権主張番号	12179208.9		
(32) 優先日	平成24年8月3日 (2012.8.3)		
(33) 優先権主張国	歐州特許庁 (EP)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】殺虫化合物

(57) 【要約】

式 (I)



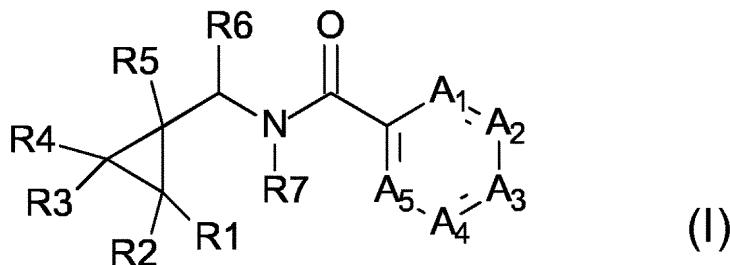
(式中、R 1 ~ R 4 が、例えば、それぞれ水素であり、R 5 が、例えば、置換フェノールであり；R 6 が、例えば、水素であり；R 7 が、例えば、水素、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - アルコキシ、C 2 ~ C 4 - アルケニル、またはC 2 ~ C 4 - アルキニルであり；A 1 ~ A 5 が、例えば、A 1 がNまたはC - Xであり、A 3 がC - Xであり、A 2 、A 4 およびA 5 がC - Hであり、ここで、Xが、例えば、ハロゲンである)の化合物；および有害生物防除剤としてのその使用。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



10

(式中、

R 1 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 2 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 3 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 4 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 5 が、置換または非置換フェニル基であり；

R 6 が、水素またはC 1 ~ C 4 - アルキルであり；

20

R 7 が、水素、シアノ、ヒドロキシリ、ホルミル、C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - アルコキシ、C 2 ~ C 4 - アルケニル、C 2 ~ C 4 - アルキニル、C 1 ~ C 4 - アルコキシ - C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - シアノアルキル、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、C 1 ~ C 4 - アルコキシカルボニル、ベンジル、C 3 ~ C 6 - シクロアルキルカルボニルまたはC 3 ~ C 6 - シクロアルコキシカルボニルであり；

A 1 が、N、C - H またはC - X であり；

A 2 が、N、C - H またはC - X であり；

A 3 が、N、C - H またはC - X であり；

A 4 が、N、C - H またはC - X であり；

A 5 が、N、C - H またはC - X であり；

ただし、A 1 およびA 5 がそれぞれN である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C H、C X およびN から選択され；またはA 2 がC X である場合、A 1、A 3 ~ A 5 は、独立して、C H、N またはC X から選択され；またはA 1 がC X であり、A 5 がN である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C X およびC H から選択され；またはA 1 がC X であり、A 5 がC H である場合、A 2 ~ A 4 のうちの1つがC X であり、残りがそれぞれC H であり；またはA 1 がC X であり、A 4 がN である場合、A 2、A 3 およびA 5 は、独立して、C X およびC H から選択され；またはA 1 が、C - ハロゲン以外であり、A 2 がN である場合、A 3、A 4 およびA 5 は、独立して、C X およびC H から選択され；

30

X が、ハロゲン、O H、シアノ、C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - ハロアルキル、C 1 ~ C 4 - アルコキシまたはC 1 ~ C 4 - ハロアルコキシであり；

ただし、A 1 ~ A 5 のうちの3つ以下がN である)

40

の化合物；

ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、およびN - オキシド。

【請求項 2】

R 1 ~ R 4 がそれぞれ水素であり；R 5 が、置換または非置換フェニルであり；R 6 が、水素またはC 1 ~ C 4 - アルキルであり；R 7 が、水素、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、またはC 1 ~ C 4 - アルコキシカルボニルであり；A 1 およびA 5 がそれぞれN である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C H、C X およびN から選択され；またはA 2 がC X である場合、A 1、A 3 ~ A 5 は、独立して、C H、N またはC X から選択され；またはA 1 がC X であり、A 5 がN である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C X およびC H から選択され；

50

ら選択され；またはA 1がCXであり、A 5がCHである場合、A 2～A 4のうちの1つがCXであり、残りがそれぞれCHであり；またはA 1がCXであり、A 4がNである場合、A 2、A 3およびA 5は、独立して、CXおよびCHから選択され；ここで、Xが、互いに独立して、ハロゲン、C 1～C 4-アルキル、またはC 1～C 4-ハロアルキルである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R 1～R 4がそれぞれ水素であり；R 5が、置換または非置換フェニルであり；R 6が、水素またはC 1～C 4-アルキルであり；R 7が、水素、C 1～C 4-アルキルカルボニル、またはC 1～C 4-アルコキシカルボニルであり；A 1が、C-ハロゲン以外であり、A 2がNであり、A 3、A 4およびA 5が、独立して、CXおよびCHから選択され；ここで、Xが、互いに独立して、ハロゲン、C 1～C 4-アルキル、またはC 1～C 4-ハロアルキルである、請求項1に記載の式(I)の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、およびN-オキシド。

10

【請求項4】

A 1がC-C 1～C 4-ハロアルキルであり、A 2がNであり、A 3、A 4およびA 5が、独立して、CXおよびCHから選択され；ここで、Xが、互いに独立して、ハロゲン、C 1～C 4-アルキルまたはC 1～C 4-ハロアルキルであり；好ましくはA 1がC-CF 3であり、A 2がNであり、A 3、A 4およびA 5がそれぞれCHである、請求項3に記載の化合物。

20

【請求項5】

R 1～R 4がそれぞれ水素であり；R 5が、二置換または三置換フェニルであり、前記置換基が、独立して、ハロゲン、シアノ、C 1～C 4-ハロアルキル、C 1～C 4-ハロアルコキシ、およびC 3～C 6-シクロアルキルから選択され、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R xで置換され、ここで、R xが、互いに独立して、ハロゲン、C 1～C 4-アルキル、およびC 1～C 4-ハロアルキルから選択され；R 6が、水素またはC 1～C 4-アルキルであり；R 7が、水素、C 1～C 4-アルキルカルボニル、またはC 1～C 4-アルコキシカルボニルであり、A 1およびA 5がそれぞれNである場合、A 2～A 4は、独立して、CH、CXおよびNから選択され；またはA 2がCXである場合、A 1、A 3～A 5は、独立して、CH、NまたはCXから選択され；またはA 1がCXであり、A 5がNである場合、A 2～A 4は、独立して、CXおよびCHから選択され；またはA 1がCXであり、A 5がCHである場合、A 2～A 4のうちの1つがCXであり、残りがそれぞれCHであり；またはA 1がCXであり、A 4がNである場合、A 2、A 3およびA 5は、独立して、CXおよびCHから選択され；ここで、Xが、互いに独立して、ハロゲン、C 1～C 4-アルキル、またはC 1～C 4-ハロアルキルである、請求項1に記載の化合物。

30

【請求項6】

Xが、互いに独立して、ハロゲン、C 1～C 4-アルキルまたはC 1～C 4-ハロアルキルである、請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項7】

前記R 5が置換フェニルである場合、前記置換基は、独立して、シアノ置換フェニル（これは、ハロゲンまたはトリフルオロメチルで任意にさらに置換される）、2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル、2,6-ジフルオロ-4-クロロ-フェニル、2,4-ジフルオロフェニル、2,4,6-トリフルオロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2-フルオロ-4-ブロモフェニル、2-クロロ-4-フルオロフェニル、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、2,4-ジクロロ-6-フルオロフェニル、および2,4-ジブロモフェニルおよび2,4-クロロフェニルから選択される、請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物。

40

【請求項8】

R 1～R 4がそれぞれ水素であり；R 5が、シアノ置換フェニル（これは、ハロゲンまたはトリフルオロメチルで任意にさらに置換される）、2-フルオロ-4-トリフルオロ

50

メチルフェニル、2,6-ジフルオロ-4-クロロフェニル、2,4-ジフルオロフェニル、2,4,6-トリフルオロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2-フルオロ-4-プロモフェニル、2-クロロ-4-フルオロフェニル、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、2,4-ジクロロ-6-フルオロフェニル、および2,4-ジプロモフェニルから選択され；R6が、水素またはC1～C4-アルキルであり；R7が、水素、C1～C4-アルキルカルボニル、またはC1～C4-アルコキシカルボニルであり；A1がC-Xであり、A2～A5がそれぞれCHであり；またはA1およびA5がそれぞれC-Xであり、A2～A4がそれぞれCHであり；またはA1がC-Xであり、A2およびA5がそれぞれNであり、A3およびA4がそれぞれCHであり；またはA1がC-Xであり、A2がNであり、A3～A5がそれぞれCHであり、ここで、Xが、独立して、ハロゲン、C～C4-アルキルまたはC-1～C4-ハロアルキルから選択される、請求項1に記載の式(I)の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、およびN-オキシド。

10

【請求項9】

R1～R4がそれぞれ水素であり；R5が2,4-クロロフェニルであり；R6が、水素またはC1～C4-アルキルであり；R7が、水素、C1～C4-アルキルカルボニル、またはC1～C4-アルコキシカルボニルであり；A1がC-C1であり、A2～A5がそれぞれCHであり；またはA1がC-Fであり、A2およびA5がそれぞれNであり、A3およびA4がそれぞれCHであり；またはA1およびA5がそれぞれC-C1またはC-CF3であり、A2～A4がそれぞれCHであり；またはA1が、C-FまたはC-CF3であり、A2がNであり、A3～A5がそれぞれCHである、請求項1に記載の式(I)の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、およびN-オキシド。

20

【請求項10】

Xが、A1～A5の配置から独立して、およびA1～A5の配置内のXから独立して、塩素、フッ素、トリフルオロメチルおよびジフルオロメチルから選択され；好ましくはA1がC-CF3であり、A2～A5がそれぞれCHであり；またはA1およびA5がそれぞれC-Fであり、A2～A4がそれぞれCHであり；またはA1が、C-CF3またはC1であり、A2およびA5がそれぞれNであり、A3およびA4がそれぞれCHであり；またはA1がC-CF3であり、A2がNであり、A3～A5がそれぞれCHである、請求項8に記載の化合物。

30

【請求項11】

前記A1が、NまたはC-Xであり、前記基A2、A3、A4およびA5が、以下から選択され、(I)A2、A3およびA4がそれぞれC-Hであり、A5がNであり；(II)A2がC-Xであり、A3、A4およびA5がそれぞれC-Hであり；(III)A3がC-Xであり、A2、A4およびA5がそれぞれC-Hであり；(IV)A4がC-Xであり、A2、A3およびA5がそれぞれC-Hであり；(V)A2、A3およびA5がそれぞれCHであり、A4がNである、請求項1または請求項2に記載の化合物。

30

【請求項12】

A1およびA5がそれぞれNである場合、A2～A4は、独立して、CH、CXおよびNから選択され；またはA2がCXである場合、A1、A3～A5は、独立して、CH、NまたはCXから選択され；またはA1がCXであり、A5がNである場合、A2～A4は、独立して、CXおよびCHから選択され；好ましくはA1およびA5がそれぞれNである場合、A2～A4はそれぞれCHであり；またはA2がCXであり、A1がCXであり、A3～A5がそれぞれCHであり；またはA1がCXであり、A5がNである場合、A2～A4はそれぞれCHである、請求項1または請求項2に記載の化合物。

40

【請求項13】

R5が、ハロゲン、シアノ、C1～C2-アルキル、C1～C4-ハロアルキル、C1～C4-アルコキシ、C1～C4-ハロアルコキシ、C3～C6-シクロアルキルから独

50

立して選択される置換基を有する置換フェニルであり、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R_xで置換され、ここで、R_xが、互いに独立して、ハロゲン、C1～C4-アルキル、およびC1～C4-ハロアルキルから選択される、請求項1～4、6、11および12のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

R5における前記フェニル上の前記置換基が、独立して、ハロゲン、シアノ、C1～C4-ハロアルキル、C1～C4-ハロアルコキシ、およびC3～C6-シクロアルキルから選択され、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R_xで置換され、ここで、R_xが、互いに独立して、ハロゲン、C1～C2-アルキル、およびC1～C2-ハロアルキルから選択される、請求項13に記載の化合物。

10

【請求項15】

R5における前記フェニル上の前記置換基が、独立して、ハロゲン、シアノ、C1～C2-ハロアルキル、C1～C2-ハロアルコキシ、およびC3～C4-シクロアルキルから選択され、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R_xで置換され、ここで、R_xが、互いに独立して、ハロゲン、C1～C2-アルキル、およびC1～C2-ハロアルキルから選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項16】

R5が、1～3つの置換基、好ましくは2つまたは3つの置換基、より好ましくは2つの置換基を有する置換フェニルである、請求項1～4、6、11～14のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項17】

R5における前記フェニルが、任意に置換されるフェニルまたは任意に置換されるピラゾールで置換される、請求項1～4、6、11、12および16のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

前記置換基が、独立して、塩素、メチル、フッ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、およびシアノから選択される、請求項16に記載の化合物。

【請求項19】

A1が、NまたはC-Xであり、A2、A3およびA4がC-Hであり、A5がNである、請求項1、2、5～7および11～18のいずれか一項に記載の化合物。

30

【請求項20】

A1が、NまたはC-Xであり、A2がC-Xであり、A3、A4およびA5がそれぞれC-Hである、請求項1、2、5～7および11～18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項21】

A1が、NまたはC-Xであり、A3がC-Xであり、A2、A4およびA5がC-Hである、請求項1、2、5～7および11～18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項22】

A1が、NまたはC-Xであり、A4がC-Xであり、A2、A3およびA5がそれぞれC-Hである、請求項1、2、5～7および11～18のいずれか一項に記載の化合物。

40

【請求項23】

A1がC-C1～C4-ハロアルキルであり、A2がNであり、A3、A4およびA5がそれぞれC-Hである、請求項1、2、5～7および11～18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項24】

A1がCXであり、A2、A3およびA4がC-Hであり、A5がNである、請求項1、2、5～7および11～18のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項25】

R6が、水素またはC1～C2-アルキル、好ましくは水素である、請求項1～24の

50

いずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 6】

R 7 が水素である、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 2 7】

A 1 が C X であり、A 2、A 3 および A 4 が C - H であり、A 5 が N である、請求項 1 9 に記載の化合物。

【請求項 2 8】

A 1 が N であり、A 2、A 3 および A 4 が C - H であり、A 5 が N である、請求項 1 9 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

前記 A 1 ~ A 5 の C X の X が、独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 2 - アルキルおよび C 1 ~ C 2 - ハロアルキルから選択され；好ましくは、塩素、フッ素、メチル、およびトリフルオロメチルから独立して選択される、請求項 1 ~ 8 および 1 1 ~ 2 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 3 0】

R 1 ~ R 4、R 6 および R 7 がそれぞれ水素であり；R 5 が、一置換から三置換フェニルであり、前記置換基が、独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - ハロアルキル、シアノおよび C 3 ~ C 6 - シクロアルキルから選択され、この C 3 ~ C 6 - シクロアルキルは、非置換であるかまたは 1 つ以上の置換基 R X で置換され、ここで、R X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、および C 1 ~ C 4 - ハロアルキルから選択され；A 1 ~ A 5 が、請求項 1 9 ~ 2 4、2 7 および 2 8 のいずれか一項において定義されるとおりであり；X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 2 - アルキル、または C 1 ~ C 2 - ハロアルキルである、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、および N - オキシド。

【請求項 3 1】

請求項 1 ~ 3 0 のいずれか一項に記載の化合物と、農学的に担体と、任意に 1 つ以上の通例の製剤助剤とを含む組成物であって；好ましくは殺虫組成物；より好ましくは殺線虫組成物である組成物。

【請求項 3 2】

1 つ以上の他の生物学的に活性な化合物をさらに含む、請求項 3 1 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

有害生物および / または真菌によって引き起こされる被害および / または収穫高低下を防除する方法であって、有害生物、有害生物の場所、または有害生物および / または真菌による攻撃を受けやすい植物または植物繁殖材料に、有効量の請求項 1 ~ 3 0 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物または請求項 3 1 または 3 2 に記載の組成物を施用する工程を含む方法。

【請求項 3 4】

有害生物および / または真菌によって引き起こされる被害および / または収穫高低下から植物繁殖材料を保護するための方法であって、前記繁殖材料または前記繁殖材料が植え付けられる前記場所に、有効量の請求項 1 ~ 3 0 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物または請求項 3 1 または 3 2 に記載の組成物を施用する工程を含む方法。

【請求項 3 5】

前記有害生物が、線虫綱 (Nematoda) から選択される、請求項 3 3 または請求項 3 4 に記載の方法。

【請求項 3 6】

処理された植物繁殖材料であって、有効量の請求項 1 ~ 3 0 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物が付着された植物繁殖材料。

【請求項 3 7】

蠕虫、クモ形類または節足動物の内部寄生生物または外部寄生生物の防除のための医薬

10

20

30

40

50

組成物であって、請求項 1 ~ 30 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物と、生理学的に許容可能な担体と、任意に 1 つ以上の通例の製剤助剤とを含む医薬組成物。

【請求項 3 8】

蠕虫、クモ形類または節足動物の内部寄生生物または外部寄生生物を介して伝播される疾病による感染を予防するための、請求項1～30のいずれか一項に記載の化合物と、生理学的に許容可能な担体と、任意に1つ以上の通例の製剤助剤とを含む医薬組成物。

【請求項 3 9】

1つ以上の他の生物学的に活性な化合物をさらに含む、請求項3-7に記載の組成物。

【請求項 40】

蠕虫、クモ形類または節足動物の内部寄生生物または外部寄生生物による加害または感染に対して、温血動物または魚類を治療、防除、予防、または保護するための方法であつて、寄生生物駆除に有効な量の請求項1～30のいずれか一項に記載の式(I)の化合物または請求項37～39のいずれか一項に記載の組成物を、前記動物または魚類に経口で、局所的にまたは非経口的に投与または施用する工程を含む方法。

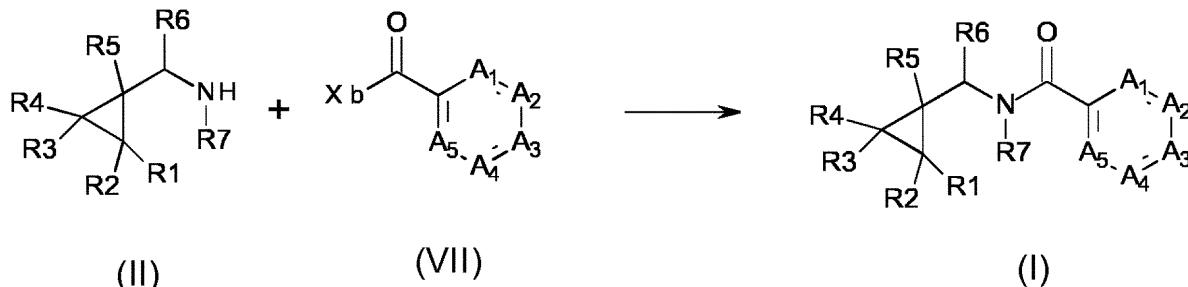
【請求項 4 1】

請求項 1 ~ 30 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物を含む、蠕虫、クモ形類または節足動物の内部寄生生物または外部寄生生物による加害または感染に対して、温血動物または魚類を治療、防除、予防、または保護するための組成物の調製のための方法。

【請求項 4 2】

式 (I I) および式 (V I I)

【化 2】



(式中、R 1 ~ R 7、A 1、A 2、A 3、A 4、およびA 5が、請求項1~30のいずれかに定義されるとおりであり、X bが、ハロゲン化物およびヒドロキシルから選択される脱離基である)

の化合物を反応させる工程を含む、式(Ⅰ)の化合物を調製するための方法。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

[0 0 0 1]

本発明は、特定のN-[1-(2-フェニル)シクロプロピルメチル]ヘテロアリールカルボキサミド誘導体、それらの調製のための方法、それらの化合物を含む組成物、ならびに農業および獣医学分野および有害生物管理に依存する分野におけるそれらの使用に関する。この化合物は、農業における有害生物および真菌病による植物への被害を防除するのに特に有効である。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

[0 0 0 2]

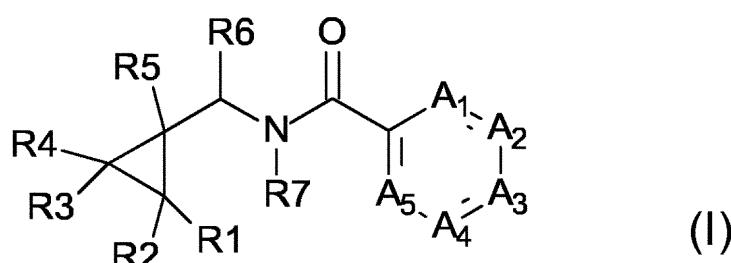
本発明者らは、特定のN-[1-(2-フェニル)シクロプロピルメチル]ヘテロアリールカルボキサミド誘導体が、有害生物および真菌病、特に、線虫有害生物による被害を防除するのに特に有効であることを見出した。

【課題を解決するための手段】

[0 0 0 3]

したがって、本発明は、式(Ⅰ)の化合物

式 (I)
【化1】



10

(式中、

R 1 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 2 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 3 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 4 が、水素、メチルまたはハロゲンであり；

R 5 が、置換または非置換フェニル基であり；

R 6 が、水素またはC 1 ~ C 4 - アルキルであり；

R 7 が、水素、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - アルコキシ、C 2 ~ C 4 - アルケニル、C 2 ~ C 4 - アルキニル、C 1 ~ C 4 - アルコキシ - C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - シアノアルキル、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、C 1 ~ C 4 - アルコキシカルボニル、ベンジル、C 3 ~ C 6 - シクロアルキルカルボニルまたはC 3 ~ C 6 - シクロアルコキシカルボニルであり；

20

A 1 が、N、C - HまたはC - Xであり；

A 2 が、N、C - HまたはC - Xであり；

A 3 が、N、C - HまたはC - Xであり；

A 4 が、N、C - HまたはC - Xであり；

A 5 が、N、C - HまたはC - Xであり；

ただし、A 1 およびA 5 がそれぞれNである場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C H、C XおよびNから選択され；またはA 2 がC Xである場合、A 1、A 3 ~ A 5 は、独立して、C H、NまたはC Xから選択され；またはA 1 がC Xであり、A 5 がNである場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C XおよびC Hから選択され；またはA 1 がC Xであり、A 5 がC Hである場合、A 2 ~ A 4 のうちの1つがC Xであり、残りがそれぞれC Hであり；またはA 1 がC Xであり、A 4 がNである場合、A 2、A 3 およびA 5 は、独立して、C XおよびC Hから選択され；

30

Xが、ハロゲン、O H、シアノ、C 1 ~ C 4 - アルキル、C 1 ~ C 4 - ハロアルキル、C 1 ~ C 4 - アルコキシまたはC 1 ~ C 4 - ハロアルコキシであり；

ただし、A 1 ~ A 5 のうちの3つ以下がNである)

の化合物；

ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、およびN - オキシドに関する。

40

【0004】

式 (I) の化合物および、必要に応じて、その互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、分子中に現われる不斉炭素原子の数、絶対配置および相対配置に応じて、および/または分子中に現われる非芳香族二重結合の配置に応じて、可能な異性体の1つの形態またはこれらの混合物として、例えば、対掌体および/またはジアステレオマーなどの純粋な異性体の形態で、あるいは鏡像異性体混合物、例えばラセミ体、ジアステレオマー混合物またはラセミ混合物などの異性体混合物として存在することができ；本発明は、純粋な異性体に関し、可能な全ての異性体混合物にも関し、立体化学の詳細がそれぞれ特に記載されていない場合でも、上記および下記で、この意味でそれぞれ理解されるべきである。したがって、本発明は、あらゆる割合における全てのこのようない異性体および互変

50

異性体およびそれらの混合物ならびに重水素化合物などの同位体を包含する。例として、本発明の化合物は、例えば、-CR⁶-、-CR⁵-、-CR¹R²-、および-CR³R⁴-基に1個以上の不斉炭素原子を含有してもよく、式(I)の化合物は、鏡像異性体(またはジアステレオ異性体の対として)または上記のものの混合物として存在してもよい。

【0005】

本発明は、式(I)の各化合物の塩およびN-オキシドも包含する。

【0006】

当業者は、環境中および生理学的条件下で、化合物の塩がそれらの対応する非塩形態と平衡状態にあるため、塩が非塩形態の生物学的有用性を共有することも認識する。

【0007】

したがって、本発明の化合物の様々な塩(および本発明の活性成分と組み合わせて使用される活性成分)が、無脊椎有害生物および動物寄生生物の防除に有用であり得る。塩、特に、農学的および/または生理学的に許容可能な塩は、臭化水素酸、塩酸、硝酸、リン酸、硫酸、酢酸、酪酸、フマル酸、乳酸、マレイン酸、マロン酸、シュウ酸、プロピオニ酸、サリチル酸、酒石酸、4-トルエンスルホン酸または吉草酸などの無機酸または有機酸との酸付加塩を含む。

【0008】

好適な、特に、農学的および/または生理学的に許容可能な塩はまた、式(I)の化合物の殺虫および/または殺寄生生物作用に悪影響を及ぼさないカチオンの塩であり得る。したがって、特に好適なカチオンは、ナトリウム、カリウムおよびリチウムを含むアルカリ金属のイオン、カルシウムおよびマグネシウムを含むアルカリ土類金属のイオン、また、マンガン、銅、鉄、亜鉛、コバルト、鉛、銀、ニッケルを含む遷移金属のイオン、また、モノアルキルアンモニウム、ジアルキルアンモニウム、トリアルキルアンモニウム、テトラアルキルアンモニウム、モノアルケニルアンモニウム、ジアルケニルアンモニウム、トリアルケニルアンモニウム、モノアルキニルアンモニウム、ジアルキニルアンモニウム、モノアルカノールアンモニウム、ジアルカノールアンモニウム、C5~C6-シクロアルキルアンモニウム、ピペリジニウム、モルホリニウム、ピロリジニウム、またはベンジルアンモニウムを含むアンモニウムまたは有機アンモニウムのイオン、さらには、ホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C1~C4-アルキル)スルホニウムおよびスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C1~C4-アルキル)スルホキソニウムである。

【0009】

アルキル基(単独でまたはアルコキシ-、アルキルスルファニル-、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-またはアルコキシカルボニル-などのより大きい基の一部として)は、直鎖状または分枝鎖状の形態であり得、例えば、メチル、エチル、プロピル、プロパ-2-イル、ブチル、ブタ-2-イル、または2-メチル-プロパ-2-イルである。アルキル基(単独でまたはアルコキシ-、アルキルスルファニル-、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-またはアルコキシカルボニル-などのより大きい基の一部として)は、本発明の各実施形態において、好ましくはC1~C3-アルキル、より好ましくはC1~C2-アルキル、特に、メチル基である。アルコキシの場合、例は、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、n-ブトキシ、イソブトキシ、またそれらの異性体基；好ましくは、他の実施形態から独立して、メトキシおよびエトキシ、特に、メトキシである。

【0010】

アルケニル基は、直鎖状または分枝鎖状の形態であり得、必要に応じて、(E)配置または(Z)配置のいずれかのものであり得る。例は、ビニルおよびアリルである。アルケニル基は、本発明の各実施形態において、好ましくはC2~C3-アルケニル基、より好ましくはビニルまたはアリル基である。

【0011】

アルキニル基は、直鎖状または分枝鎖状の形態であり得る。例は、エチニルおよびプロ

10

20

30

40

50

パルギルである。アルキニル基は、本発明の各実施形態において、好ましくはC2～C3-アルキニル基、より好ましくはプロパルギル基である。

【0012】

ハロゲンは、フッ素、塩素、臭素またはヨウ素であり；ハロゲンは、本発明の各実施形態において、フッ素、塩素、または臭素；特に、フッ素または塩素である。

【0013】

ハロアルキル基（単独でまたはハロアルコキシ-、ハロアルキルスルファニル-、ハロアルキルスルフィニル-またはハロアルキルスルホニル-などのより大きい基の一部として）は、同じかまたは異なるハロゲン原子の1つ以上で置換されるアルキル基であり、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロジフルオロメチルおよび2,2,2-トリフルオロ-エチルである。ハロアルキル基（単独でまたはハロアルコキシ-、ハロアルキルスルファニル-、ハロアルキルスルフィニル-またはハロアルキルスルホニル-などのより大きい基の一部として）は、本発明の各実施形態において、ハロアルキルは、好ましくはトリフルオロメチルである。ハロアルコキシの場合、例は、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシおよび2,2,2-トリクロロエトキシ；好ましくはジフルオロメトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロエトキシおよびトリフルオロメトキシである。

10

【0014】

シクロアルキル基は、単環式であり、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシルである。C3～C6-シクロアルキル基は、本発明の各実施形態において、好ましくはC3～C5-シクロアルキル、より好ましくはC3～C4-シクロアルキル基、特に、C3-シクロアルキル基である。シクロアルキル部分が置換されているものと考えられる場合、シクロアルキル部分は、好ましくは、1～4つの置換基、最も好ましくは、1～3つの置換基（1つまたは2つの置換基、特に、1つの置換基など）で置換される。

20

【0015】

アルコキシカルボニルは、例えば、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、イソブトキシカルボニル、sec-ブトキシカルボニルおよびtert-ブトキシカルボニルであり；好ましいのは、メトキシカルボニル、エトキシカルボニルおよびイソプロポキシカルボニルである。

30

【0016】

アルキルスルファニル基は、例えば、メチルスルファニル、エチルスルファニル、プロピルスルファニル、イソプロピルスルファニル、n-ブチルスルファニル、イソブチルスルファニル、sec-ブチルスルファニルおよびtert-ブチルスルファニルである。ハロアルキルスルファニルの例は、ジフルオロメチルスルファニル、トリフルオロメチルスルファニル、クロロジフルオロメチルスルファニルおよび2,2,2-トリフルオロ-エチルスルファニルなどのそのクロロ-および/またはフルオロ-ハロゲン化置換基である。

40

【0017】

アルキルスルフィニルは、例えば、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、イソブチルスルフィニル、sec-ブチルスルフィニル、およびtert-ブチルスルフィニルである。ハロアルキルスルフィニルの例は、ジフルオロメチルスルフィニル、トリ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および2,2,2-トリフルオロ-エチルスルフィニルなどのそのクロロ-および/またはフルオロ-ハロゲン化置換基である。

【0018】

50

アルキルスルホニル基は、例えば、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニル、イソプロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、イソブチルスルホニル、sec-ブチルスルホニルおよびtert-ブチルスルホニルである。ハロアルキルスルホニルの例は、ジフルオロメチルスルホニル、トリ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および2,2,2-トリフルオロ-エチルスルホニルなどのそのクロロ-および/またはフルオロ-ハロゲン化置換基である。

【0019】

アルコキシアルキルは、例えば、メトキシメチル、2-メトキシエチル、エトキシメチル、2-エトキシエチル、n-プロポキシメチル、2-n-プロポキシエチル、イソプロポキシメチルおよび1-イソプロポキシエチルである。アルコキシアルキル基は、本発明の各実施形態において、好ましくはC1~C4-アルコキシ-C1~C4-アルキル、より好ましくは、メトキシメチルおよびエトキシメチル基などのC1~C2-アルコキシメチルである。

【0020】

アリール基（単独でまたはアリール-アルキレン-などのより大きい基の一部として）は、単環式、二環式または三環式であり得る芳香環系である。このような環の例としては、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニルまたはフェナントレンが挙げられる。好ましいアリール基は、フェニルおよびナフチルであり、フェニルが最も好ましい。

【0021】

シクロアルキルカルボニルの例は、シクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニルおよびシクロヘキシルカルボニルであり；好ましいのは、シクロプロピルカルボニルおよびシクロブチルカルボニルである。

【0022】

シクロアルコキシカルボニルの例は、シクロプロピルオキシカルボニル、シクロブチルオキシカルボニル、シクロペンチルオキシカルボニルおよびシクロヘキシルオキシカルボニルであり；好ましいのは、シクロプロピルオキシカルボニルおよびシクロブチルオキシカルボニルである。

【発明を実施するための形態】

【0023】

他の実施形態から独立した一実施形態において、式(I)の化合物のR1、R2、R3およびR4のうちの少なくとも2つが水素であり；好ましくは少なくとも3つ；特に、R1、R2、R3およびR4のそれぞれが水素である。

【0024】

他の実施形態から独立した一実施形態において、式(I)の化合物のR1、R2、R3およびR4の少なくとも1つ、好ましくは1つが、ハロゲンまたはメチルである。

【0025】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R5が非置換フェニルである。

【0026】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R5が、1~5つの置換基を有する置換フェニルである。

【0027】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R5が、1~3つの置換基を有する置換フェニルである。

【0028】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R5が、2つの置換基を有する置換フェニルである。

【0029】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R5が、1つの置換基を有する置換フェニルである。

【0030】

10

20

30

40

50

他の実施形態から独立した一実施形態において、R₅が置換フェニルである場合、置換基は、独立して、ハロゲン、シアノ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₁～C₄-アルコキシ、C₁～C₄-ハロアルコキシ、C₁～C₄-アルキルスルファン、C₁～C₄-ハロアルキルスルファン、C₁～C₄-アルキルスルフィニル、C₁～C₄-ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₄-アルキルスルホニル、C₁～C₄-ハロアルキルスルホニル、C₃～C₆-シクロアルキルから選択され、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R_xで置換され、ここで、R_xが、互いに独立して、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル、およびC₁～C₄-ハロアルキルから選択される。

【0031】

10

他の実施形態から独立した一実施形態において、R₅が置換フェニルである場合、置換基は、独立して、ハロゲン、シアノ、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-ハロアルキル、C₁～C₄-ハロアルコキシ、およびC₃～C₆-シクロアルキルから選択され、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R_xで置換され、ここで、R_xが、互いに独立して、ハロゲン、C₁～C₄-アルキル、およびC₁～C₄-ハロアルキルから選択され；好ましくは、置換基は、独立して、シアノ、ハロゲン、およびC₁～C₄-ハロアルキルから選択される。

【0032】

一実施形態において、R₅が、シアノ置換フェニル（これは、ハロゲンまたはトリフルオロメチルで任意にさらに置換される）、2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル、2,6-ジフルオロ-4-クロロ-フェニル、2,4-ジフルオロフェニル、2,4,6-トリフルオロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2-フルオロ-4-プロモフェニル、2-クロロ-4-フルオロフェニル、2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、2,4-ジクロロ-6-フルオロフェニル、2,4-ジプロモフェニルまたは2,4ジクロロフェニルであり、それぞれ、フェニルが、フェン-1-イルを表す。

20

【0033】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R₅が、以下の表Pに示されるR₅置換基のいずれか1つである。

【0034】

30

他の実施形態から独立した一実施形態において、R₆が、水素またはC₁～C₂-アルキル、好ましくは水素またはメチルである。

【0035】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R₇が、水素、シアノ、ヒドロキシル、ホルミル、C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルコキシ、C₂～C₄-アルケニル、C₂～C₄-アルキニル、C₁～C₄-アルコキシ-C₁～C₄-アルキル、C₁～C₄-アルキルカルボニル、C₁～C₄-アルコキシカルボニルおよびベンジルから選択される。好ましくはR₇が、水素、ヒドロキシル、C₁～C₂-アルキル、C₁～C₂-アルコキシ、C₂-アルケニル、C₃-アルキニル、C₁～C₂-アルコキシ-C₁-アルキル、C₁～C₂-アルキルカルボニル、およびC₁～C₂-アルコキシカルボニル、特に、水素、ヒドロキシル、メチル、シアノ、ホルミル、メトキシ、アリル、プロパルギル、メトキシカルボニル、メトキシメチルおよびベンジルであり；特に、R₇が水素である。

40

【0036】

式(I)の化合物の好ましい群において、R₁～R₄がそれぞれ水素であり；R₅が、置換または非置換フェニルであり；R₆が、水素またはC₁～C₄-アルキルであり；R₇が、水素、C₁～C₄-アルキルカルボニル、またはC₁～C₄-アルコキシカルボニルであり；A₁およびA₅がそれぞれNである場合、A₂～A₄は、独立して、C_H、C_XおよびNから選択され；またはA₂がC_Xである場合、A₁、A₃～A₅は、独立して、C_H、NまたはC_Xから選択され；またはA₁がC_Xであり、A₅がNである場合、A

50

2 ~ A 4 は、独立して、C X および C H から選択され；または A 1 が C X であり、A 5 が C H である場合、A 2 ~ A 4 のうちの 1 つが C X であり、残りがそれぞれ C H であり；または A 1 が C X であり、A 4 が N である場合、A 2、A 3 および A 5 は、独立して、C X および C H から選択され；ここで、X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、または C 1 ~ C 4 - ハロアルキルである。

【0037】

式 (I) の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、および N - オキシドのさらなる好ましい群において、R 1 ~ R 4 がそれぞれ水素であり；R 5 が、二置換または三置換フェニルであり、置換基が、独立して、ハロゲン、シアノ、C 1 ~ C 4 - ハロアルキル、C 1 ~ C 4 - ハロアルコキシ、および C 3 ~ C 6 - シクロアルキルから選択され、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは 1 つ以上の置換基 R x で置換され、ここで、R x が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、および C 1 ~ C 4 - ハロアルキルから選択され；R 6 が、水素または C 1 ~ C 4 - アルキルであり；R 7 が、水素、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、または C 1 ~ C 4 アルコキカルボニルであり；および A 1 および A 5 がそれぞれ N である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C H、C X および N から選択され；または A 2 が C X である場合、A 1、A 3 ~ A 5 は、独立して、C H、N または C X から選択され；または A 1 が C X であり、A 5 が N である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C X および C H から選択され；または A 1 が C X であり、A 5 が C H である場合、A 2 ~ A 4 のうちの 1 つが C X であり、残りがそれぞれ C H であり；または A 1 が C X であり、A 4 が N である場合、A 2、A 3 および A 5 は、独立して、C X および C H から選択され；ここで、X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、または C 1 ~ C 4 - ハロアルキルであり；ただし、A 1 ~ A 5 のうちの 3 つ以下が N である。

【0038】

式 (I) の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、および N - オキシドの別の好ましい群において、R 1 ~ R 4 がそれぞれ水素であり；R 5 が、置換または非置換フェニルであり；R 6 が、水素または C 1 ~ C 4 - アルキルであり；R 7 が、水素、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、または C 1 ~ C 4 - アルコキカルボニルであり；A 1 が、C - ハロゲン以外であり、A 2 が N であり、A 3、A 4 および A 5 が、独立して、C X および C H から選択され；ここで、X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、または C 1 ~ C 4 - ハロアルキルである。好ましくは、この群の化合物において、A 1 が C - C 1 ~ C 4 - ハロアルキルであり、A 2 が N であり、A 3、A 4 および A 5 が、独立して、C X および C H から選択され；ここで、X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキルまたは C 1 ~ C 4 - ハロアルキルであり；好ましくは A 1 が C - C F 3 であり、A 2 が N であり、A 3、A 4 および A 5 がそれぞれ C H である。

【0039】

他の実施形態から独立した一実施形態において、X が、互いに独立して、好ましくは、臭素、塩素、フッ素、トリフルオロメチルおよびジフルオロメチルから選択され；特に、塩素、フッ素、メチルおよびトリフルオロメチルから選択される、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、または C 1 ~ C 4 - ハロアルキルである。

【0040】

式 (I) の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、および N - オキシドの別の好ましい群において、R 1 ~ R 4 がそれぞれ水素であり；R 5 が、シアノ置換フェニル（これは、ハロゲンまたはトリフルオロメチルで任意にさらに置換される）、2 - フルオロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル、2, 6 - ジフルオロ - 4 - クロロ - フェニル、2, 4 - ジフルオロフェニル、2, 4, 6 - トリフルオロフェニル、2 - フルオロ - 4 - クロロフェニル、2 - フルオロ - 4 - ブロモフェニル、2 - クロロ - 4 - フルオロフェニル、2 - クロロ - 4 - トリフルオロメチルフェニル、3, 4, 5 - トリフルオロフェニル、2, 4 - ジクロロ - 6 - フルオロフェニル、および 2,

10

20

30

40

50

4 - ジプロモフェニルから選択され；R 6 が、水素またはC 1 ~ C 4 - アルキルであり；R 7 が、水素、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、またはC 1 ~ C 4 - アルコキシカルボニルであり；A 1 がC - X であり、A 2 ~ A 5 がそれぞれC H であり；またはA 1 およびA 5 がそれぞれC - X であり、A 2 ~ A 4 がそれぞれC H であり；またはA 1 がC - X であり、A 2 およびA 5 がそれぞれN であり、A 3 およびA 4 がそれぞれC H であり；またはA 1 がC - X であり、A 2 がN であり、A 3 ~ A 5 がそれぞれC H であり、ここで、X が、独立して、ハロゲン、C ~ C 4 - アルキルまたはC - 1 ~ C 4 - ハロアルキルから選択される。好ましくはX が、A 1 ~ A 5 の配置から独立して、およびA 1 ~ A 5 の配置内のX から独立して、塩素、フッ素、トリフルオロメチルおよびジフルオロメチルから選択され；好ましい実施形態において、A 1 がC - C F 3 であり、A 2 ~ A 5 がそれぞれC H であり；またはA 1 およびA 5 がそれぞれC - F であり、A 2 ~ A 4 がそれぞれC H であり；またはA 1 が、C - C F 3 またはC 1 であり、A 2 およびA 5 がそれぞれN であり、A 3 およびA 4 がそれぞれC H であり；またはA 1 がC - C F 3 であり、A 2 がN であり、A 3 ~ A 5 がそれぞれC H である。

10

【0041】

式(I)の化合物、ならびにその許容可能な塩、鏡像異性体、ジアステレオマー、互変異性体、およびN - オキシドの別の好ましい群において、R 1 ~ R 4 がそれぞれ水素であり；R 5 が、2 , 4 - クロロフェニルであり；R 6 が、水素またはC 1 ~ C 4 - アルキルであり；R 7 が、水素、C 1 ~ C 4 - アルキルカルボニル、またはC 1 ~ C 4 - アルコキシカルボニルであり；A 1 がC - C 1 であり、A 2 ~ A 5 がそれぞれC H であり；またはA 1 がC - F であり、A 2 およびA 5 がそれぞれN であり、A 3 およびA 4 がそれぞれC H であり；またはA 1 およびA 5 がそれぞれC - C 1 またはC - C F 3 であり、A 2 ~ A 4 がそれぞれC H であり；またはA 1 が、C - F またはC - C F 3 であり、A 2 がN であり、A 3 ~ A 5 がそれぞれC H であり；またはA 1 およびA 5 がそれぞれN である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C H 、C X およびN から選択され；またはA 2 がC X である場合、A 1 、A 3 ~ A 5 は、独立して、C H 、N またはC X から選択され；またはA 1 がC X であり、A 5 がN である場合、A 2 ~ A 4 は、独立して、C X およびC H から選択され；またはA 1 がC X であり、A 5 がC H である場合、A 2 ~ A 4 のうちの1つがC X であり、残りがそれぞれC H であり；またはA 1 がC X であり、A 4 がN である場合、A 2 、A 3 およびA 5 は、独立して、C X およびC H から選択され；ここで、X が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、またはC 1 ~ C 4 - ハロアルキルである。

20

【0042】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R 5 が、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 1 ~ C 4 - アルコキシ、C 1 ~ C 4 - ハロアルコキシ、C 3 ~ C 6 - シクロアルキルから独立して選択される置換基を有する置換フェニルであり、このシクロアルキルは、非置換であるかまたは1つ以上の置換基R x で置換され、ここで、R x が、互いに独立して、ハロゲン、C 1 ~ C 4 - アルキル、およびC 1 ~ C 4 - ハロアルキルから選択される。好ましくは、R 5 におけるフェニル上の置換基が、独立して、ハロゲン、シアノ、C 1 ~ C 2 - アルキル、C 1 ~ C 2 - ハロアルキル、C 1 ~ C 2 - アルコキシ、C 1 ~ C 2 - ハロアルコキシ、および任意に置換されるC 3 ~ C 4 - シクロアルキルから選択され、置換基は、独立して、塩素、フッ素、およびトリフルオロメチルから選択され得る。

30

【0043】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R 5 が、1 ~ 3 つの置換基、好ましくは2つまたは3つの置換基、より好ましくは2つの置換基を有する置換フェニルである。

40

【0044】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R 5 におけるフェニルが、任意に置換されるフェニルまたは任意に置換されるピラゾールで置換される。好ましくは、R 5 におけるフェニルまたはピラゾール置換フェニル上の置換基が、独立して、塩素、メチル、フッ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、およびシアノから選択される。

50

【0045】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R6が、水素またはC1～C2-アルキル、好ましくは水素である。

【0046】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R7が水素である。

【0047】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1が、NまたはC-Xであり、基A2、A3、A4およびA5が、以下から選択され、(I)A2、A3およびA4がそれぞれC-Hであり、A5がNであり；(II)A2がC-Xであり、A3、A4およびA5がそれぞれC-Hであり；(III)A3がC-Xであり、A2、A4およびA5がそれぞれC-Hであり；(IV)A4がC-Xであり、A2、A3およびA5がそれぞれC-Hであり；(V)A2、A3およびA5がそれぞれCHであり、A4がNである。

10

【0048】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1およびA5がそれぞれNである場合、A2～A4は、独立して、CH、CXおよびNから選択される。

【0049】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A2がCXである場合、A1、A3～A5は、独立して、CH、NまたはCXから選択される。

20

【0050】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がCXであり、A5がNである場合、A2～A4は、独立して、CXおよびCHから選択される。

【0051】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1が、NまたはC-Xであり、A2、A3およびA4がC-Hであり、A5がNである。好ましくは、この実施形態において、A1がCXであり、A2、A3およびA4がC-Hであり、A5がNであり、A1がNであり、A2、A3およびA4がC-Hであり、A5がNである。

【0052】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1が、NまたはC-Xであり、A2がC-Xであり、A3、A4およびA5がそれぞれC-Hである。

30

【0053】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1が、NまたはC-Xであり、A3がC-Xであり、A2、A4およびA5がC-Hである。

【0054】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1が、NまたはC-Xであり、A4がC-Xであり、A2、A3およびA5がそれぞれC-Hである。

【0055】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1およびA5がNであり；残りが、独立して、C-HおよびC-Xから選択される。

【0056】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がCXであり、A2、A3およびA5がそれぞれCHであり、A4がCXである。

40

【0057】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がCXであり、A2、A3およびA5がそれぞれCHであり、A4がNである。

【0058】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がCXであり、A2、A4およびA5がそれぞれCHであり、A3がCXである。

【0059】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がCXであり、A2およびA3がそれぞれCHであり、A4がNであり、A5がCXである。

50

【0060】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1～A5のうちのいずれか1つがCXである場合、CXのXは、独立して、ハロゲン、C1～C4-アルキルおよびC1～C4-ハロアルキルから選択される。好ましくはXが、ハロゲン、C1～C2-アルキルおよびC1～C2-ハロアルキル、特に、ハロゲン、メチルおよびトリフルオロメチルなどのハロメチルである。

【0061】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がC-C1～C4-ハロアルキルであり、A2がNであり、A3、A4およびA5がそれぞれC-Hである。

【0062】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1がCXであり、A2、A3およびA4がC-Hであり、A5がNである。

【0063】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R6が、水素またはC1～C2-アルキル、好ましくは水素である。

【0064】

他の実施形態から独立した一実施形態において、R7が水素である。

【0065】

他の実施形態から独立した一実施形態において、A1～A5のCXのXが、独立して、ハロゲン、C1～C2-アルキルおよびC1～C2-ハロアルキルから選択され；好ましくは、塩素、フッ素、メチル、およびトリフルオロメチルから独立して選択される。

【0066】

一態様において、式(I)の化合物は、R1～R4がそれぞれ水素であり；R5が、置換または非置換フェニルであり；R6が、水素またはC1～C4-アルキルであり；R7が、水素、C1～C4-アルキルカルボニル、またはC1～C4-アルコキシカルボニルであり；A1がCXであり、A2およびA4がそれぞれNであり、A3およびA5がそれぞれCHであり、またはA1がCXであり、A3およびA5がそれぞれNであり、A2およびA4がそれぞれCHであり；ここで、Xが、互いに独立して、ハロゲン、C1～C4-アルキル、またはC1～C4-ハロアルキルである。

【0067】

本明細書に記載される各実施形態の好ましい実施形態において、R5が、ハロゲン、シアノ、C1～C4-ハロアルキル、C1～C4-ハロアルコキシ、および任意に置換されるC3～C6-シクロアルキルから独立して選択され；好ましくは、塩素、メチル、フッ素、トリフルオロメチル、シクロプロピル、およびシアノから独立して選択される2～3つの置換基で置換されるフェニルである。

【0068】

本明細書に記載される各実施形態の好ましい実施形態において、A1がCXであり、A2およびA5が、独立して、NおよびCHから選択され、A3およびA4がそれぞれCHであり、ここで、Xが、C1、FまたはCF3、好ましくはCF3、C1、より好ましくはCF3である。

【0069】

各実施形態から独立した特に好ましい実施形態において、A1がCXであり、A2がNであり、A3～A5がそれぞれCHであり、ここで、Xが、C1、またはCF3、好ましくはCF3、C1、より好ましくはCF3であり；またはA1がCXであり、A5がNであり、A2～A4がそれぞれCHであり、ここで、Xが、C1、FまたはCF3、好ましくはCF3、C1、より好ましくはCF3であり；またはA1がCXであり、A2およびA5がそれぞれNであり、A3およびA4がそれぞれCHであり、ここで、Xが、C1、FまたはCF3、好ましくはCF3、C1、より好ましくはCF3である。

【0070】

各実施形態から独立した、A1～A5の好ましい環は、A1がC-CF3であり、A2

10

20

30

40

50

～A5がそれぞれCHであり；またはA1がC-CF3であり、A2およびA5がそれぞれNであり、A3およびA4がそれぞれCHであり；またはA1がC-塩素であり、A2およびA5がそれぞれNであり、A3およびA4がそれぞれCHであり；またはA1およびA5がそれぞれC-フッ素であり、A2～A4がそれぞれCHである。

【0071】

式(I)の化合物は、式(II)のアミンおよび式(VIII)のアシル化剤から調製され得、式中、R1、R2、R3、R4、R5、R6、R7、A1、A2、A3、A4、およびA5が、本明細書に定義されるとおりであり、Xbが脱離基である。典型的な脱離基は、ハロゲン化物、好ましくは塩化物、およびヒドロキシルである。Xbがヒドロキシルである場合、(VIII)はカルボン酸であり、反応は、好ましくは、活性化剤によって促進される。典型的な活性化剤は、L.A.Paquette, Encyclopedia of Reagents for Organic Synthesis, Vol 3. Wiley, England, 1995 pp 1751-1754に記載されるようにDCC、EDCI、BOP、HTU、BOP-Cl、PyBOPである。式(VIII)のアシル化剤は公知であり、または当業者によって容易に調製される。

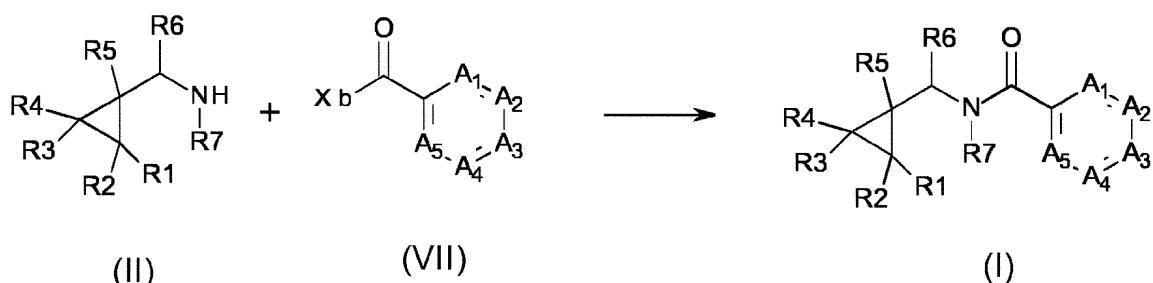
10

20

30

40

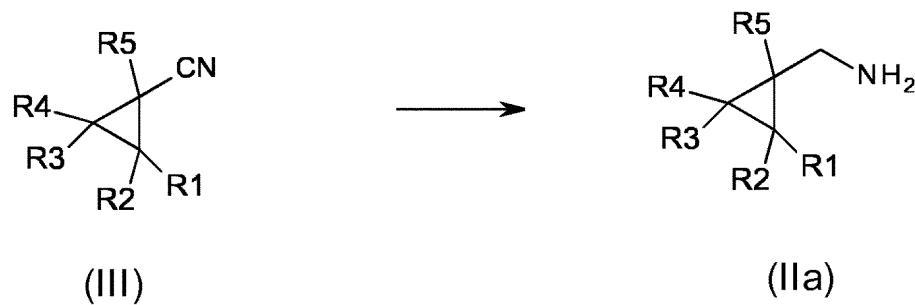
【化2】



【0072】

式(IIa)（式中、R6およびR7がHであり、R1、R2、R3、R4、およびR5が本明細書に定義されるとおりである）のアミンは、式(IIII)のニトリルを還元剤で処理することによって調製され得る。典型的な還元剤は水素である。典型的に、このような水素化は、触媒によって促進されるであろう。典型的な触媒は、金属、金属塩、または金属錯体である。他の典型的な還元剤は水素化物である。典型的な水素化物は、ホウ化水素、または水素化アルミニウムであり、その例は、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ジイソブチルアルミニウム、または水素化アルミニウムリチウムである。このような水素化物の還元は、金属塩などの他の成分の使用によって促進され得る。

【化3】

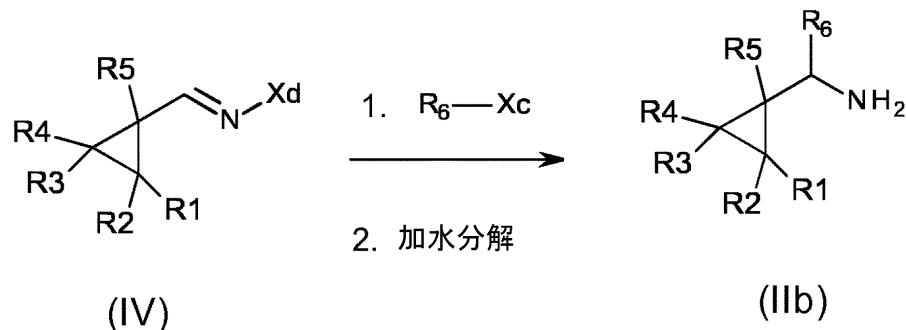


【0073】

式(IIb)（式中、R7がHであり、R1、R2、R3、R4、R5、およびR6が本明細書に定義されるとおりである）の化合物は、式(IV)のイミンを、式R6-Xcの有機金属試薬で処理した後、例えば、塩酸などの酸を用いて加水分解することによって調製され得る。Xdが、活性化基、典型的に、アシル、スルフィニルまたはスルホニル基である。Xcが、さらなるアニオンまたはリガンドと配位されていてもまたは配位されていなくてもよい金属イオンである。典型的なR6Xc試薬は、グリニヤール試薬または有機リチウム試薬である。

50

【化4】

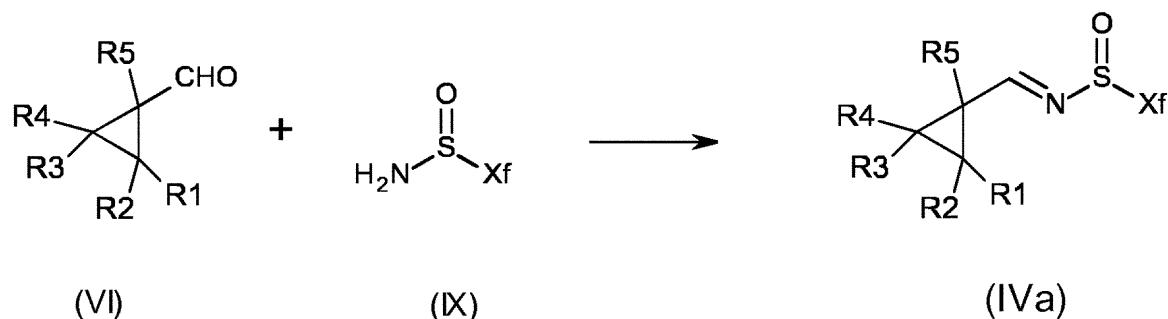


【0074】

化合物 (IVa) (式中、 X_d が $S(=O)X_f$ であり、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、および R_5 が本明細書に定義されるとおりである) は、アルデヒド (VI) および式 (IX) (式中、 X_f が、アルキルまたはアリールである) のスルフィンアミドから調製され得る。この縮合は、脱水剤の存在下で好都合に行われる。典型的な脱水剤は、塩化チタン、チタンアルコキシド、硫酸マグネシウム、または塩化カルシウムである。式 (VI) のアルデヒドは、対応するニトリル (III) またはエステルの還元によって、または対応するアルコールの酸化、例えば、スワーン酸化によって調製され得る。ニトリルまたはエステルをアルデヒドへと還元するのに使用され得る還元剤の1つは、水素化ジイソブチルアルミニウム (DIBAL) である。

20

【化5】

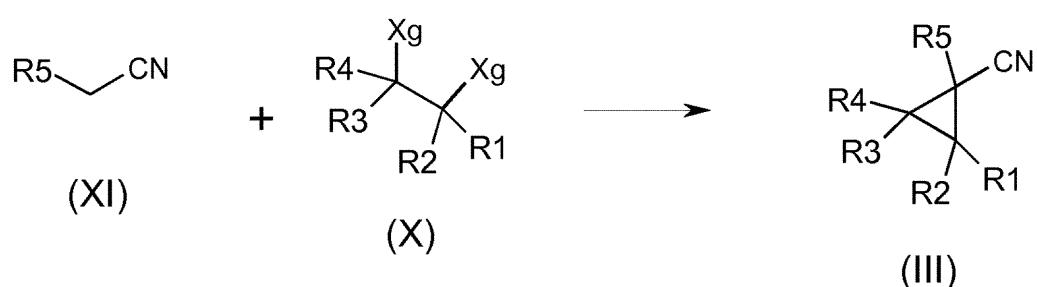


【0075】

式 (III) (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、および R_5 が本明細書に定義されるとおりである) のニトリルは、塩基の存在下で、式 (X) (式中、 R_5 が、本明細書に定義されるとおりである) のニトリルおよび式 (X) (式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、および R_4 が、本明細書に定義されるとおりであり、 X_g が脱離基である) のアルキル化剤から調製され得る。典型的な脱離基は、ハロゲン化物およびスルホネートである。

40

【化6】



【0076】

式 (I) の化合物が、基 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 A_1 、 A_2 、 A_3 、 A_4 、および A_5 の合成修飾によって、式 (I) の他の化合物へと変換され得ること

50

が明らかである。同様に、このような変換が、中間体 (II) ~ (XI) において行われ得る。

【0077】

これらの反応は、溶媒中で好都合に行われ得る。

【0078】

これらの反応は、様々な温度で好都合に行われ得る。

【0079】

これらの反応は、不活性雰囲気中で好都合に行われ得る。

【0080】

アミンのアルキル化は、式 (II) の化合物を誘導することが周知である。

10

【0081】

反応剤は、塩基の存在下で反応され得る。好適な塩基の例は、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水酸化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属水素化物、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アミド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属アルコキシド、アルカリ金属またはアルカリ土類金属酢酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ金属またはアルカリ土類金属ジアルキルアミドまたはアルカリ金属またはアルカリ土類金属アルキルシリルアミド、アルキルアミド、アルキレンジアミド、遊離またはN-アルキル化飽和または不飽和シクロアルキルアミン、塩基性複素環、水酸化アンモニウムおよび炭素環式アミンである。挙げられる例は、水酸化ナトリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、酢酸ナトリウム、炭酸ナトリウム、カリウムtert-ブトキシド、水酸化カリウム、炭酸カリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、カリウムビス(トリメチルシリル)アミド、水素化カルシウム、トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、トリエチレンジアミン、シクロヘキシリジン、N-シクロヘキシリル-N,N-ジメチルアミン、N,N-ジエチルアニリン、ピリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジン、キヌクリジン、N-メチルモルホリン、水酸化ベンジルトリメチルアンモニウムおよび1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデカ-7-エン(DBU)である。

20

【0082】

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

30

【0083】

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

40

【0084】

式 (I) の化合物は、式 (I) の出発化合物の1つ以上の置換基を、慣例的な方法で、本発明に係る他の置換基で置換することによって、式 (I) の別の化合物へと、それ自体公知の方法で転化され得る。

【0085】

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

【0086】

式 (I) の化合物の塩は、それ自体公知の方法で調製され得る。したがって、例えば、式 (I) の化合物の酸付加塩が、好適な酸または好適なイオン交換試薬による処理によって得られ、塩基による塩が、好適な塩基または好適なイオン交換試薬による処理によって得られる。塩が、農学的または生理学的な許容性 (tolerance) などの、化合物の使用のためのその許容性に応じて選択される。

50

【0087】

式(I)の化合物の塩は、例えば、好適な塩基性化合物または好適なイオン交換試薬による処理によって、遊離化合物Iの酸付加塩へと、および、例えば、好適な酸または好適なイオン交換試薬による処理によって、塩基による塩へと、慣例的な方法で転化され得る。

【0088】

式(I)の化合物の塩は、例えば塩化銀を形成する無機塩が不溶性であり、したがって反応混合物から沈殿する好適な溶媒中で、例えば、塩酸塩などの無機酸塩を、酸のナトリウム塩、バリウム塩または銀塩などの好適な金属塩、例えば酢酸銀で処理することによって、式(I)の化合物の他の塩、酸付加塩、例えば、他の酸付加塩へと、それ自体公知の方法で転化され得る。

10

【0089】

手順または反応条件に応じて、塩形成特性を有する式(I)の化合物が、遊離形態または塩の形態で得られる。

【0090】

式(I)の化合物のジアステレオマー混合物またはラセミ混合物は、どの出発材料および手順が選択されたかに応じて得られる遊離形態または塩形態で、例えば、分別結晶化、蒸留および/またはクロマトグラフィーによって、成分の物理化学的差異に基づいて、純粋なジアステレオマーまたはラセミ体へと、公知の方法で分離され得る。

20

【0091】

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

30

【0092】

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

【0093】

N-オキシドは、酸無水物、例えば無水トリフルオロ酢酸の存在下で、式(I)の化合物を、好適な酸化剤、例えばH₂O₂/尿素付加物と反応させることによって調製され得る。このような酸化は、例えば、J. Med. Chem., 32(12), 2561-73, 1989または国際公開第00/15615号パンフレットまたはC. White, Science, vol 318, p. 783, 2007といった文献から公知である。

40

【0094】

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

【0095】

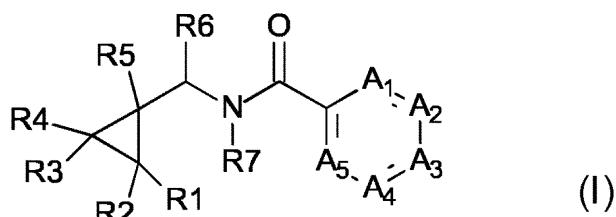
式(I)の化合物および、必要に応じて、その互変異性体は、それぞれ遊離形態または塩形態で、必要に応じて、水和物の形態で得ることもでき、および/または他の溶媒、例えば、固体形態で存在する化合物の結晶化に使用されたかもしれない溶媒を含む。

50

【 0 0 9 6 】

式 (I) の化合物の具体例が、以下の表 P に示される：

【 化 7 】



10

【 0 0 9 7 】

【 表 1 】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5
P.1	H	H	H	H		H	CH3	N	C-H	C-H	C-H	N
P.2	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-CH3	C-H	C-H	C-H
P.3	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.4	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-CH3	C-H	C-H
P.5	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-CH3	C-H	C-H
P.6	H	H	H	H		H	O-CH3	N	C-H	C-H	C-H	N

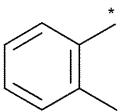
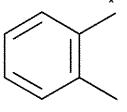
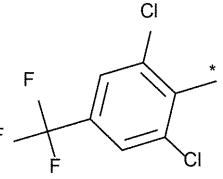
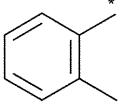
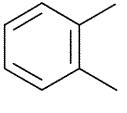
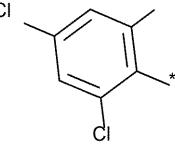
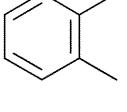
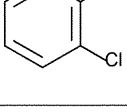
20

30

40

【 0 0 9 8 】

【表2】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.7	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.8	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-CH3	C-H
P.9	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-CH3	C-H
P.10	CH ₃	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.11	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H
P.12	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.13	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-CH3	C-H	C-H
P.14	H	H	H	H		H	アリル	N	C-H	C-H	C-H	N

【0099】

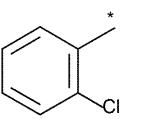
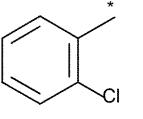
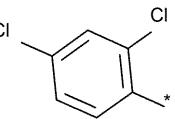
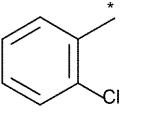
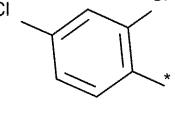
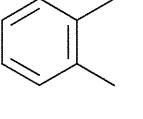
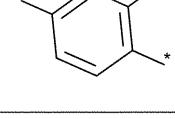
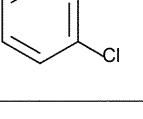
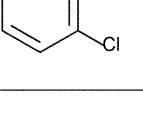
10

20

30

40

【表3】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.15	H	H	H	H		H	H	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.16	F	F	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.17	H	H	H	H		H	H	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.18	H	H	H	H		H	C(=O)-CH ₃	N	C-H	C-H	C-H	N
P.19	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.20	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-H
P.21	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.22	H	H	H	H		H	プロ バル ギル	N	C-H	C-H	C-H	N
P.23	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N

【0 1 0 0】

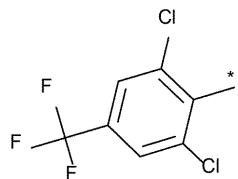
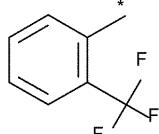
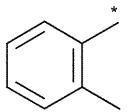
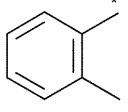
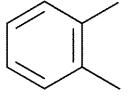
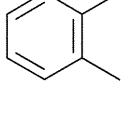
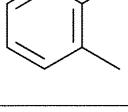
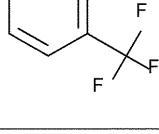
10

20

30

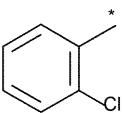
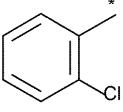
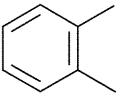
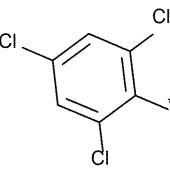
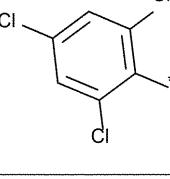
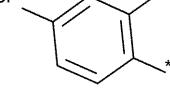
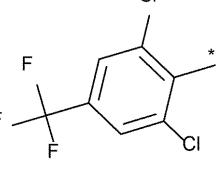
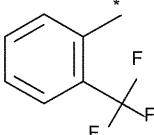
40

【表4】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.24	H	H	H	H		H	H	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.25	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.26	H	H	H	H		H	H	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.27	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-Cl	C-H	C-H
P.28	H	H	H	H		CH ₃	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.29	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.30	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H
P.31	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N

【0 1 0 1】

【表5】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.32	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H
P.33	H	H	H	H		H	CH ₂ -O-CH ₃	N	C-H	C-H	C-H	N
P.34	H	H	H	H		CH ₃	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-CH ₃	C-H
P.35	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H	C-H
P.36	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H	C-H
P.37	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.38	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H
P.39	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H	C-H

【0 1 0 2】

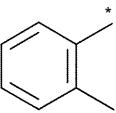
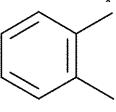
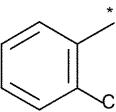
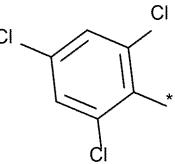
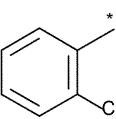
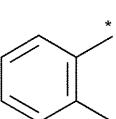
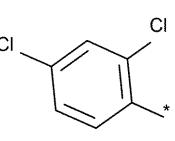
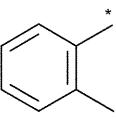
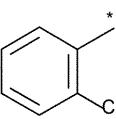
10

20

30

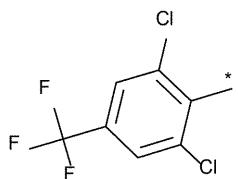
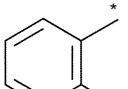
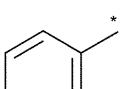
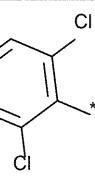
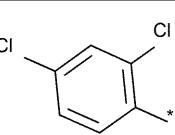
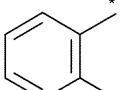
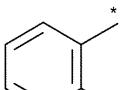
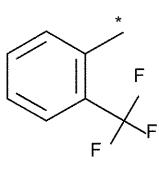
40

【表6】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5
P.40	F	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-CH3	C-H
P.41	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-CH3	C-H
P.42	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.43	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-H	N
P.44	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-CH3	C-H	C-H
P.45	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-Cl	C-H
P.46	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-CH3	C-H	C-H
P.47	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-H	N
P.48	H	H	H	H		H	CN	N	C-H	C-H	C-H	N

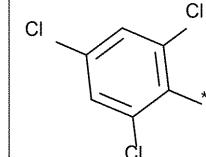
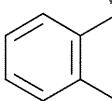
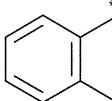
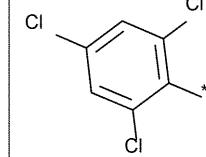
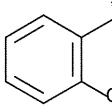
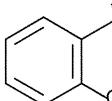
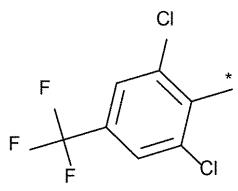
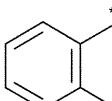
【0 1 0 3】

【表7】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.49	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.50	H	H	H	H		CH ₃	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.51	H	H	H	H		H	O-C(=O)-CH ₃	N	C-H	C-H	C-H	N
P.52	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.53	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H	
P.54	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-Cl	C-H
P.55	H	H	H	H		H	OH	N	C-H	C-H	C-H	N
P.56	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N

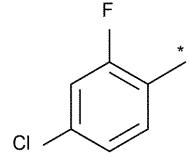
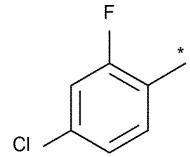
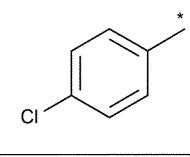
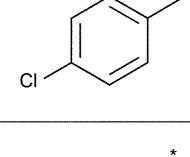
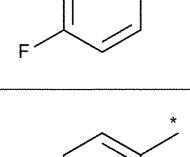
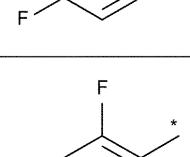
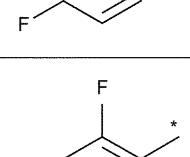
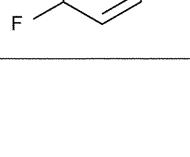
【0 1 0 4】

【表8】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.57	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H
P.58	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H	C-H
P.59	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H
P.60	H	H	H	H		H	H	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.61	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.62	H	H	H	H		H	ベンジル	N	C-H	C-H	C-H	N
P.63	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	N
P.64	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-H

【0105】

【表9】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.65	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.66	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.67	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.68	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.69	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.70	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.71	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.72	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N

【0 1 0 6】

【表10】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.73	H	H	H	H		H	シクロブロパンカルボニル	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.74	H	H	H	H		H	シクロブロポキシカルボニル	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.75	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.76	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.77	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.78	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N

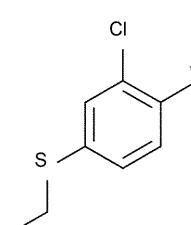
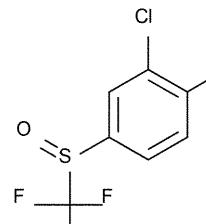
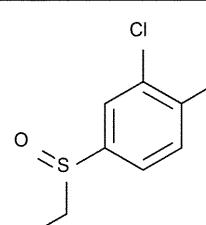
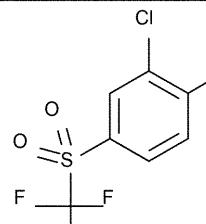
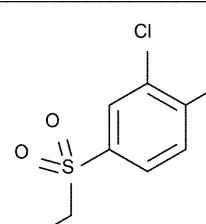
【0107】

10

20

30

【表 11】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.79	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.80	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.81	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.82	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.83	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N

【0 1 0 8】

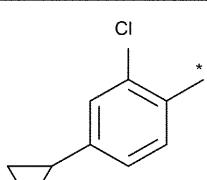
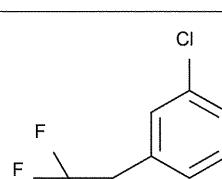
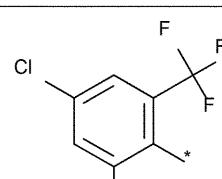
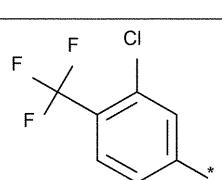
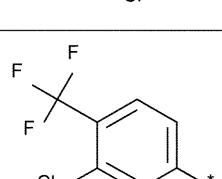
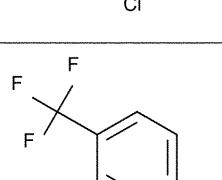
10

20

30

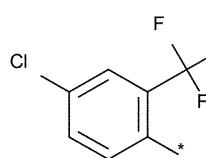
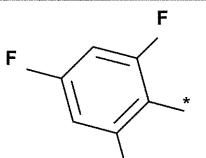
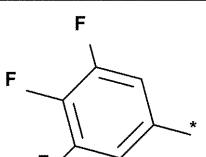
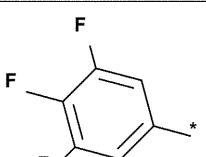
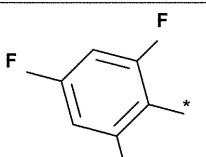
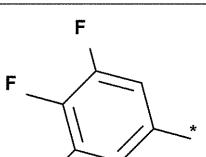
40

【表12】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.84	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.85	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.86	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.87	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.88	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N
P.89	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N

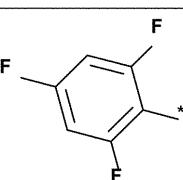
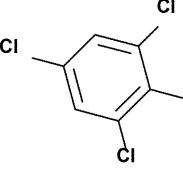
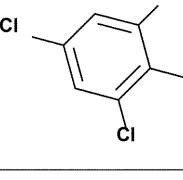
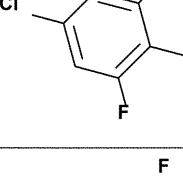
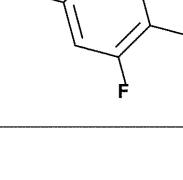
【0109】

【表13】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.90	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.91	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.92	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.93	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.94	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.95	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.96	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N

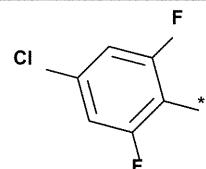
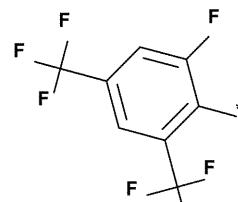
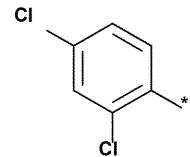
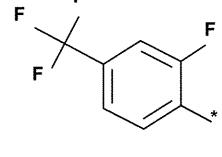
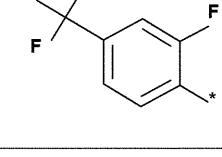
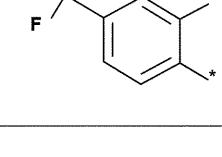
【0 1 1 0】

【表14】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.97	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N
P.98	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N
P.99	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.100	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.101	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.102	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N

【0 1 1 1】

【表 15】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.103	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.104	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.105	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.106	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.107	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.108	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N

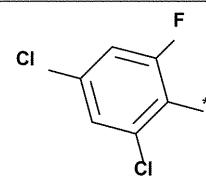
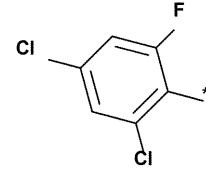
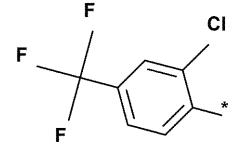
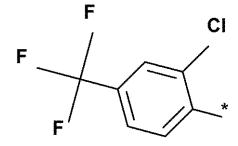
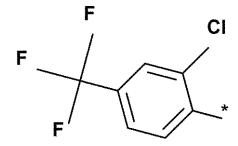
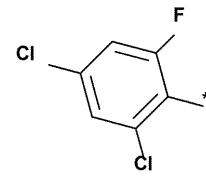
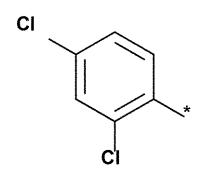
【 0 1 1 2 】

10

20

30

【表 16】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.109	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.110	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N
P.111	H	H	H	H		H	H	N	C-CF3	C-H	C-H	C-H
P.112	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.113	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N
P.114	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.115	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N

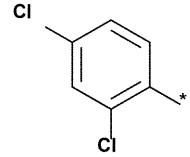
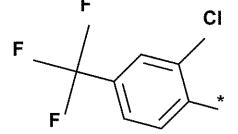
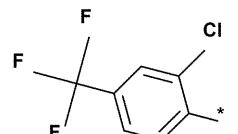
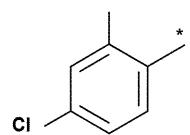
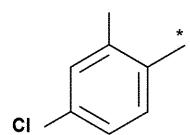
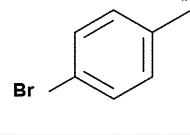
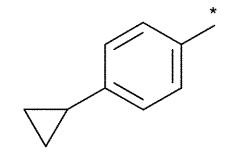
【0 1 1 3】

10

20

30

【表17】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.116	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N
P.117	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.118	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.119	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.120	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.121	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.122	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N

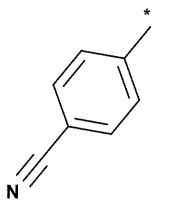
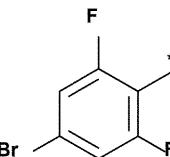
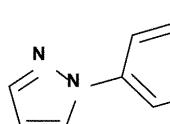
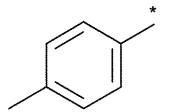
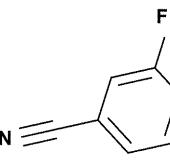
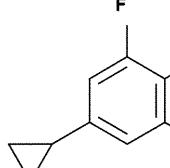
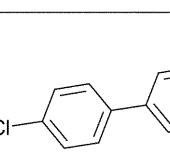
【0114】

10

20

30

【表 18】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.123	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.124	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.125	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.126	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N
P.127	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.128	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.129	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N

【0 1 1 5】

10

20

30

40

【表 19】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.130	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.131	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H
P.132	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F
P.133	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.134	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.135	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.136	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N

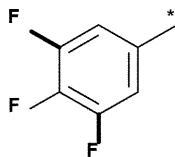
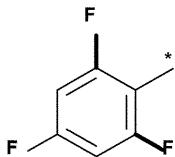
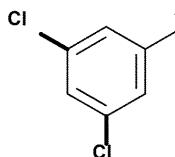
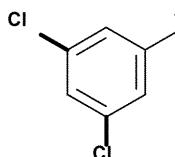
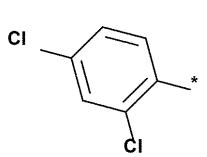
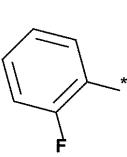
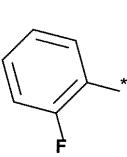
【0 1 1 6】

10

20

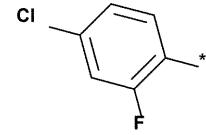
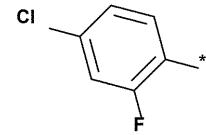
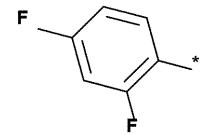
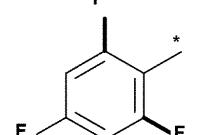
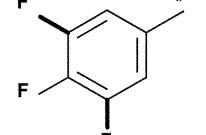
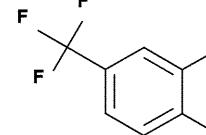
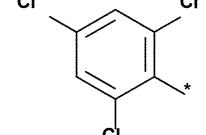
30

【表 20】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.137	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.138	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N
P.139	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N
P.140	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.141	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F
P.142	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F
P.143	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H

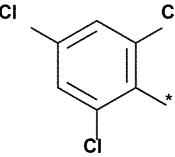
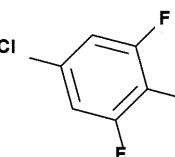
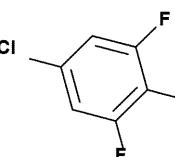
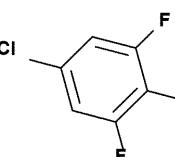
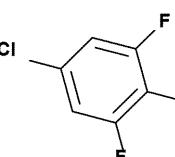
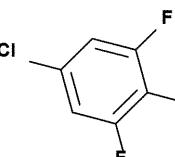
【0 1 1 7】

【表 2 1】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.144	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F
P.145	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.146	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.147	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N
P.148	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N
P.149	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.150	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H

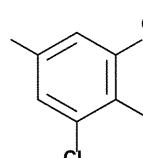
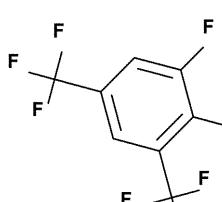
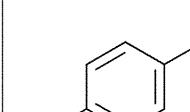
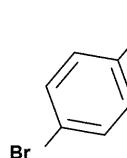
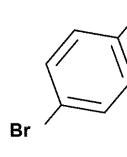
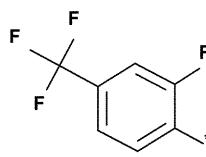
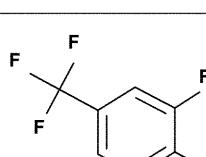
【0 1 1 8】

【表22】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.151	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N
P.152	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.153	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H
P.154	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N
P.155	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N
P.156	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F

【0 1 1 9】

【表23】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.157	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.158	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.159	H	H	H	H		H	H	C-S-CH3	C-H	C-H	C-H	N
P.160	H	H	H	H		H	H	C-SO2-CH3	C-H	C-H	C-H	N
P.161	H	H	H	H		H	H	C-SO-CH3	C-H	C-H	C-H	N
P.162	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H
P.163	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F

【0 1 2 0】

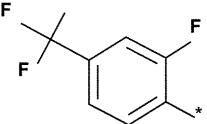
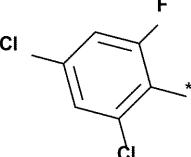
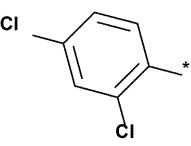
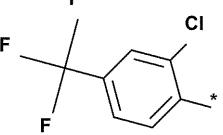
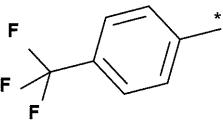
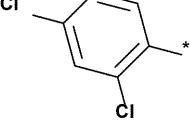
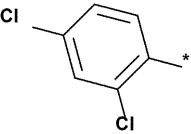
10

20

30

40

【表24】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.164	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N
P.165	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N
P.166	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N
P.167	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N
P.168	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.169	H	H	H	H		H	H	C-Br	N	C-H	C-H	C-H
P.170	H	H	H	H		H	H	C-F	N	C-H	C-H	C-H

10

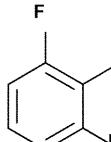
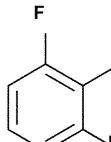
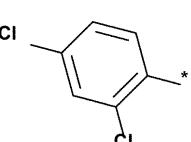
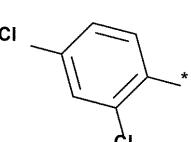
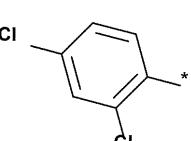
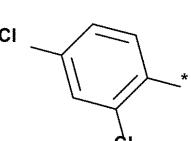
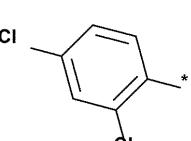
20

30

40

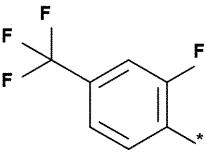
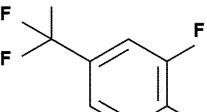
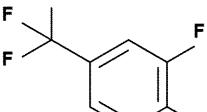
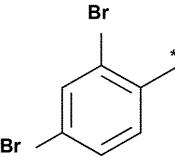
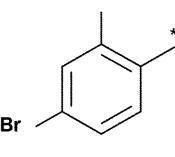
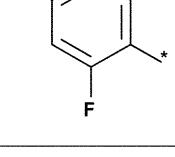
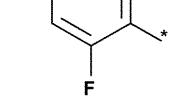
【0 1 2 1】

【表 25】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.171	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F
P.172	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H
P.173	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	N	C-H	N
P.174	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	N	C-H
P.175	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	N	N
P.176	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	N	C-H	C-H
P.177	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	N	N	C-H

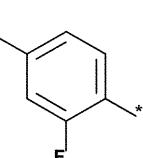
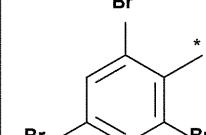
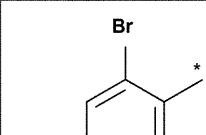
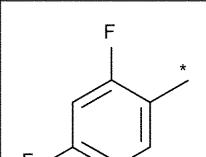
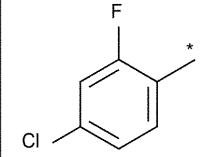
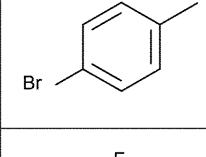
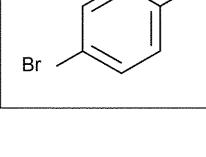
【0 1 2 2】

【表 26】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.178	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	N
P.179	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	N	C-H	N
P.180	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	N	C-H
P.181	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.182	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.183	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H
P.184	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	N

【0 1 2 3】

【表27】

	<i>R1</i>	<i>R2</i>	<i>R3</i>	<i>R4</i>	<i>R5</i>	<i>R6</i>	<i>R7</i>	<i>A1</i>	<i>A2</i>	<i>A3</i>	<i>A4</i>	<i>A5</i>
P.185	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.186	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N
P.187	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.188	Me	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.189	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.190	H	H	H	H		Me	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N
P.191	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N

【0124】

式(I)の化合物は、有害生物および/または真菌によって引き起こされる被害を防除することが分かった。

【0125】

一実施形態において、式(I)の化合物は、農業に使用され得る。

【0126】

したがって、本発明は、有害生物および/または真菌によって引き起こされる被害および/または収穫高低下を防除する方法であって、有害生物、有害生物の場所、または有害生物および/または真菌による攻撃を受けやすい植物または植物繁殖材料に、有効量の式(I)の化合物を施用する工程を含む方法にさらに関する。

10

20

30

40

50

【0127】

本発明に係る化合物は、特に植物、特に有用な植物および農業、園芸および森林における観賞植物、またはこのような植物の果実、花、茎葉、茎、塊茎、種子または根などの器官において発生する有害生物および／または真菌を防除、すなわち、抑制または破壊するのに使用され得、場合によっては、後の時点で形成される植物器官でさえ、これらの有害生物から保護されたままである。

【0128】

本発明に係る式(Ⅰ)の化合物は、低い施用量でも有害生物防除剤に耐性のある有害生物および真菌に対して使用され得る、有害生物防除の分野において予防的におよび／または治療的に有益な活性成分であり、式(Ⅰ)の化合物は、非常に好ましい殺生物スペクトルを有し、温血動物種、魚類および植物によって良好な耐容性を示される。

10

【0129】

本発明に係る化合物は、昆虫またはダニ目(*Acarina*)の代表例などの、通常の感受性の動物有害生物だけでなく、耐性がある動物有害生物の全ておよび個々の発育段階に対しても作用する。本発明に係る化合物の殺虫または殺ダニ活性は、直接、すなわち、すぐにまたはいくらかの時間が経過してから初めて、例えば脱皮中に起こる有害生物の破壊として、または間接的に、例えば、減少した産卵および／または孵化率として現れることがあり、良好な活性は、少なくとも50～60%の破壊率(致死率)に相当する。

【0130】

上記の動物有害生物の例は以下のとおりである：

20

-ダニ目(*Acarina*)から、例えば、

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

30

-シラミ目(*Anoplura*)から、例えば、

ブタジラミ属(*Haematopinus spp.*)、リノグナツス属(*Linognathus spp.*)、ペディクルス属(*Pediculus spp.*)、ペムフィグス属(*Pemphigus spp.*)およびフィロキセラ属(*Phylloxera spp.*)；

40

-鞘翅目(*Coleoptera*)から、例えば、

アグリオテス属(*Agriotes spp.*)、アンフィマロン・マジャレ(*Amph*

50

imalion majale)、セマダラコガネ(*Anomala orientalis*)、アントノムス属(*Anthonomus spp.*)、マグソコガネ属(*Aphodius spp.*)、アスチラス・アトロマクラタス(*Astylus atromaculatus*)、アテニウス属(*Ataenius spp.*)、アトマリア・リネアリス(*Atomaria linearis*)、カエトクネマ・チビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、セロトマ属(*Cerotoma spp.*)、コノデルス属(*Conoderus spp.*)、コスマポリテス属(*Cosmopolites spp.*)、コチニス・ニチダ(*Cotinis nitida*)、クルクリオ属(*Cucujus spp.*)、シクロセファラ属(*Cyclocephala spp.*)、デルメステス属(*Dermestes spp.*)、ジアブロチカ属(*Diabrotica spp.*)、アブデルスツノカブトムシ(*Diloboderus abderus*)、エピラクナ属(*Epilachna spp.*)、エレムヌス属(*Eremnus spp.*)、ヘテロニクス・アラトル(*Heteronychus arator*)、コーヒーノミキクイムシ(*Hypothenemus hampei*)、ラグリア・フィロサ(*Lagria villosa*)、コロラドハムシ(*Leptinotarsa decemlineata*)、リッソルホプトルス属(*Lissorrhopterus spp.*)、リオゲニス属(*Liogenys spp.*)、マエコラスピス属(*Maecolaspis spp.*)、アカビロウドコガネ(*Maladera castanea*)、メガセルיס属(*Megascelis spp.*)、メリゲテス・アエネウス(*Meligethes aeneus*)、メロロンタ属(*Melolontha spp.*)、マイオクロウス・アルマツス(*Myochrous armatus*)、オリカエフィルス属(*Orycaephilus spp.*)、オチオリンクス属(*Otiorrhynchus spp.*)、フィロファーガ属(*Phyllophaga spp.*)、フリクチヌス属(*Phlyctinus spp.*)、ポピリア属(*Popillia spp.*)、プシリオデス属(*Psylliodes spp.*)、リソマツス・アウブチリス(*Rhyssomatus aubtilis*)、リゾペルタ属(*Rhizopertha spp.*)、コガネムシ科(*Scarabeidae*)、シトフィルス属(*Sitophilus spp.*)、シトルガ属(*Sitotroga spp.*)、ソマチカス属(*Somaticus spp.*)、スフェノフォラス属(*Sphenophorus spp.*)、ステルネクススブ・シグナツス(*Sternechus subsignatus*)、ゴミムシダマシ属(*Tenebrio spp.*)、トリボリウム属(*Trifolium spp.*)およびトロゴデルマ属(*Trogoderma spp.*)；
- 双翅目(Diptera)から、例えば、
ヤブカ属(*Aedes spp.*)、ハマダラカ属(*Anopheles spp.*)、アンテリゴナ・ソカタ(*Anterigona soccata*)、オリーブミバエ(*Bactrocea oleae*)、ビビオ・ホルツラヌス(*Bibio hortulanus*)、ブラジシア属(*Bradyzia spp.*)、クロバエ(*Calliphora erythrocephala*)、セラチチス属(*Ceratitidis spp.*)、オビキンバエ属(*Chrysomyia spp.*)、イエカ属(*Culex spp.*)、クテレブラ属(*Cuterebra spp.*)、ダクス属(*Dacus spp.*)、デリア属(*Delia spp.*)、キイロショウジョウバエ(*Drosophil melanogaster*)、ヒメイエバエ属(*Fannia spp.*)、ガストロフィラス属(*Gastrophilus spp.*)、ゲオミザ・トリプンクタタ(*Geomyza tripunctata*)、ツェツエバエ属(*Glossina spp.*)、ヒフバエ属(*Hypoderma spp.*)、ヒッポボスカ属(*Hippoboscidae spp.*)、リリオミザ属(*Liriomyza spp.*)、キンバエ属(*Lucilia spp.*)、メラナグロミザ属(*Melanagromyza spp.*)、イエバエ属(*Musca spp.*)、ヒツジバエ属(*Oestrus spp.*)、オルセオリア属(*Orseolia spp.*)、キモグリバエ(*Oscinella fricta*)、アカザモグリハナバエ(*Pegomyia hyoscyami*)、ホル

ビア属 (*Phorbia* spp.)、ラゴレチス属 (*Rhagoletis* spp.)、リベリア・クアドリファシアタ (*Rivelia quadrifasciata*)、スカテラ属 (*Scatella* spp.)、キノコバエ属 (*Sciara* spp.)、サシバエ属 (*Stomoxys* spp.)、アブ属 (*Tabanus* spp.)、タニア属 (*Tannia* spp.) およびガガンボ属 (*Tipula* spp.);

- 半翅目 (Hemiptera) から、例えば、

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

- 同翅目 (homoptera) から、例えば、

アシルトシウム・ピスム (*Acyrthosium pisum*)、アダルゲス属 (*Adalges* spp.)、アガリアナ・エンシゲラ (*Agalliana ensiger*)、アゴノセナ・タルギオニイ (*Agonoscena targionii*)、アレウロジクス属 (*Aleurodicus* spp.)、アレウロカンツス属 (*Aleurocanthus* spp.)、アレウロロブス・バロデンシス (*Aleurolobus barodensis*)、アレウロトリクス・フロッコスス (*Aleurothrixus floccosus*)、アレイロデス・ブラシカエ (*Aleyrodes brasicae*)、フタテンミドリヨコバイ (*Amarasca biguttula*)、アムリトズス・アトキンソニ (*Amritodus atkinsoni*)、アノニジエラ属 (*Aonidiella* spp.)、アリマキ科 (Aphidiidae)、ワタアブラムシ属 (*Aphis* spp.)、アスピジオツス属 (*Aspidiotus* spp.)、ジャガイモヒゲナガアブラムシ (*Aulacorthum solani*)、バクテリセラ・コッケレリ (*Bactericera cockerelli*)、ベミシア属 (*Bemisia* spp.)、ブラキカウズス属 (*Brachycaudus* spp.)、ダイコンアブラムシ (*Brevicoryne brassicae*)、カコブシラ属 (*Cacopsylla* spp.)、ニンジンフタオアブラムシ (*Cavariella aegopodii* Scop.)、セロプラスター属 (*Ceroplasaster* sp 50

p.)、クリソムファルス・アオニジウム (*Chrysomphalus aonidium*)、オンシツマルカイガラムシ (*Chrysomphalus dictyospermii*)、シカデラ属 (*Cicadella spp.*)、シロオオヨコバイ (*Cofana spectra*)、クリプトミズス属 (*Cryptomyzus spp.*)、シカデユリナ属 (*Cicadulina spp.*)、ヒラタカタカイガラムシ (*Coccus hesperidum*)、ダルブルス・マイジス (*Dalbulus maidis*)、ジアレウロデス属 (*Dialeurodes spp.*)、ミカンキジラミ (*Diaphorina citri*)、ジウラフィス・ノキシア (*Diuraphis noxia*)、ジサフィス属 (*Dysaphis spp.*)、エンポアスカ属 (*Empoasca spp.*)、リンゴワタムシ (*Eriosoma lanigerum*)、エリスロネウラ属 (*Erythroneura spp.*)、ガスカルジア属 (*Gascardia spp.*)、グリカスピス・ブリンプレコンバイ (*Glycaspis brimblecombei*)、ヒアダフィス・シュードブラシカエ (*Hyadaphis pseudobrassicae*)、ヒアロプテルス属 (*Hyalopterus spp.*)、ヒペロミズス・パリズス (*Hyperomyzus pallidus*)、リュウガンズキンヨコバイ (*Idioscopus clypealis*)、ヤコビアスカ・リビカ (*Jacobiasca lybica*)、ラオデルファクス属 (*Laodelphax spp.*)、ミズキカタカイガラムシ (*Lecanium corni*)、レピドサフェス属 (*Lepidosaphes spp.*)、ニセダイコンアブラムシ (*Lopaphis erysimi*)、リオゲニス・マイジス (*Lyogenys maidis*)、マクロシフム属 (*Macrosiphum spp.*)、マハナルヴァ属 (*Mahanarva spp.*)、メタカルファ・ブルイノサ (*Metcalfa pruinosa*)、ムギウスイロアブラムシ (*Metopolophium dirhodum*)、ミンズス・クルズス (*Myndus crudus*)、ミズス属 (*Myzus spp.*)、ネオトキソプテラ属 (*Neotoxoptera sp.*)、ツマグロヨコバイ属 (*Nephoptix spp.*)、ニラバルバタ属 (*Nilaparvata spp.*)、ナシミドリオオアブラムシ (*Nippolachnus piri Mats*)、オドナスピス・ルタエ (*Odontaspis ruthae*)、オレグマ・ラニゲラ・ゼンター (*Orgyema lanigera Zehnter*)、ヤマモモコナジラミ (*Parabemisia myricae*)、パラトリオザ・コッケレリ (*Paratrioza cockerelli*)、パルラトリア属 (*Parlatoria spp.*)、ペムフィグス属 (*Pemphigus spp.*)、トウモロコシウンカ (*Peregrinus maidis*)、ペルキンシエラ属 (*Perkinsiella spp.*)、ホップイボアブラムシ (*Phorodon humuli*)、フィロキセラ属 (*Phylloxera spp.*)、プラノコッカス属 (*Planococcus spp.*)、シューダウラカスピス属 (*Pseudaulacaspis spp.*)、シュードコッカス属 (*Pseudococcus spp.*)、ワタノミハムシ (*Pseudatomoscelis seriatus*)、ブシラ属 (*Psylla spp.*)、ブルビナリア・エチオピカ (*Pulvinaria aethiopica*)、クアドラズピジオツス属 (*Quadrastriotus spp.*)、クエサダ・ギガス (*Quesada gigas*)、イナズマヨコバイ (*Recilia dorsalis*)、ロパロシフム属 (*Rhopalosiphum spp.*)、サイセチア属 (*Saissetia spp.*)、スカホイデウス属 (*Scaphoideus spp.*)、スチザフィス属 (*Schizaphis spp.*)、シトビオン属 (*Sitobion spp.*)、セジロウンカ (*Sogatella furcifera*)、スピシスチルス・フェスチヌス (*Spissistilus festinus*)、タロファガス・プロセルピナ (*Tarophagus Proserpina*)、トキソプテラ属 (*Toxoptera spp.*)、トリアレウロデス属 (*Trialeurodes spp.*)、トリジスカス・スボロボリ (*Triodiscus sporoboli*)、トリオニムス属 (*Trionymus spp.*)、ミカントガリキジラミ (*Triozae erytreae*)、ニセヤノネ

10

20

30

40

50

カイガラムシ (*Unaspis citri*)、ジギナ・フラミゲラ (*Zygina flammigera*)、ジギニジア・スクテラリス (*Zyginiidia scutellaris*)；

- 膜翅目 (*Hymenoptera*) から、例えば、

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

- 等翅目 (*Isoptera*) から、例えば、

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

- 鱗翅目 (*Lepidoptera*) から、例えば、

アクレリス属 (*Acleris spp.*)、アドキソフィエス属 (*Adoxophyes spp.*)、アエゲリア属 (*Aegeria spp.*)、アグロティス属 (*Agronitis spp.*)、アラバマ・アルギラセア (*Alabama argillacea*)、アミロイス属 (*Amylois spp.*)、アンチカルシア・ゲマタリス (*Anticarsia gemmatalis*)、アルチップス属 (*Archips spp.*)、アルギレスチア属 (*Argyresthia spp.*)、アルギロタエニア属 (*Argyrotaenia spp.*)、アウトグラファ属 (*Autographa spp.*)、ブックラトリクス・ツルベリエラ (*Bucculatrix thurberella*)、アフリカズイム (*Busseola fusca*)、スジマラダメイガ (*Cadra cautella*)、モモシンクイガ (*Carposina nipponeensis*)、チロ属 (*Chilo spp.*)、コリストネウラ属 (*Choristoneura spp.*)、クリソテウチア・トピアリア (*Chrysoteuchia topiaria*)、ブドウホソハマキ (*Clytia ambigua*)、クナファロクロシス属 (*Cnaphalocrociis spp.*)、クネファシア属 (*Cnephasia spp.*)、コチリス属 (*Cochylis spp.*)、コレオフォラ属 (*Coleophora spp.*)、コリアス・レスビア (*Colias lesbia*)、ワタアカキリバ (*Cosmophila flava*)、クラムバス属 (*Crambus spp.*)、ケブカノメイガ (*Crocidolomia binotata*)、クリプトフレビア・ロイコトレタ (*Cryptophlebia leucotreta*)、シダリマ・ペルスペクタリス (*Cydalima perspectalis*)、シジア属 (*Cydia spp.*)、ジアファニア・ペルスペクタリス (*Diaphania perspectalis*)、ジアトラエア属 (*Diatraea spp.*)、ジパロブシス・カスタネア (*Diparopsis castanea*)、エアリアス属 (*Earias spp.*)、エルダナ・サッカリナ (*Eldana saccharina*)、エフェスチア属 (*Ephestia spp.*)、エピノチア属 (*Epinotia spp.*)、エスチグメネ・アクレア (*Estigmene acrea*)、エチエラ・ジンキネラ (*Etiella zinckinella*)、ユーコスマ属 (*Eucosma spp.*)、ブドウホソハマキ (*Eupoecilia ambiguella*)、ユープロクチス属 (*Euproctis spp.*)、ユークソア属 (*Euxo*

10

20

30

40

50

a spp.)、フェルチア・ジャクリフェリア (*Feltia jaculifera*)、グラホリタ属 (*Grapholita spp.*)、ヘディア・ヌビフェラナ (*Hedya nubiferana*)、ヘリオティス属 (*Heliothis spp.*)、ハイマダラノメイガ (*Helula undalis*)、ヘルペトグラマ属 (*Herpetogramma spp.*)、アメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*)、ケイフェリア・リコペルシセラ (*Keiferia lycopersicella*)、モロコシマダラメイガ (*Lasmocephalus lignosellus*)、レウコプテラ・シテラ (*Leucoptera scitella*)、リトコレチス属 (*Lithocolethis spp.*)、ホソバヒメハマキ (*Lobesia botrana*)、ロキソステゲ・ビフィダリス (*Loxostege bifidalis*)、リマントリア属 (*Lymantria spp.*)、リオネチア属 (*Lyonetia spp.*)、マラコソマ属 (*Malacosoma spp.*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タバコスズメガ (*Manduca sexta*)、ミチムナ属 (*Mythimna spp.*)、ノクトゥア属 (*Noctua spp.*)、オペロフテラ属 (*Operophtera spp.*)、オルニオデス・インディカ (*Orniodes indica*)、アワノメイガ (*Ostrinia nubilalis*)、パメネ属 (*Pammene spp.*)、パンデミス属 (*Pandemis spp.*)、マツキリガ (*Panolis flammea*)、パパイベマ・ネブリス (*Papaipema nebris*)、ワタアカミムシ (*Pectinophora gossypiella*)、コーヒーハモグリバエ (*Perileucoptera coffeeella*)、シユーダレチア・ウニブンクタ (*Pseudalecia unipuncta*)、ジャガイモガ (*Phthorimaea operculella*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae*)、ピエリス属 (*Pieris spp.*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、プレイス属 (*Prays spp.*)、シードブルシア属 (*Pseudoplusia spp.*)、ラキブルシア・ヌ (*Rachiplusia nu*)、リチア・アルビコスタ (*Richia albicosta*)、シルポファガ属 (*Scirpophaga spp.*)、セサミア属 (*Sesamia spp.*)、スバルガノチス属 (*Sparganothis spp.*)、ス Podoptera spp.)、シレプタ・デロガテ (*Sylepta derogata*)、シナンテドン属 (*Synanthedon spp.*)、タウメトポエア属 (*Thaumetopoea spp.*)、トルトリックス属 (*Tortrix spp.*)、イラクサギンウワバ (*Trichoplusia ni*)、トマトキバガ (*Tuta absoluta*)、およびスガ属 (*Yponomeuta spp.*)；
- 食毛目 (*Mallophaga*) から、例えば、
ダマリネア属 (*Damalinea spp.*) およびケモノハジラミ属 (*Trichodectes spp.*)；
- 直翅目 (*Orthoptera*) から、例えば、
ゴキブリ属 (*Blatta spp.*)、チャバネゴキブリ属 (*Blattella spp.*)、ケラ属 (*Gryllotalpa spp.*)、マデラゴキブリ (*Leucophaea maderae*)、トノサマバッタ属 (*Locusta spp.*)、ネオクルチラ・ヘキサダクチラ (*Neocurtilla hexadactyla*)、ワモンゴキブリ属 (*Periplaneta spp.*)、スカブテリスカス属 (*Scapteriscus spp.*)、およびコオロギ属 (*Schistocerca spp.*)；
- チャタテムシ目 (*Psocoptera*) から、例えば、
リボセリス属 (*Liposcelis spp.*)；
- ノミ目 (*Siphonaptera*) から、例えば、
ナガノミ属 (*Ceratophyllus spp.*)、イヌノミ属 (*Ctenocephalides spp.*) およびケオプスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*)；

10

20

30

40

50

- 総翅目 (Thysanoptera) から、例えば、カリオトリップス・ファセオリ (Calliothrips phaseoli) 、ハナアザミウマ属 (Frankliniella spp.) 、ヘリオトリップス属 (Heliothrips spp.) 、ヘルシノトリップス属 (Hercinothrips spp.) 、パルテノトリップス属 (Parthenothrips spp.) 、シルトトリップス・アウランティ (Scirtothrips aurantii) 、ダイズアザミウマ (Sericothrips variabilis) 、タエニオトリップス属 (Taeniothrips spp.) 、アザミウマ属 (Thrips spp.) ; - シミ目 (Thysanura) から、例えば、セイヨウシミ (Lepisma saccharina)。

10

【0131】

さらなる態様において、本発明はまた、植物病原性微生物による有用な植物の感染を防除または予防する方法に関するもので、ここで、式 (I) の化合物が、植物、植物の部分または植物の場所に活性成分として施用される。本発明に係る式 (I) の化合物は、活性により、植物による良好な耐容性を示すことにより、および環境上安全であることにより区別される。これらの化合物は、非常に有用な治療性、予防性および浸透性 (systemic property) を有し、多くの有用な植物を保護するのに使用される。式 (I) の化合物は、異なる有用な植物の植物または植物の部分 (果実、花、葉、茎、塊茎、根) において発生する病害を阻害または破壊するのに使用され得ると同時に、例えば植物病原性微生物から、後に成長する植物の部分も保護する。土壌において発生する真菌感染症からならびに植物病原性真菌からの保護のための、植物繁殖材料、特に、種子 (果実、塊茎、穀粒) および植物の挿し木 (例えばイネ) の処理のための粉衣剤 (dressing agent) として式 (I) の化合物を使用することも可能である。

20

【0132】

真菌の例としては、不完全菌綱 (Fungi imperfecti) (例えば、ボトリチス属 (Botrytis) 、ピリキュラリア属 (Pyricularia) 、ヘルミントスポリウム属 (Helminthosporium) 、フザリウム属 (Fusarium) 、セプトリア属 (Septoria) 、セルコスコラ属 (Cercospora) およびアルテルナリア属 (Alternaria)) ; 担子菌綱 (Basidiomycetes) (例えば、リゾクトニア属 (Rhizoctonia) 、ヘミレイア属 (Hemileia) 、ブッシニア属 (Puccinia)) ; 子囊菌綱 (Ascomycetes) (例えば、ベンチュリア属 (Venturia) およびエリシフェ属 (Erysiphe) 、ボドスフェラ属 (Podosphaera) 、モニリニア属 (Monilia) 、ウンキヌラ属 (Uncinula)) ; 卵菌綱 (Oomycetes) (例えば、フィトフトラ属 (Phytophthora) 、ピチウム属 (Pythium) 、プラスモパラ属 (Plasmopara)) ; 接合菌綱 (Zygomycetes) (例えば、リゾpus属 (Rhizopus spp.)) ; ファコプソラ科 (Phakopsoraceae) 、特に、ファコプソラ属 (Phakopsora) のもの、例えば、アジア型ダイズサビとも呼ばれるファコプソラ・パチリジ (Phakopsora pachyrhizi) 、およびブッシニア科 (Pucciniaceae) のもの、特に、穀物植物の問題の病害である茎サビまたは黒サビとしても知られているブッシニア・グラミニス (Puccinia graminis) および、褐サビとしても知られているブッシニア・レコンジタ (Puccinia recondita) などのブッシニア属 (Puccinia) のものが挙げられる。

30

【0133】

本発明に係る方法によって保護される植物およびこれらの植物の可能な病害の中でも特に、以下のものが挙げられる :

- コムギ、以下の種子の病害の防除に関するもの : フザリア (fusaria) (ミクロドキウム・ニバーレ (Microdochium nivale) およびフザリウム・ロゼウム (Fusarium roseum)) 、黒穂病 (チレチア・カリエス (Tilletia

40

50

ia caries)、チレチア・コントロベルサ (*Tilletia controversa*) またはチレチア・インディカ (*Tilletia indica*))、セプトリア病 (*Septoria disease*) (セプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*)) および裸黒穂病 ;

- コムギ、植物の地上部の以下の病害の防除に関して : 穀物眼紋病 (*cereal ey espot*) (タペシア・ヤルンダエ (*Tapesia yallundae*)、タペシア・アクイフォルミス (*Tapesia acuiformis*))、立枯病 (立枯病菌 (*Gaeumannomyces graminis*))、赤かび病 (*foot blight*) (*F. culmorum*)、*F. graminearum*))、黒斑病 (*black speck*) (リゾクトニア・セレアリス (*Rhizoctonia cerealis*))、うどん粉病 (エリシフェ・グラミニス分化型トリチシ (*Erysiphe graminis forma specie tritici*))、さび病 (ブッшинニア・ストリイフォルミス (*Puccinia striiformis*) およびブッшинニア・レコンジタ (*Puccinia recondita*)) およびセプトリア病 (セプトリア・トリチシ (*Septoria tritici*) およびセプトリア・ノドルム (*Septoria nodorum*)) ;

- コムギおよびオオムギ、細菌病およびウイルス病の防除に関して、例えば、オオムギ縞萎縮病 (*barley yellow mosaic*) ;

- オオムギ、以下の種子の病害の防除に関して : 網斑病 (ピレノフォラ・グラミニア (*Pyrenophora graminea*)、ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) およびコクリオボルス・サティブス (*Cochliobolus sativus*))、裸黒穂病 (ウスティラゴ・ヌーダ (*Ustilago nuda*)) およびフザリア (*fusaria*) (ミクロドキウム・ニバーレ (*Microdochium nivale*) およびフザリウム・ロゼウム (*Fusarium roseum*)) ;

- オオムギ、植物の地上部の以下の病害の防除に関して : 穀物眼紋病 (タペシア・ヤルンダエ (*Tapesia yallundae*))、網斑病 (ピレノフォラ・テレス (*Pyrenophora teres*) およびコクリオボルス・サティブス (*Cochliobolus sativus*))、うどん粉病 (エリシフェ・グラミニス分化型ホルベイ (*Erysiphe graminis forma specie hordei*))、小さび病 (ブッшинニア・ホルベイ (*Puccinia hordei*)) および葉枯病 (リンコスボリウム・セカリス (*Rhynchosporium secalis*)) ;

- ジャガイモ、塊茎の病害の防除に関して (特に、ヘルミントスボリウム・ソラニ (*Helminthosporium solani*)、フォーマ・ツベローサ (*Phoma tuberosa*)、紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、フザリウム・ソラニ (*Fusarium solani*))、うどん粉病 (フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)) および特定のウイルス (ウイルスY) ;

- ジャガイモ、以下の茎葉の病害の防除に関して : 夏疫病 (アルテナリア・ソラニ (*Alternaria solani*))、うどん粉病 (フィトフトラ・インフェスタンス (*Phytophthora infestans*)) ;

- ワタ、種子から成長した幼植物の以下の病害の防除に関して : 立枯病および頸領腐れ (*collar rot*) (紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)、フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*)) および黒根腐病 (チエラビオプシス・バシコラ (*Thielaviopsis basicola*)) ;

- タンパク質産生植物、例えば、エンドウマメ、以下の種子の病害の防除に関して : 炭疽病 (アスコキタ・ピシ (*Ascochyta pisii*)、ミコスフェレラ・ピノデス (*Mycosphaerella pinodes*))、フザリウム (*fusaria*) (フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*))、灰色かび病 (ボツリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*)) およびうどん粉病 (

10

20

30

40

50

ペロノスポラ・ピシ (*Peronospora pisii*) ;

- 油料植物 (oil - bearing plant) 、例えば、ナタネ、以下の種子の病害の防除に関して: フォーマ・リンガム (*Phoma lingam*) 、アルテルナリア・ブラシカエ (*Alternaria brassicae*) およびスクレロティニア・スクレロティオラム (*Sclerotinia sclerotiorum*) ;

- トウモロコシ、種子の病害の防除に関して: (リゾpus属 (*Rhizopus* sp.) 、ペニシリウム属 (*Penicillium* sp.) 、トリコデルマ属 (*Trichoderma* sp.) 、アスペルギルス属 (*Aspergillus* sp.) 、およびイネ馬鹿苗病菌 (*Gibberella fujikuroi*) ;

- アマ、以下の種子の病害の防除に関して: アルテルナリア・リニコラ (*Alternaria linicola*) ;

- 森林樹、立枯病 (フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) 、紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)) の防除に関して;

- イネ、地上部の以下の病害の防除に関して: 脳枯病 (マグナポルテ・グリセア (*Magnaporthe grisea*)) 、紋枯病 (bordered sheath spot) (紹枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)) ;

- マメ科植物、種子または種子から成長した幼植物の以下の病害の防除に関して: 立枯病および頸領腐れ (フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) 、フザリウム・ロゼウム (*Fusarium roseum*) 、紋枯病菌 (*Rhizoctonia solani*) 、ピチウム属 (*Pythium* sp.)) ;

- マメ科植物、地上部の以下の病害の防除に関して: 灰色かび病 (ボツリティス属 (*Botrytis* sp.)) 、うどん粉病 (特に、エリシフェ・シコラセアラム (*Erysiphe cichoracearum*) 、スフェロテカ・フリギニエ (*Sphaerotheca fuliginea*) およびレヴェイルラ・タウリカ (*Leveillula taurica*)) 、フザリア (*fusaria*) (フザリウム・オキシスポルム (*Fusarium oxysporum*) 、フザリウム・ロゼウム (*Fusarium roseum*)) 、斑点病 (クラドスポリウム属 (*Cladosporium* sp.)) 、アルテルナリア斑点病 (*Alternaria leaf spot*) (アルテルナリア属 (*Alternaria* sp.)) 、炭疽病 (コレトトリカム属 (*Colletotrichum* sp.)) 、セプトリア斑点病 (*Septoria leaf spot*) (セプトリア属 (*Septoria* sp.)) 、黒斑病 (紹枯病菌 (*Rhizoctonia solani*)) 、うどん粉病 (例えはブレミア・ラクチュカ (*Bremia lactucae*) 、ペロノスポラ属 (*Peronospora* sp.) 、シュードペルノスボラ属 (*Pseudoperonospora* sp.) 、フィトフトラ属 (*Phytophthora* sp.)) ;

- 果樹、地上部の病害に関して: モニリア病 (モニリア・フルクチゲナ (*Monilia fructigenae*) 、M. ラクサ (*M. laxa*)) 、瘡痂病 (ベンチュリア・イナクアリス (*Venturia inaequalis*)) 、うどん粉病 (ポドスファエラ・リューコトリカ (*Podosphaera leucotricha*)) ;

- つる植物、茎葉の病害に関して: 特に、灰色かび病 (ボツリティス・シネレア (*Botrytis cinerea*)) 、うどん粉病 (ウンキヌラ・ネカトル (*Uncinula necator*)) 、黒腐病 (black root) (ギグナルディア・ビウェリ (*Guignardia biwelli*)) およびうどん粉病 (プラスモバラ・ヴィティコラ (*Plasmopara viticola*)) ;

- ビート (beetroot) 、地上部の以下の病害に関して: サーコスボラ葉枯病 (*Cercospora blight*) (サーコスボラ・ベティコラ (*Cercospora beticola*)) 、うどん粉病 (エリシフェ・ベティコラ (*Erysiphe beticola*)) 、斑点病 (ラムラリア・ベティコラ (*Ramularia beticola*)) 。

本発明に係る殺真菌剤組成物はまた、木材の表面または内部で発生しやすい真菌病に対して使用され得る。「木材」という用語は、あらゆるタイプの種類の木材、および建設用にこの木材を加工したあらゆるタイプのもの、例えば、無垢材、高密度木材、積層木材、および合板を意味する。本発明に係る木材を処理するための方法は、主に、本発明の1つ以上の化合物、または本発明に係る組成物を接触させることにあり；これは、例えば、直接の塗布、噴霧、浸漬、注入または任意の他の好適な手段を含む。

【0135】

さらなる態様において、本発明は、植物寄生性線虫（内部寄生性、半内部寄生性および外部寄生性線虫）、特に、ネコブセンチュウ、キタネコブセンチュウ（*Meloiodogyne hapla*）、サツマイモコブセンチュウ（*Meloiodogyne incognita*）、ジャワネコブセンチュウ（*Meloiodogyne javanica*）、アレナリアネコブセンチュウ（*Meloiodogyne arenaria*）および他のメロイドギネ属（*Meloiodogyne*）種；シスト形成センチュウ、ジャガイモシストセンチュウ（*Globodera rostochiensis*）および他のグロボデラ属（*Globodera*）種；ムギシストセンチュウ（*Heterodera avenae*）、ダイズシストセンチュウ（*Heterodera glycines*）、テンサイシストセンチュウ（*Heterodera schachtii*）、クローバシストセンチュウ（*Heterodera trifolii*）、および他のヘテロデラ属（*Heterodera*）種；タネコブセンチュウ、アンギナ属（*Anguina*）種；クキセンチュウおよびハセンチュウ、アフェレンコイデス属（*Aphelelenchoides*）種；刺毛センチュウ（*Sting nematode*）、ベロノライムス・ロンギカウダツス（*Eelolonolaimus longicaudatus*）および他のベロノライムス属（*Belolonolaimus*）種；マツセンチュウ、マツノザイセンチュウ（*Bursaphelenchus xylophilus*）および他のバーサフェレンカス属（*Bursaphelenchus*）種；ワセンチュウ（*Ring nematode*）、クリコネマ属（*Criconema*）種、クリコネメラ属（*Criconemella*）種、クリコネモイデス属（*Criconemoide*s）種、メソクリコネマ属（*Mesocriconema*）種；クキおよびリンケイセンチュウ、イモグサレセンチュウ（*Ditylenchus destructor*）、ナミクキセンチュウ（*Ditylenchus dipsaci*）および他のジチレンクス属（*Ditylenchus*）種；キリセンチュウ（*Awl nematode*）、ドリコドルス属（*Dolichodorus*）種；ラセンセンチュウ（*Spiral nematode*）、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス（*Helicocotylenchus multicinctus*）および他のヘリオコチレンクス属（*Helicotylenchus*）種；サヤセンチュウおよびサヤワセンチュウ（*Sheath and sheathoid nematode*）、ヘミシクリオホラ属（*Hemicycliophora*）種およびヘミクリコネモイデス属（*Hemicriconemoide*s）種；ヒルスマニエラ属（*Hirshmanniella*）種；ヤリセンチュウ（*Lance nematode*）、ホプロライムス（*Hoploaimus*）種；ニセネコブセンチュウ、ナコブス属（*Nacobbus*）種；ハリセンチュウ（*Needle nematode*）、ロンギドルス・エロンガツス（*Longidorus elongatus*）および他のロンギドルス属（*Longidorus*）種；ピンセンセンチュウ（*Pin nematode*）、パラチレンクス属（*Pratylenchus*）種；ネグサレセンチュウ（*Lesion nematode*）、ムギネグサレセンチュウ（*Pratylenchus neglectus*）、キタネグサレセンチュウ（*Pratylenchus penetrans*）、プラチレンクス・カービタツス（*Pratylenchus curvitatus*）、プラチレンクス・ゴオデイ（*Pratylenchus goodeyi*）および他のプラチレンクス属（*Pratylenchus*）種；ネモグリセンセンチュウ（*Burrowing nematode*）、バナナネモグリセンセンチュウ（*Radopholus similis*）および他のラドホルス属（*Radopholus*）種；ニセフクロセンチュウ

ウ (*Reniform nematode*) 、ロチレンクス・ロブスタス (*Rotylenchus robustus*) 、ロチレンクス・レニフォルミス (*Rotylenchus reniformis*) および他のロチレンクス属 (*Rotylenchus*) 種 ; スクテロネマ属 (*Scutellonema*) 種 ; ユミハリセンチュウ (*Stubby root nematode*) 、トリコドルス・プリミチブス (*Trichodorus primitivus*) および他のトリコドルス属 (*Trichodorus*) 種、パラトリコドルス属 (*Paratrichodorus*) 種 ; イシュクセンチュウ (*Stunt nematode*) 、ナミイシュクセンチュウ (*Tylenchorhynchus claytoni*) 、チレンコリンクス・デュビウス (*Tylenchorhynchus dubius*) および他のチレンコリンクス (*Tylenchorhynchus*) 種 ; ミカンセンチュウ (*Citrus nematode*) 、チレンクルス属 (*Tylenchulus*) 種 ; オオハリセンチュウ (*Dagger nematode*) 、キシフィネマ属 (*Xiphinema*) 種などの植物寄生性線虫 ; ならびにスバンギナ属 (*Subanguina spp.*) 、ヒプソペリン属 (*Hypsoperine spp.*) 、マクロポストニア属 (*Macroposthonia spp.*) 、メリニウス属 (*Melinius spp.*) 、 punctodera属 (*Punctodera spp.*) 、およびキニスルシウス属 (*Quininsulcious spp.*) などの他の植物寄生性線虫種による植物および植物の部分への被害を防除する方法にも関する。

【 0136 】

本発明の化合物は、軟体動物に対する活性も有し得る。軟体動物の例としては、例えば 20 、リンゴガイ科 (*Ampullariidae*) ; アリオン属 (*Arion*) (*A. ater* (*A. ater*) 、 *A. サーカムスクリプツス* (*A. circumscriptus*) 、 *A. ホルテンシス* (*A. hortensis*) 、 *A. ルーフス* (*A. rufus*)) ; ブラジバエナ属 (*Bradybaenidae*) (ブラジバエナ・フルチクム (*Bradybaena fruticum*)) ; セパエア属 (*Cepaea*) (*C. ホルテンシス* (*C. hortensis*) 、 *C. ネモラリス* (*C. nemoralis*)) ; コクロディナ属 (*Cochlodina*) ; デロセラス属 (*Deroceras*) (*D. アグレスティス* (*D. agrestis*) 、 *D. エムピリコルム* (*D. empiricorum*) 、 *D. リーブ* (*D. laeve*) 、 *D. レチキュラタム* (*D. reticulatum*)) ; ディスカス属 (*Discus*) (*D. ロツンダツス* (*D. rotundatus*)) ; ユーオムファリア属 (*Euomphalia*) ; ガルバ属 (*Galba*) (*G. トランキュラタ* (*G. trunculata*)) ; ヘリセラ属 (*Helicella*) (*H. イタラ* (*H. itala*) 、 *H. オブヴィア* (*H. obvia*)) ; マイマイ科 (*Helicidae*) のヘリシゴナ・アルブストルム (*Helicigona arbustorum*) ; ヘリコジスカス属 (*Helicodiscus*) ; ヘリクス属 (*Helix*) (*H. アペルタ* (*H. aperta*)) ; リマクス属 (*Limax*) (*L. シネレオニガー* (*L. cinereoniger*) 、 *L. フラブス* (*L. flavus*) 、 *L. マルギナツス* (*L. marginatus*) 、 *L. マキシムス* (*L. maximus*) 、 *L. テネルス* (*L. tenellus*)) ; リムナエア属 (*Lymnaea*) ; ミラクス属 (*Milax*) (*M. ガガテス* (*M. gagates*) 、 *M. マルギナツス* (*M. marginatus*) 、 *M. ソウェルビイ* (*M. sowerbyi*)) ; オペアス属 (*Opeas*) ; ポマセア属 (*Pomacea*) (*P. カナリキュラタ* (*P. canaliculata*)) ; バロニア属 (*Valionia*) およびゾニトイデス属 (*Zanitooides*) が挙げられる。本発明に係る組合せは、デロセラス・レチキュラタム (*Deroceras reticulatum*) などのデロセラス属 (*Deroceras*) に対して特に有効である。

【 0137 】

他の実施形態から独立した一実施形態において、式 (I) の化合物は、線虫の防除に特に有用である。特に、線虫種、ネコブセンチュウ属 (*Meloidogyne spp.*) 、ヘテロデラ属 (*Heterodera spp.*) 、ロチレンクス属 (*Rotylenchus*)

10

20

30

40

40

50

nchus spp.) およびプラチレンクス属 (Pratylenchus spp.) が、本発明の化合物によって防除され得る。

【0138】

本発明の化合物は、単独で用いられるとき、生育中の農業植物および収穫された農業植物の両方の線虫、昆虫、コナダニ有害生物および/または真菌病原体を防除するのに有効であり、これらの化合物はまた、1つ以上の殺線虫剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺真菌剤、殺菌剤、植物活性化剤、殺軟体動物剤、およびフェロモン（化学的であるかまたは生物学的であるかにかかわらず）などの、農業に使用される他の生物学的活性剤と組み合わせて使用され得る。有害生物防除剤としての使用形態における本発明の化合物またはその組成物を、他の有害生物防除剤と混合すると、作用の殺虫スペクトルがより広くなることが多い。例えば、本発明の式（I）の化合物は、ピレスロイド、ネオニコチノイド、マクロライド、ジアミド、ホスフェート、カルバメート、シクロジエン、ホルムアミジン、フェノールスズ化合物、塩素化炭化水素、ベンゾイルフェニル尿素、ピロールなどとともにまたはそれらと組み合わせて有効に使用され得る。

【0139】

本発明に係る組成物の活性は、例えば、1つ以上の殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的におよび/または殺真菌的に有効な物質を加えることによって、かなり範囲が拡大され、そのときの状況に適合され得る。式（I）の化合物と、他の殺虫的に、殺ダニ的に、殺線虫的におよび/または殺真菌的に有効な物質との組合せが、より広い意味で、相乗活性として記載されることもあるさらなる意外な利点も有し得る。例えば、植物によるより良好な耐容性、減少した植物毒性、有害生物または真菌が、それらの異なる発育段階で防除され得ること、あるいはそれらの製造中、例えば粉碎または混合中、それらの貯蔵中またはそれらの使用中におけるより良好な挙動がある。

【0140】

本発明に係る化合物が一緒に使用され得る有害生物防除剤の以下の一覧は、例としての可能な組合せを例示することが意図される。

【0141】

式（I）の化合物と、別の活性化合物との以下の組合せが好ましい（「TX」という略語は、「本発明の表Pに記載される式P.1～P.191の化合物から選択される1つの化合物」を意味する）：

石油（代替名）(628) + TXからなる物質の群から選択される補助剤、
 1,1-ビス(4-クロロフェニル)-2-エトキシエタノール(IUPAC名)(910) + TX、2,4-ジクロロフェニルベンゼンスルホネート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1059) + TX、2-フルオロ-N-メチル-N-1-ナフチルアセドアミド(IUPAC名)(1295) + TX、4-クロロフェニルフェニルスルホン(IUPAC名)(981) + TX、アバメクチン(1) + TX、アセキノシル(3) + TX、アセトプロール[CCN] + TX、アクリナトリン(9) + TX、アルジカルブ(16) + TX、アルドキシカルブ(863) + TX、-シペルメトリン(202) + TX、アミジチオン(870) + TX、アミドフルメト[CCN] + TX、アミドチオエート(872) + TX、アミトン(875) + TX、アミトンシウ酸水素塩(875) + TX、アミトラズ(24) + TX、アラマイド(881) + TX、三酸化ニヒ素(882) + TX、AVI 382(化合物コード) + TX、AZ 60541(化合物コード) + TX、アジンホス-エチル(44) + TX、アジンホス-メチル(45) + TX、アゾベンゼン(IUPAC名)(888) + TX、アゾシクロチジン(46) + TX、アゾトエート(889) + TX、ベノミル(62) + TX、ベノキサホス(代替名)[CCN] + TX、ベンゾキシメート(71) + TX、安息香酸ベンジル(IUPAC名)[CCN] + TX、ビフェナゼート(74) + TX、ビフェントリン(76) + TX、ビナパクリル(907) + TX、プロフェンバレート(代替名) + TX、プロモシクレン(918) + TX、プロモホス(920) + TX、プロモホス-エチル(921) + TX、プロモプロピレート(94) + TX、ブロフェジン(99) + TX、ブトカルボキシム(1050)

3) + TX、ブトキシカルボキシム(104) + TX、ブチルピリダベン(代替名) + TX、多硫化カルシウム(IUPAC名)(111) + TX、カンフェクロル(941) + TX、カーバノレート(943) + TX、カルバリル(115) + TX、カルボフラン(118) + TX、カルボフェノチオン(947) + TX、CGA 50'439(開発コード)(125) + TX、キノメチオナト(126) + TX、クロルベンシド(959) + TX、クロルジメホルム(964) + TX、塩酸クロルジメホルム(964) + TX、クロルフェナピル(130) + TX、クロルフェネトール(968) + TX、クロルフェンソン(970) + TX、クロルフェンスルフィド(971) + TX、クロルフェンビンホス(131) + TX、クロロベンジレート(975) + TX、クロロメブホルム(977) + TX、クロロメチウロン(978) + TX、クロロプロピレート(983) + TX、クロルピリホス(145) + TX、クロルピリホス-メチル(146) + TX、クロルチオホス(994) + TX、シネリンI(696) + TX、シネリンII(696) + TX、シネリン(696) + TX、クロフェンテジン(158) + TX、クロサンテル(代替名)[CCN] + TX、クマホス(174) + TX、クロタミトン(代替名)[CCN] + TX、クロトキシホス(1010) + TX、クフラネブ(1013) + TX、シアントエート(1020) + TX、シフルメトフェン(CAS登録番号:400882-07-7) + TX、シハロトリン(196) + TX、シヘキサチン(199) + TX、シペルメトリン(201) + TX、DCPM(1032) + TX、DDT(219) + TX、デメフィオン(1037) + TX、デメフィオン-O(1037) + TX、デメフィオン-S(1037) + TX、デメトン(1038) + TX、デメトン-メチル(224) + TX、デメトン-O(1038) + TX、デメトン-O-メチル(224) + TX、デメトン-S(1038) + TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039) + TX、ジアフェンチウロン(226) + TX、ジアリホス(1042) + TX、ジアジノン(227) + TX、ジクロフルアニド(230) + TX、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス(代替名) + TX、ジコホル(242) + TX、ジクロトホス(243) + TX、ジエノクロル(1071) + TX、ジメホックス(1081) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジナクチン(代替名)(653) + TX、ジネクス(1089) + TX、ジネクス-ジクレキシン(1089) + TX、ジノブトン(269) + TX、ジノカップ(270) + TX、ジノカップ-4[CCN] + TX、ジノカップ-6[CCN] + TX、ジノクトン(1090) + TX、ジノペントン(1092) + TX、ジノスルホン(1097) + TX、ジノテルボン(1098) + TX、ジオキサチオン(1102) + TX、ジフェニルスルホン(IUPAC名)(1103) + TX、ジスルフィラム(代替名)[CCN] + TX、ジスルホトン(278) + TX、DNOC(282) + TX、ドフェナピン(1113) + TX、ドラメクチン(代替名)[CCN] + TX、エンドスルファン(294) + TX、エンドチオン(1121) + TX、EPN(297) + TX、エプリノメクチン(代替名)[CCN] + TX、エチオン(309) + TX、エトエート-メチル(1134) + TX、エトキサゾール(320) + TX、エトリムホス(1142) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェナザキン(328) + TX、酸化フェンブタスズ(330) + TX、フェノチオカルブ(337) + TX、フェンプロパトリン(342) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンピロキシメート(345) + TX、フェンソン(1157) + TX、フェントリファニル(1161) + TX、フェンバレレート(349) + TX、フィプロニル(354) + TX、フルアクリピリム(360) + TX、フルアズロン(1166) + TX、フルベンジミン(1167) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルオルベンシド(1174) + TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC 1137(開発コード)(1185) + TX、ホルメタネート(405) + TX、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムパラネート(1193) + TX、-HCH(430) + TX、グリオジン(1205) + TX、ハルフェンプロックス(424) + TX、ヘプテノ 10

20

30

40

50

ホス(432) + TX、ヘキサデシルシクロプロパンカルボキシレート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1216) + TX、ヘキシチアゾクス(441) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、イソカルボホス(代替名)(473) + TX、イソブロピルO-(メトキシアミノチオホスホリル)サリチレート(IUPAC名)(473) + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ヨードフェンホス(1248) + TX、リンダン(430) + TX、ルフェヌロン(490) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX、メカルバム(502) + TX、メホスホラン(1261) + TX、メスルフェン(代替名)[CCN] + TX、メタクリホス(1266) + TX、メタミドホス(527) + TX、メチダチオン(529) + TX、メチオカルブ(530) + TX、メトミル(531) + TX、臭化メチル(537) + TX、メトルカルブ(550) + TX、メビンホス(556) + TX、メキサカルベート(1290) + TX、ミルベメクチン(557) + TX、ミルベマイシンオキシム(代替名)[CCN] + TX、ミパホックス(1293) + TX、モノクロトホス(561) + TX、モルホチオン(1300) + TX、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ナレド(567) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、NC-512(化合物コード) + TX、ニフルリジド(1309) + TX、ニコマイシン(代替名)[CCN] + TX、ニトリラカルブ(1313) + TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313) + TX、NNI-0101(化合物コード) + TX、NNI-0250(化合物コード) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(602) + TX、オキシデプロホス(1324) + TX、オキシジスルホトン(1325) + TX、pp'-DDT(219) + TX、パラチオン(615) + TX、ペルメトリン(626) + TX、石油(代替名)(628) + TX、フェンカプトン(1330) + TX、フェントエート(631) + TX、ホレート(636) + TX、ホサロン(637) + TX、ホスホラン(1338) + TX、ホスマット(638) + TX、ホスファミドン(639) + TX、ホキシム(642) + TX、ビリミホス-メチル(652) + TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347) + TX、ポリナクチン(代替名)(653) + TX、プロクロノール(1350) + TX、プロフェノホス(662) + TX、プロマシル(1354) + TX、プロバルギット(671) + TX、プロペタンホス(673) + TX、プロポキサー(propoxur)(678) + TX、プロチダチオン(1360) + TX、プロトエート(1362) + TX、ピレトリンI(696) + TX、ピレトリンII(696) + TX、ピレトリン(696) + TX、ピリダベン(699) + TX、ピリダフェンチオン(701) + TX、ピリミジフェン(706) + TX、ピリミテート(1370) + TX、キナルホス(711) + TX、キンチオキス(1381) + TX、R-1492(開発コード)(1382) + TX、RA-17(開発コード)(1383) + TX、ロテノン(722) + TX、シュラーダン(1389) + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、SI-0009(化合物コード) + TX、ソファミド(1402) + TX、スピロジクロフェン(738) + TX、スピロメシフェン(739) + TX、SSI-121(開発コード)(1404) + TX、スルフィラム(代替名)[CCN] + TX、スルフルアミド(750) + TX、スルホテップ(753) + TX、硫黄(754) + TX、SZI-121(開発コード)(757) + TX、-フルバリネット(398) + TX、テブフェンピラド(763) + TX、TEPP(1417) + TX、テルバム(代替名) + TX、テトラクロルビンホス(777) + TX、テトラジホン(786) + TX、テトラナクチン(代替名)(653) + TX、テトラスル(1425) + TX、チアフェノックス(代替名) + TX、チオカルボキシム(1431) + TX、チオファノックス(800) + TX、チオメトン(801) + TX、チオキノックス(1436) + TX、ツリンギエンシン(代替名)[CCN] + TX、トリアミホス(1441) + TX、トリアラテン(1443) + TX、トリアゾホス(820) + TX、トリアズロン(代替名) + TX、トリクロルホン(824) + TX、トリフェノホス(1455) + TX、トリアクチン(代替名)(653) + TX、バミドチオン(847) + TX、バニリップ

10

20

30

40

50

ロール [C C N] および Y I - 5 3 0 2 (化合物コード) + T X からなる物質の群から選択される殺ダニ剤、

ベトキサジン [C C N] + T X 、ジオクタン酸銅 (IUPAC名) (1 7 0) + T X 、硫酸銅 (1 7 2) + T X 、シブトリン [C C N] + T X 、ジクロン (1 0 5 2) + T X 、ジクロロフェン (2 3 2) + T X 、エンドタール (2 9 5) + T X 、フェンチン (3 4 7) + T X 、消石灰 [C C N] + T X 、ナーバム (5 6 6) + T X 、キノクラミン (7 1 4) + T X 、キノナミド (1 3 7 9) + T X 、シマジン (7 3 0) + T X 、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (3 4 7) および水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (3 4 7) + T X からなる物質の群から選択される殺藻剤、

アバメクチン (1) + T X 、クルホマート (1 0 1 1) + T X 、ドラメクチン (代替名) [C C N] + T X 、エマメクチン (2 9 1) + T X 、エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + T X 、エブリノメクチン (代替名) [C C N] + T X 、イベルメクチン (代替名) [C C N] + T X 、ミルベマイシンオキシム (代替名) [C C N] + T X 、モキシデクチン (代替名) [C C N] + T X 、ピペラジン [C C N] + T X 、セラメクチン (代替名) [C C N] + T X 、スピノサド (7 3 7) およびチオファネート (1 4 3 5) + T X からなる物質の群から選択される駆虫剤、

クロラロース (1 2 7) + T X 、エンドリン (1 1 2 2) + T X 、フェンチオン (3 4 6) + T X 、ピリジン - 4 - アミン (IUPAC名) (2 3) およびストリキニーネ (7 4 5) + T X からなる物質の群から選択される殺鳥剤、

1 - ヒドロキシ - 1 H - ピリジン - 2 - チオン (IUPAC名) (1 2 2 2) + T X 、4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (7 4 8) + T X 、8 - ヒドロキシキノリン硫酸塩 (4 4 6) + T X 、プロノポール (9 7) + T X 、ジオクタン酸銅 (IUPAC名) (1 7 0) + T X 、水酸化銅 (IUPAC名) (1 6 9) + T X 、クレゾール [C C N] + T X 、ジクロロフェン (2 3 2) + T X 、ジピリチオン (1 1 0 5) + T X 、ドジシン (1 1 1 2) + T X 、フェナミノスルフ (1 1 4 4) + T X 、ホルムアルデヒド (4 0 4) + T X 、ヒドラルガフェン (代替名) [C C N] + T X 、カスガマイシン (4 8 3) + T X 、塩酸カスガマイシン水和物 (4 8 3) + T X 、ニッケルビス (ジメチルジチオカルバメート) (IUPAC名) (1 3 0 8) + T X 、ニトラピリン (5 8 0) + T X 、オクチリノン (5 9 0) + T X 、オキソリン酸 (6 0 6) + T X 、オキシテトラサイクリン (6 1 1) + T X 、ヒドロキシキノリン硫酸カリウム (4 4 6) + T X 、プロベナゾール (6 5 8) + T X 、ストレプトマイシン (7 4 4) + T X 、セスキ硫酸ストレプトマイシン (7 4 4) + T X 、テクロフタラム (7 6 6) + T X 、およびチオメルサール (代替名) [C C N] + T X からなる物質の群から選択される殺菌剤、

コカクモンハマキ (A do x o p h y e s o r a n a) G V (代替名) (1 2) + T X 、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radio bacter) (代替名) (1 3) + T X 、ムチカブリダニ属 (Amblyseius spp.) (代替名) (1 9) + T X 、アナグラファ・ファルシフェラ (Anagrapha falciifera) N P V (代替名) (2 8) + T X 、アナグルス・アトムス (Anagrus atomus) (代替名) (2 9) + T X 、アフェリヌス・アブドミナリス (Aphelinus abdominalis) (代替名) (3 3) + T X 、アフィジウス・コレマニ (Aphidius colemani) (代替名) (3 4) + T X 、アフィドレテス・アフィジミザ (A phidoletes aphidimyza) (代替名) (3 5) + T X 、オートグラファ・カリフォルニカ (Autographa californica) N P V (代替名) (3 8) + T X 、バチルス・フィルムス (Bacillus firmus) (代替名) (4 8) + T X 、バチルス・スフェリクス・ネイデ (Bacillus sphaericus Neide) (学名) (4 9) + T X 、バチルス・チューリングンシス・ベルリナー (Bacillus thuringiensis Berliner) (学名) (5 1) + T X 、バチルス・チューリングンシス亞種アイザワイ (Bacillus thuringiensis subsp. aizai)

10

20

30

40

50

wai) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングエンシス亜種イスラエンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングエンシス亜種ジャポネンシス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングエンシス亜種クルスターク (*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*) (学名) (51) + TX、バチルス・チューリングエンシス亜種テネブリオニス (*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*) (学名) (51) + TX、ビューベリア・バシアナ (*Beauveria bassiana*) (代替名) (53) + TX、ビューベリア・ブロングニアルティ (*Beauveria brongniartii*) (代替名) (54) + TX、クリソペラ・カルネア (*Chrysoperla carnea*) (代替名) (151) + TX、ツマアカオオテントウムシ (*Cryptolaemus montrouzieri*) (代替名) (178) + TX、シディア・ポモネラ (*Cydia pomonella*) GV (代替名) (191) + TX、ハモグリコマユバチ (*Dacnusa sibirica*) (代替名) (212) + TX、イサエアヒメコバチ (*Diglyphus isaea*) (代替名) (254) + TX、オンシツツヤコバチ (*Encarsia formosa*) (学名) (293) + TX、サバクツヤコバチ (*Eretmocerus eremicus*) (代替名) (300) + TX、ヘリコペルバ・ゼア (*Helicoverpa zea*) NPV (代替名) (431) + TX、ヘテロラブディティス・バクテリオフォラ (*Heterorhabditis bacteriophora*) および H. メギディス (*H. megidis*) (代替名) (433) + TX、サカハチテントウ (*Hippodamia convergens*) (代替名) (442) + TX、レプトマスティクス・ダクチロピイ (*Leptomastix dactylopii*) (代替名) (488) + TX、マクロロフス・カリギノスス (*Macrolophus caliginosus*) (代替名) (491) + TX、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*) NPV (代替名) (494) + TX、メタフィカス・ヘルボルス (*Metaphycus helvolus*) (代替名) (522) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アクリヅム (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) (学名) (523) + TX、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) (学名) (523) + TX、マツノキハバチ (*Neodiprion sertifer*) NPV および N. レコンティ (*N. lecontei*) NPV (代替名) (575) + TX、オリウス属 (*Orius spp.*) (代替名) (596) + TX、ペシロマイセス・フモソロセウス (*Paecilomyces fumosoroseus*) (代替名) (613) + TX、パストーリア・ペネトランス (*Pasteuria penetrans*) + TX、パストーリア・ソルネイ (*Pasteuria thornei*) + TX、パストーリア・ニシザワエ (*Pasteuria nishizawae*) + TX、パストーリア・ラモサ (*Pasteuria ramosa*) + TX、チリカブリダニ (*Phytoseiulus persimilis*) (代替名) (644) + TX、シロイチモジョトウ (*Spodoptera exigua*) 多カプシド核多角体病ウイルス (学名) (741) + TX、スタイナー・ネマ・ビビオニス (*Steinernema bibionis*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ・カルポカブサエ (*Steinernema carpocapsae*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ・フェルチアエ (*Steinernema feltiae*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ・グラッセリ (*Steinernema glaseri*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ・リオブ・ラベ (*Steinernema riobrave*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ・リオブラビス (*Steinernema riobraviss*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ・スカプテリシ (*Steinernema scapterisci*) (代替名) (742) + TX、スタイナー・ネマ属 (*Steinernerne*

10

20

30

40

50

ma spp.) (代替名) (742) + TX、トリコグラムマ属 (Trichogramma
mma spp.) (代替名) (826) + TX、チフロドロムス・オシデンタリス (Typhlodromus occidentalis) (代替名) (844) およびバーティシリウム・レカニ (Verticillium lecanii) (代替名) (848) + TX からなる物質の群から選択される生物剤、

ヨードメタン (IUPAC名) (542) および臭化メチル (537) + TX からなる物質の群から選択される土壤滅菌剤、

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

(E) - デカ - 5 - エン - 1 - イルアセテートおよび (E) - デカ - 5 - エン - 1 - オール (IUPAC名) (222) + TX、(E) - トリデカ - 4 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (829) + TX、(E) - 6 - メチルヘプタ - 2 - エン - 4 - オール (IUPAC名) (541) + TX、(E, Z) - テトラデカ - 4, 10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (779) + TX、(Z) - ドデカ - 7 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (285) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エナール (IUPAC名) (436) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 11 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (437) + TX、(Z) - ヘキサデカ - 13 - エン - 11 - イン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (438) + TX、(Z) - イコス - 13 - エン - 10 - オン (IUPAC名) (448) + TX、(Z) - テトラデカ - 7 - エン - 1 - アール (IUPAC名) (782) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - オール (IUPAC名) (783) + TX、(Z) - テトラデカ - 9 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (784) + TX、(7E, 9Z) - ドデカ - 7, 9 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (283) + TX、(9Z, 11E) - テトラデカ - 9, 11 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (780) + TX、(9Z, 12E) - テトラデカ - 9, 12 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (781) + TX、14 - メチルオクタデカ - 1 - エン (IUPAC名) (545) + TX、4 - メチルノナン - 5 - オールおよび4 - メチルノナン - 5 - オン (IUPAC名) (544) + TX、 - マルチストリアチン (代替名) [CCN] + TX、プレビコミン (代替名) [CCN] + TX、コドレルア (代替名) [CCN] + TX、コドレモン (代替名) (167) + TX、キュールア (代替名) (179) + TX、ディスパールア (277) + TX、ドデカ - 8 - エン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (286) + TX、ドデカ - 8 + TX、10 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC名) (284) + TX、ドミニカラ (代替名) [CCN] + TX、4 - メチルオクタノン酸エチル (IUPAC名) (317) + TX、オイゲノール (代替名) [CCN] + TX、フロンタリン (代替名) [CCN] + TX、ゴシップルア (代替名) (420) + TX、グランドルア (421) + TX、グランドルア I (代替名) (421) + TX、グランドルア II (代替名) (421) + TX、グランドルア III (代替名) (421) + TX、グランドルア IV (代替名) (421) + TX、ヘキサルア [CCN] + TX、イプスジエノール (代替名) [CCN] + TX、イプセノール (代替名) [CCN] + TX、ジャポニルア (代替名) (481) + TX、リネアチン (代替名) [CCN] + TX、リトルア (代替名) [CCN] + TX、ループルア (代替名) [CCN] + TX、メドルア [CCN] + TX、メガトモ酸 (代替名) [CCN] + TX、メチルオイゲノール (代替名) (540) + TX、ムスカルア (563) + TX、オクタデカ - 2, 13 - ジエン - 1 - イルアセテート (IUPAC

10

20

30

40

50

名) (588) + TX、オクタデカ-3,13-ジエン-1-イルアセテート(IUPAC名) (589) + TX、オルフルラルア(代替名) [CCN] + TX、オリクタルア(代替名) (317) + TX、オストラモン(代替名) [CCN] + TX、シグルア[CCN] + TX、ソルジジン(代替名) (736) + TX、スルカトール(代替名) [CCN] + TX、テトラデカ-11-エン-1-イルアセテート(IUPAC名) (785) + TX、トリメドルア(839) + TX、トリメドルアA(代替名) (839) + TX、トリメドルアB₁(代替名) (839) + TX、トリメドルアB₂(代替名) (839) + TX、トリメドルアC(代替名) (839) およびトランク-コール(trunc-call)(代替名) [CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫フェロモン、

2-(オクチルチオ)エタノール(IUPAC名) (591) + TX、ブトピロノキシル(933) + TX、ブトキシ(ポリプロピレングリコール) (936) + TX、アジピン酸ジブチル(IUPAC名) (1046) + TX、フタル酸ジブチル(1047) + TX、コハク酸ジブチル(IUPAC名) (1048) + TX、ジエチルトルアミド[CCN] + TX、ジメチルカルベート[CCN] + TX、フタル酸ジメチル[CCN] + TX、エチルヘキサンジオール(1137) + TX、ヘキサアミド[CCN] + TX、メトキン-ブチル(1276) + TX、メチルネオデカンアミド[CCN] + TX、オキサメート[CCN] およびピカリジン[CCN] + TX からなる物質の群から選択される昆虫避剤、

1-ジクロロ-1-ニトロエタン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (1058) + TX、1,1-ジクロロ-2,2-ビス(4-エチルフェニル)エタン(IUPAC名) (1056) + TX、1,2-ジクロロプロパン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (1062) + TX、1,2-ジクロロプロパンおよび1,3-ジクロロプロパン(IUPAC名) (1063) + TX、1-ブロモ-2-クロロエタン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (916) + TX、2,2,2-トリクロロ-1-(3,4-ジクロロフェニル)エチルアセテート(IUPAC名) (1451) + TX、2,2-ジクロロビニル2-エチルスルフィニルエチルメチルホスフェート(IUPAC名) (1066) + TX、2-(1,3-ジチオラン-2-イル)フェニルジメチルカルバメート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (1109) + TX、2-(2-ブトキシエトキシ)エチルチオシアネート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (935) + TX、2-(4,5-ジメチル-1,3-ジオキソラン-2-イル)フェニルメチルカルバメート(IUPAC/ケミカルアブストラクト名) (1084) + TX、2-(4-クロロ-3,5-キシリルオキシ)エタノール(IUPAC名) (986) + TX、2-クロロビニルジエチルホスフェート(IUPAC名) (984) + TX、2-イミダゾリドン(IUPAC名) (1225) + TX、2-イソバレリルインダン-1,3-ジオン(IUPAC名) (1246) + TX、2-メチル(プロパ-2-イニル)アミノフェニルメチルカルバメート(IUPAC名) (1284) + TX、2-チオシアナトエチルラウレート(IUPAC名) (1433) + TX、3-ブロモ-1-クロロプロパ-1-エン(IUPAC名) (917) + TX、3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルジメチルカルバメート(IUPAC名) (1283) + TX、4-メチル(プロパ-2-イニル)アミノ-3,5-キシリルメチルカルバメート(IUPAC名) (1285) + TX、5,5-ジメチル-3-オキソシクロヘキサ-1-エニルジメチルカルバメート(IUPAC名) (1085) + TX、アバメクチン(1) + TX、アセフェート(2) + TX、アセタミブリド(4) + TX、アセチオン(代替名) [CCN] + TX、アセトプロール[CCN] + TX、アクリナトリン(9) + TX、アクリロニトリル(IUPAC名) (861) + TX、アラニカルブ(15) + TX、アルジカルブ(16) + TX、アルドキシカルブ(863) + TX、アルドリン(864) + TX、アレトリン(17) + TX、アロサミジン(代替名) [CCN] + TX、アリキシカルブ(866) + TX、-シペルメトリン(202) + TX、-エクジソン(代替名) [CCN] + TX、リン化アルミニウム(640) + TX、アミジチオン(870) + TX、アミドチオエート(872) + TX、アミノカルブ(873) + TX、アミトン(875) + TX、アミ

10

20

30

40

50

トンシュウ酸水素塩 (8 7 5) + TX、アミトラズ (2 4) + TX、アナバシン (8 7 7) + TX、アチダチオン (8 8 3) + TX、AVI 382 (化合物コード) + TX、AZ 60541 (化合物コード) + TX、アザジラクチン (代替名) (4 1) + TX、アザメチホス (4 2) + TX、アジンホス - エチル (4 4) + TX、アジンホス - メチル (4 5) + TX、アゾトエート (8 8 9) + TX、バチルス・チューリゲンシス (*Bacillus thuringiensis*) デルタエンドトキシン (代替名) (5 2) + TX、ヘキサフルオロケイ酸バリウム (代替名) [CCN] + TX、多硫化バリウム (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (8 9 2) + TX、バルトリン [CCN] + TX、Bayer 22/190 (開発コード) (8 9 3) + TX、Bayer 22408 (開発コード) (8 9 4) + TX、ベンジオカルブ (5 8) + TX、ベンフラカルブ (6 0) + TX、ベンスルタップ (6 6) + TX、- シフルトリン (1 9 4) + TX、- シペルメトリン (2 0 3) + TX、ビフェントリン (7 6) + TX、ビオアレトリン (7 8) + TX、ビオアレトリン S - シクロペンテニル異性体 (代替名) (7 9) + TX、ビオエタノメトリン [CCN] + TX、ビオペルメトリン (9 0 8) + TX、ビオレスメトリン (8 0) + TX、ビス (2 - クロロエチル) エーテル (IUPAC名) (9 0 9) + TX、ビストリフルロン (8 3) + TX、ホウ砂 (8 6) + TX、プロフェンバレート (代替名) + TX、プロムフェンビンホス (9 1 4) + TX、プロモシクレン (9 1 8) + TX、プロモ - DDT (代替名) [CCN] + TX、プロモホス (9 2 0) + TX、プロモホス - エチル (9 2 1) + TX、ブフェンカルブ (9 2 4) + TX、ブプロフェジン (9 9) + TX、ブタカルブ (9 2 6) + TX、ブタチオホス (9 2 7) + TX、ブトカルボキシム (1 0 3) + TX、ブトネート (9 3 2) + TX、ブトキシカルボキシム (1 0 4) + TX、ブチルピリダベン (代替名) + TX、カズサホス (1 0 9) + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、シアノ化カルシウム (4 4 4) + TX、多硫化カルシウム (IUPAC名) (1 1 1) + TX、カンフェクロル (9 4 1) + TX、カーバノレート (9 4 3) + TX、カルバリル (1 1 5) + TX、カルボフラン (1 1 8) + TX、二硫化炭素 (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (9 4 5) + TX、四塩化炭素 (IUPAC名) (9 4 6) + TX、カルボフェノチオン (9 4 7) + TX、カルボスルファン (1 1 9) + TX、カルタップ (1 2 3) + TX、カルタップ塩酸塩 (1 2 3) + TX、セバジン (代替名) (7 2 5) + TX、クロルビシクレン (9 6 0) + TX、クロルダン (1 2 8) + TX、クロルデコン (9 6 3) + TX、クロルジメホルム (9 6 4) + TX、塩酸クロルジメホルム (9 6 4) + TX、クロルエトキシホス (1 2 9) + TX、クロルフェナピル (1 3 0) + TX、クロルフェンビンホス (1 3 1) + TX、クロルフルアズロン (1 3 2) + TX、クロルメホス (1 3 6) + TX、クロロホルム [CCN] + TX、クロロピクリン (1 4 1) + TX、クロルホキシム (9 8 9) + TX、クロルプラゾホス (9 9 0) + TX、クロルピリホス (1 4 5) + TX、クロルピリホス - メチル (1 4 6) + TX、クロルチオホス (9 9 4) + TX、クロマフェノジド (1 5 0) + TX、シネリン I (6 9 6) + TX、シネリン II (6 9 6) + TX、シネリン (6 9 6) + TX、シス - レスマトリン (代替名) + TX、シスマトリン (8 0) + TX、クロシトリン (代替名) + TX、クロエトカルブ (9 9 9) + TX、クロサンテル (代替名) [CCN] + TX、クロチアニジン (1 6 5) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、ヒ酸銅 [CCN] + TX、オレイン酸銅 [CCN] + TX、クマホス (1 7 4) + TX、クミトイート (1 0 0 6) + TX、クロタミトン (代替名) [CCN] + TX、クロトキシホス (1 0 1 0) + TX、クルホマート (1 0 1 1) + TX、氷晶石 (代替名) (1 7 7) + TX、CS 708 (開発コード) (1 0 1 2) + TX、シアノフェンホス (1 0 1 9) + TX、シアノホス (1 8 4) + TX、シアントエート (1 0 2 0) + TX、シクレトリン [CCN] + TX、シクロプロトリン (1 8 8) + TX、シフルトリン (1 9 3) + TX、シハロトリン (1 9 6) + TX、シペルメトリン (2 0 1) + TX、シフェノトリン (2 0 6) + TX、シロマジン (2 0 9) + TX、サイチオアート (代替名) [CCN] + TX、d - リモネン (代替名) [CCN] + TX、d - テトラメトリン (代替名) (7 8 8) + TX、DAEP (1 0 3 1) + TX、ダゾメット (2 1 6) + TX、DDT (2 1 10) + TX、10
20
30
40
50

9) + TX、デカルボフラン(1034) + TX、デルタメトリン(223) + TX、デメフィオン(1037) + TX、デメフィオン-O(1037) + TX、デメフィオン-S(1037) + TX、デメトン(1038) + TX、デメトン-メチル(224) + TX、デメトン-O(1038) + TX、デメトン-O-メチル(224) + TX、デメトン-S(1038) + TX、デメトン-S-メチル(224) + TX、デメトン-S-メチルスルホン(1039) + TX、ジアフェンチウロン(226) + TX、ジアリホス(1042) + TX、ジアミダホス(1044) + TX、ジアジノン(227) + TX、ジカブチオン(1050) + TX、ジクロフェンチオン(1051) + TX、ジクロルボス(236) + TX、ジクリホス(代替名) + TX、ジクレシル(代替名) [CCN] + TX、ジクロトホス(243) + TX、ジシクラニル(244) + TX、ジエルドリン(1070) + TX、ジエチル5-メチルピラゾール-3-イルホスフェート(IUPAC名)(1076) + TX、ジフルベンズロン(250) + TX、ジロール(代替名) [CCN] + TX、ジメフルトリン[CCN] + TX、ジメホックス(1081) + TX、ジメタン(1085) + TX、ジメトエート(262) + TX、ジメトリン(1083) + TX、ジメチルビンホス(265) + TX、ジメチラン(1086) + TX、ジネクス(1089) + TX、ジネクス-ジクレキシン(1089) + TX、ジノプロブ(1093) + TX、ジノサム(1094) + TX、ジノセブ(1095) + TX、ジノテフラン(271) + TX、ジオフェノラン(1099) + TX、ジオキサベンゾホス(1100) + TX、ジオキサカルブ(1101) + TX、ジオキサチオン(1102) + TX、ジスルホトン(278) + TX、ジチクロホス(1108) + TX、DNO C(282) + TX、ドラメクチン(代替名) [CCN] + TX、DSP(1115) + TX、エクジステロン(代替名) [CCN] + TX、EI 1642(開発コード)(1118) + TX、エマメクチン(291) + TX、エマメクチン安息香酸塩(291) + TX、EMP C(1120) + TX、エンペントリン(292) + TX、エンドスルファン(294) + TX、エンドチオン(1121) + TX、エンドリン(1122) + TX、EPBP(11123) + TX、EPN(297) + TX、エポフェノナン(1124) + TX、エプリノメクチン(代替名) [CCN] + TX、エスフェンバレート(302) + TX、エタホス(代替名) [CCN] + TX、エチオフェンカルブ(308) + TX、エチオン(309) + TX、エチプロール(310) + TX、エトエート-メチル(1134) + TX、エトプロホス(312) + TX、ギ酸エチル(IUPAC名) [CCN] + TX、エチル-DDD(代替名)(1056) + TX、二臭化工チレン(316) + TX、二塩化工チレン(化学名)(1136) + TX、エチレンオキシド[CCN] + TX、エトフェンプロックス(319) + TX、エトリムホス(1142) + TX、EXD(1143) + TX、ファンファー(323) + TX、フェナミホス(326) + TX、フェナザフロル(1147) + TX、フェンクロルホス(1148) + TX、フェネタカルブ(1149) + TX、フェンフルトリノン(1150) + TX、フェニトロチオン(335) + TX、フェノブカルブ(336) + TX、フェノキサクリム(1153) + TX、フェノキシカルブ(340) + TX、フェンピリトリノン(1155) + TX、フェンプロパトリノン(342) + TX、フェンピラド(代替名) + TX、フェンスルホチオン(1158) + TX、フェンチオン(346) + TX、フェンチオン-エチル[CCN] + TX、フェンバレート(349) + TX、フィブロニル(354) + TX、フロニカミド(358) + TX、フルベンジアミド(CAS登録番号:272451-65-7) + TX、フルコフロン(1168) + TX、フルシクロクスロン(366) + TX、フルシトリネート(367) + TX、フルエネチル(1169) + TX、フルフェネリム[CCN] + TX、フルフェノクスロン(370) + TX、フルフェンプロックス(1171) + TX、フルメトリン(372) + TX、フルピラジフロン+TX、フルバリネート(1184) + TX、FMC
1137(開発コード)(1185) + TX、ホノホス(1191) + TX、ホルメタネート(405) + TX、塩酸ホルメタネート(405) + TX、ホルモチオン(1192) + TX、ホルムパラネート(1193) + TX、ホスメチラン(1194) + TX、
10
20
30
40
50

ホスピレート(1195) + TX、ホスチアゼート(408) + TX、ホスチエタン(1196) + TX、フラチオカルブ(412) + TX、フレトリン(1200) + TX、
 -シハロトリン(197) + TX、-HCH(430) + TX、グアザチン(422) + TX、酢酸グアザチン(422) + TX、GY-81(開発コード)(423) + TX、
 ハルフェンプロックス(424) + TX、ハロフェノジド(425) + TX、HCH(430) + TX、HEOD(1070) + TX、ヘプタクロル(1211) + TX、ヘプ
 テノホス(432) + TX、ヘテロホス[CCN] + TX、ヘキサフルムロン(439) + TX、HHDN(864) + TX、ヒドラメチルノン(443) + TX、シアノ化水素
 (444) + TX、ハイドロブレン(445) + TX、ヒキンカルブ(1223) + TX、イミダクロブリド(458) + TX、イミプロトリノ(460) + TX、インドキサカルブ
 (465) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、IPSP(1229) + TX、イサゾホス(1231) + TX、イソベンゼン(1232) + TX、イソカルボホス(代替名)
 (473) + TX、イソドリン(1235) + TX、イソフェンホス(1236) + TX、イソラン(1237) + TX、イソプロカルブ(472) + TX、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(IUPAC名)(473) + TX、イソプロチオラン(474) + TX、イソチオエート(1244) + TX、イソキサチオ
 オン(480) + TX、イベルメクチン(代替名)[CCN] + TX、ジャスモリンI(696) + TX、ジャスモリンII(696) + TX、ヨードフェンホ
 ス(1248) + TX、幼若ホルモンI(代替名)[CCN] + TX、幼若ホルモンII(代替名)[CCN] + TX、幼若ホルモンIII(代替名)[CCN] + TX、ケレバ
 ン(1249) + TX、キノブレン(484) + TX、-シハロトリノ(198) + TX、ヒ酸鉛[CCN] + TX、レピメクチン(CCN) + TX、レブトホス(1250)
 + TX、リンダン(430) + TX、リリムホス(1251) + TX、ルフェヌロン(490) + TX、リチダチオン(1253) + TX、m-クメニルメチルカルバメート(I
 U P A C名)(1014) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、マラチオン(492) + TX、マロノベン(1254) + TX、マジドックス(12
 55) + TX、メカルバム(502) + TX、メカルフォン(1258) + TX、メナゾン(1260) + TX、メホスホラン(1261) + TX、塩化第一水銀(513) + TX
 、メスルフェンホス(1263) + TX、メタフルミゾン(CCN) + TX、メタム(519) + TX、メタム-カリウム(代替名)(519) + TX、メタム-ナトリウム
 (519) + TX、メタクリホス(1266) + TX、メタミドホス(527) + TX、フッ化メタンスルホニル(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1268) + TX、
 メチダチオン(529) + TX、メチオカルブ(530) + TX、メトクロトホス(1273) + TX、メトミル(531) + TX、メトブレン(532) + TX、メトキン-ブ
 チル(1276) + TX、メトトリノ(代替名)(533) + TX、メトキシクロル(534) + TX、メトキシフェノジド(535) + TX、臭化メチル(537) + TX、メ
 チルイソチオシアネート(543) + TX、メチルクロロホルム(代替名)[CCN] + TX、塩化メチレン[CCN] + TX、メトフルトリノ[CCN] + TX、メトルカルブ
 (550) + TX、メトキサジアゾン(1288) + TX、メビンホス(556) + TX、メキサカルベート(1290) + TX、ミルベメクチン(557) + TX、ミルベマイ
 シンオキシム(代替名)[CCN] + TX、ミパホックス(1293) + TX、ミレックス(1294) + TX、モノクロトホス(561) + TX、モルホチオン(1300) + TX
 、モキシデクチン(代替名)[CCN] + TX、ナフタロホス(代替名)[CCN] + TX、ナレド(567) + TX、ナフタレン(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)
 (1303) + TX、NC-170(開発コード)(1306) + TX、NC-184(化合物コード) + TX、ニコチノ(578) + TX、硫酸ニコチノ(578) + TX、ニフルリジド
 (1309) + TX、ニテンピラム(579) + TX、ニチアジン(1311) + TX、ニトリラカルブ(1313) + TX、ニトリラカルブ1:1塩化亜鉛錯体(1313) + TX、NNI-0101
 (化合物コード) + TX、NNI-0250(化合物コード) + TX、ノルニコチノ(慣用名)(1319) + TX、ノバルロン(585) + TX

10

20

30

40

50

+ TX、ノビフルムロン(586) + TX、O-5-ジクロロ-4-ヨードフェニルO-エチルエチルホスホノチオエート(IUPAC名)(1057) + TX、O,O-ジエチルO-4-メチル-2-オキソ-2H-クロメン-7-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1074) + TX、O,O-ジエチルO-6-メチル-2-プロビルピリミジン-4-イルホスホロチオエート(IUPAC名)(1075) + TX、O,O,O',O'-テトラプロピルジチオピロホスフェート(IUPAC名)(1424) + TX、オレイン酸(IUPAC名)(593) + TX、オメトエート(594) + TX、オキサミル(602) + TX、オキシデメトン-メチル(609) + TX、オキシデプロホス(1324) + TX、オキシジスルホトン(1325) + TX、pp'-DDT(219) + TX、パラ-ジクロロベンゼン[CCN] + TX、パラチオン(615) + TX、パラチオン-メチル(616) + TX、ペンフルロン(代替名)[CCN] + TX、ペンタクロロフェノール(623) + TX、ラウリン酸ペンタクロロフェニル(IUPAC名)(623) + TX、ペルメトリン(626) + TX、石油(代替名)(628) + TX、PH 60-38(開発コード)(1328) + TX、フェンカブトン(1330) + TX、フェノトリル(630) + TX、フェントエート(631) + TX、ホレート(636) + TX、ホサロン(637) + TX、ホスホラン(1338) + TX、ホスメット(638) + TX、ホスニクロール(1339) + TX、ホスファミド(639) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、ホキシム(642) + TX、ホキシム-メチル(1340) + TX、ピリメタホス(1344) + TX、ピリミカルブ(651) + TX、ピリミホス-エチル(1345) + TX、ピリミホス-メチル(652) + TX、ポリクロロジクロロペンタジエン異性体(IUPAC名)(1346) + TX、ポリクロロテルペン(慣用名)(1347) + TX、亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、チオシアニ酸カリウム[CCN] + TX、プラレトリル(655) + TX、プレコセンI(代替名)[CCN] + TX、プレコセンII(代替名)[CCN] + TX、プリミドホス(1349) + TX、プロフェノホス(662) + TX、プロフルトリル[CCN] + TX、プロマシル(1354) + TX、プロメカルブ(1355) + TX、プロパホス(1356) + TX、プロペタンホス(673) + TX、プロボキサー(678) + TX、プロチダチオン(1360) + TX、プロチオホス(686) + TX、プロトエート(1362) + TX、プロトリフェンビュート[CCN] + TX、ピメトロジン(688) + TX、ピラクロホス(689) + TX、ピラゾホス(693) + TX、ピレスメトリル(1367) + TX、ピレトリル(696) + TX、ピリダベン(699) + TX、ピリダリル(700) + TX、ピリダフェンチオン(701) + TX、ピリミジフェン(706) + TX、ピリミテート(1370) + TX、ピリプロキシフェン(708) + TX、クアッシア(代替名)[CCN] + TX、キナルホス(711) + TX、キナルホス-メチル(1376) + TX、キノチオン(1380) + TX、キンチオキス(1381) + TX、R-1492(開発コード)(1382) + TX、ラフォキサニド(代替名)[CCN] + TX、レスメトリル(719) + TX、ロテノン(722) + TX、RU 15525(開発コード)(723) + TX、RU 25475(開発コード)(1386) + TX、リアニア(代替名)(1387) + TX、リアノジン(慣用名)(1387) + TX、サバジラ(代替名)(725) + TX、シュラーダン(1389) + TX、セブホス(代替名) + TX、セラメクチン(代替名)[CCN] + TX、SI-0009(化合物コード) + TX、SI-0205(化合物コード) + TX、SI-0404(化合物コード) + TX、SI-0405(化合物コード) + TX、シラフルオフェン(728) + TX、SN 72129(開発コード)(1397) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアノ化ナトリウム(444) + TX、フッ化ナトリウム(IUPAC/ケミカルアブストラクト名)(1399) + TX、ヘキサフルオロケイ酸ナトリウム(1400) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド(623) + TX、セレン酸ナトリウム(IUPAC名)(1401) + TX、チオシアノ酸ナトリウム[CCN] + TX、ソファミド(1402) + TX、スピノサド(737) + TX、スピロメ 10
20
30
40
50

シフェン (739) + TX、スピロテトラマト (CCN) + TX、スルコフロン (746) + TX、スルコフロン - ナトリウム (746) + TX、スルフルアミド (750) + TX、スルホテップ (753) + TX、フッ化スルフリル (756) + TX、スルプロオス (1408) + TX、タール油 (代替名) (758) + TX、 - フルバリネット (398) + TX、タジムカルブ (1412) + TX、TDE (1414) + TX、テブフェノジド (762) + TX、テブフェンピラド (763) + TX、テブピリムホス (764) + TX、テフルベンズロン (768) + TX、テフルトリン (769) + TX、テメホス (770) + TX、TEPP (1417) + TX、テラレトリン (1418) + TX、テルバム (代替名) + TX、テルブホス (773) + TX、テトラクロロエタン [CCN] + TX、テトラクロルビンホス (777) + TX、テトラメトリン (787) + TX、 - シペルメトリン (204) + TX、チアクロブリド (791) + TX、チアフェノックス (代替名) + TX、チアメトキサム (792) + TX、チクロホス (1428) + TX、チオカルボキシム (1431) + TX、チオシクラム (798) + TX、チオシクラム シュウ酸水素塩 (798) + TX、チオジカルブ (799) + TX、チオファノックス (800) + TX、チオメトン (801) + TX、チオナジン (1434) + TX、チオスルタップ (803) + TX、チオスルタップ - ナトリウム (803) + TX、ツリンギエンシン (代替名) [CCN] + TX、トルフェンピラド (809) + TX、トラロメトリン (812) + TX、トランスフルトリン (813) + TX、トランスペルメトリン (1440) + TX、トリアミホス (1441) + TX、トリアザメート (818) + TX、トリアゾホス (820) + TX、トリアズロン (代替名) + TX、トリクロルホン (824) + TX、トリクロルメタホス - 3 (代替名) [CCN] + TX、トリクロロナート (1452) + TX、トリフェノホス (1455) + TX、トリフルムロン (835) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、トリプレン (1459) + TX、バミドチオン (847) + TX、バニリプロール [CCN] + TX、ベラトリジン (代替名) (725) + TX、ベラトリン (代替名) (725) + TX、XMC (853) + TX、キシリルカル
ル
ブ (854) + TX、YI - 5302 (化合物コード) + TX、 - シペルメトリン (205) + TX、ゼタメトリン (zeta methrin) (代替名) + TX、リン化亜鉛 (640) + TX、ゾラプロホス (1469) および ZXI 8901 (開発コード) (858) + TX、シアントラニリプロール [736994 - 63 - 19] + TX、クロラントラニリプロール [500008 - 45 - 7] + TX、シエノピラフェン [560121 - 52 - 0] + TX、シフルメトフェン [400882 - 07 - 7] + TX、ピリフルキナゾン [337458 - 27 - 2] + TX、スピネトラム [187166 - 40 - 1 + 187166 - 15 - 0] + TX、スピロテトラマト [203313 - 25 - 1] + TX、スルホキサフロール [946578 - 00 - 3] + TX、フルフィプロール [704886 - 18 - 0] + TX、メペルフルトリン [915288 - 13 - 0] + TX、テトラメチルフルトリン [84937 - 88 - 2] + TX からなる物質の群から選択される殺虫剤、
ビス (トリブチルスズ) オキシド (IUPAC名) (913) + TX、プロモアセトアミド [CCN] + TX、ヒ酸カルシウム [CCN] + TX、クロエトカルブ (999) + TX、アセト亜ヒ酸銅 [CCN] + TX、硫酸銅 (172) + TX、フェンチン (347) + TX、リン酸第二鉄 (IUPAC名) (352) + TX、メタルデヒド (518) + TX、メチオカルブ (530) + TX、ニクロサミド (576) + TX、ニクロサミド - オールアミン (576) + TX、ペンタクロロフェノール (623) + TX、ナトリウムペンタクロロフェノキシド (623) + TX、タジムカルブ (1412) + TX、チオジカルブ (799) + TX、酸化トリブチルスズ (913) + TX、トリフェンモルフ (1454) + TX、トリメタカルブ (840) + TX、酢酸トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) および 水酸化トリフェニルスズ (IUPAC名) (347) + TX、ピリプロール [394730 - 71 - 3] + TX からなる物質の群から選択される殺軟体動物剤、

10

20

30

40

50

A K D - 3 0 8 8 (化合物コード) + TX 、 1 , 2 - ジブロモ - 3 - クロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 0 4 5) + TX 、 1 , 2 - ジクロロプロパン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 0 6 2) + TX 、 1 , 2 - ジクロロプロパンおよび 1 , 3 - ジクロロプロパン (IUPAC 名) (1 0 6 3) + TX 、 1 , 3 - ジクロロプロパン (2 3 3) + TX 、 3 , 4 - ジクロロテトラヒドロチオフェン 1 , 1 - ジオキシド (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 0 6 5) + TX 、 3 - (4 - クロロフェニル) - 5 - メチルローダニン (IUPAC 名) (9 8 0) + TX 、 5 - メチル - 6 - チオキソ - 1 , 3 , 5 - チアジアジナン - 3 - イル酢酸 (IUPAC 名) (1 2 8 6) + TX 、 6 - イソペンテニルアミノプリン (代替名) (2 1 0) + TX 、 アバメクチン (1) + TX 、 アセトプロール [CCN] + TX 、 アラニカルブ (1 5) + TX 、 アルジカルブ (1 6) + TX 、 アルドキシカルブ (8 6 3) + TX 、 AZ 6 0 5 4 1 (化合物コード) + TX 、 ベンクロチアズ [CCN] + TX 、 ベノミル (6 2) + TX 、 ブチルピリダベン (代替名) + TX 、 カズサホス (1 0 9) + TX 、 カルボフラン (1 1 8) + TX 、 二硫化炭素 (9 4 5) + TX 、 カルボスルファン (1 1 9) + TX 、 クロロピクリン (1 4 1) + TX 、 クロルピリホス (1 4 5) + TX 、 クロエトカルブ (9 9 9) + TX 、 サイトカイニン (代替名) (2 1 0) + TX 、 ダゾメット (2 1 6) + TX 、 DBCP (1 0 4 5) + TX 、 DCIP (2 1 8) + TX 、 ジアミダホス (1 0 4 4) + TX 、 ジクロフェンチオン (1 0 5 1) + TX 、 ジクリホス (代替名) + TX 、 ジメトエート (2 6 2) + TX 、 ドラメクチン (代替名) [CCN] + TX 、 エマメクチン (2 9 1) + TX 、 エマメクチン安息香酸塩 (2 9 1) + TX 、 エプリノメクチン (代替名) [CCN] + TX 、 エトプロホス (3 1 2) + TX 、 二臭化エチレン (3 1 6) + TX 、 フェナミホス (3 2 6) + TX 、 フエンピラド (代替名) + TX 、 フエンスルホチオン (1 1 5 8) + TX 、 ホスチアゼート (4 0 8) + TX 、 ホスチエタン (1 1 9 6) + TX 、 フルフラール (代替名) [CCN] + TX 、 GY - 8 1 (開発コード) (4 2 3) + TX 、 ヘテロホス [CCN] + TX 、 ヨードメタン (IUPAC 名) (5 4 2) + TX 、 イサミドホス (1 2 3 0) + TX 、 イサゾホス (1 2 3 1) + TX 、 イベルメクチン (代替名) [CCN] + TX 、 キネチン (代替名) (2 1 0) + TX 、 メカルフォン (1 2 5 8) + TX 、 メタム (5 1 9) + TX 、 メタム - カリウム (代替名) (5 1 9) + TX 、 メタム - ナトリウム (5 1 9) + TX 、 臭化メチル (5 3 7) + TX 、 メチルイソチオシアネート (5 4 3) + TX 、 ミルベマイシンオキシム (代替名) [CCN] + TX 、 モキシデクチン (代替名) [CCN] + TX 、 クワ暗斑病菌 (Myrothecium verrucaria) 組成物 (代替名) (5 6 5) + TX 、 NC - 1 8 4 (化合物コード) + TX 、 オキサミル (6 0 2) + TX 、 ホレート (6 3 6) + TX 、 ホスファミドン (6 3 9) + TX 、 ホスホカルブ [CCN] + TX 、 セブホス (代替名) + TX 、 セラメクチン (代替名) [CCN] + TX 、 スピノサド (7 3 7) + TX 、 テルバム (代替名) + TX 、 テルブホス (7 7 3) + TX 、 テトラクロロチオフェン (IUPAC / ケミカルアブストラクト名) (1 4 2 2) + TX 、 チアフェノックス (代替名) + TX 、 チオナジン (1 4 3 4) + TX 、 トリアゾホス (8 2 0) + TX 、 トリアズロン (代替名) + TX 、 キシレノール [CCN] + TX 、 YI - 5 3 0 2 (化合物コード) およびゼアチン (代替名) (2 1 0) + TX 、 フルエンスルホン [3 1 8 2 9 0 - 9 8 - 1] + TX からなる物質の群から選択される殺線虫剤、

エチルキサントゲン酸カリウム [C C N] およびニトラピリン (5 8 0) + T X からなる物質の群から選択される硝化阻害剤、

アシベンゾラル (6) + TX 、アシベンゾラル - S - メチル (6) + TX 、プロペナゾール (658) およびオオイタドリ (*Reynoutria sachalinensis*) 抽出物 (代替名) (720) + TX からなる物質の群から選択される植物活性化剤、 2 - イソバレリルインダン - 1 , 3 - ジオン (IUPAC名) (1246) + TX 、 4 - (キノキサリン - 2 - イルアミノ) ベンゼンスルホンアミド (IUPAC名) (748) + TX 、 - クロロヒドリン [CCN] + TX 、 リン化アルミニウム (640) + TX 、 アンチュ (antu) (880) + TX 、 三酸化ニヒ素 (882) + TX 、 炭酸バリウ

ム(891) + TX、ビスチオセミ(912) + TX、プロディファコウム(89) + TX、プロマジオロン(91) + TX、プロメタリン(92) + TX、シアン化カルシウム(444) + TX、クロラロース(127) + TX、クロロファシノン(140) + TX、コレカルシフェロール(代替名)(850) + TX、クマクロール(1004) + TX、クマフリル(1005) + TX、クマテトラリル(175) + TX、クリミジン(1009) + TX、ジフェナコウム(246) + TX、ジフェチアロン(249) + TX、ジファシノン(273) + TX、エルゴカルシフェロール(301) + TX、フロクマフェン(357) + TX、フルオロアセトアミド(379) + TX、フルプロパダイン(1183) + TX、フルプロパダイン塩酸塩(1183) + TX、-HCH(430) + TX、HCH(430) + TX、シアン化水素(444) + TX、ヨードメタン(IUPAC名)(542) + TX、リンダン(430) + TX、リン化マグネシウム(IUPAC名)(640) + TX、臭化メチル(537) + TX、ノルボルミド(1318) + TX、ホサセチム(1336) + TX、ホスフィン(IUPAC名)(640) + TX、リン[CCN] + TX、ピンドン(1341) + TX、亜ヒ酸カリウム[CCN] + TX、ピリヌロン(1371) + TX、シリロシド(1390) + TX、亜ヒ酸ナトリウム[CCN] + TX、シアン化ナトリウム(444) + TX、フルオロ酢酸ナトリウム(735) + TX、ストリキニーネ(745) + TX、硫酸タリウム[CCN] + TX、ワルファリン(851) およびリン化亜鉛(640) + TX からなる物質の群から選択される殺鼠剤、

2-(2-ブトキシエトキシ)エチルピペロニレート(IUPAC名)(934) + TX、5-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イル)-3-ヘキシリシクロヘキサ-2-エノン(IUPAC名)(903) + TX、ファルネソールおよびネロリドール(代替名)(324) + TX、MB-599(開発コード)(498) + TX、MGK 264(開発コード)(296) + TX、ピペロニルブトキシド(649) + TX、ピプロタール(1343) + TX、プロピル異性体(1358) + TX、S421(開発コード)(724) + TX、セサメクス(1393) + TX、セサモリン(1394) およびスルホキシド(1406) + TX からなる物質の群から選択される共力剤、

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

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

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

ならびにアザコナゾール(60207-31-0) + TX、ビテルタノール[70585-36-3] + TX、プロムコナゾール[116255-48-2] + TX、シプロコナゾール[94361-06-5] + TX、ジフェノコナゾール[119446-68-3] + TX、ジニコナゾール[83657-24-3] + TX、エポキシコナゾール[106325-08-0] + TX、フェンブコナゾール[114369-43-6] + TX、フルキンコナゾール[136426-54-5] + TX、フルシラゾール[85509-19-9] + TX、フルトリニアホール[76674-21-0] + TX、ヘキサコナゾール[79983-71-4] + TX、イマザリル[35554-44-0] + TX、イミベンコナゾール[86598-92-7] + TX、イプロコナゾール[125225-28-7] + TX、メトコナゾール[125116-23-6] + TX、ミクロブタニル[88671-89-0] + TX、ペフラゾエート[101903-30-4] + TX、ペンコナゾール[66246-88-6] + TX、プロチオコナゾール[178928-7]

10

20

30

40

50

0 - 6] + TX、ピリフェノックス [8 8 2 8 3 - 4 1 - 4] + TX、プロクロラズ [6 7 7 4 7 - 0 9 - 5] + TX、プロピコナゾール [6 0 2 0 7 - 9 0 - 1] + TX、シメコナゾール [1 4 9 5 0 8 - 9 0 - 7] + TX、テブコナゾール [1 0 7 5 3 4 - 9 6 - 3] + TX、テトラコナゾール [1 1 2 2 8 1 - 7 7 - 3] + TX、トリアジメホン [4 3 1 2 1 - 4 3 - 3] + TX、トリアジメノール [5 5 2 1 9 - 6 5 - 3] + TX、トリフルミゾール [9 9 3 8 7 - 8 9 - 0] + TX、トリチコナゾール [1 3 1 9 8 3 - 7 2 - 7] + TX、アンシミドール [1 2 7 7 1 - 6 8 - 5] + TX、フェナリモル [6 0 1 6 8 - 8 8 - 9] + TX、ヌアリモル [6 3 2 8 4 - 7 1 - 9] + TX、ブピリメート [4 1 4 8 3 - 4 3 - 6] + TX、ジメチリモール [5 2 2 1 - 5 3 - 4] + TX、エチリモル [2 3 9 4 7 - 6 0 - 6] + TX、ドデモルフ [1 5 9 3 - 7 7 - 7] + TX、フェンプロピジン [6 7 3 0 6 - 0 0 - 7] + TX、フェンプロピモルフ [6 7 5 6 4 - 9 1 - 4] + TX、スピロキサミン [1 1 8 1 3 4 - 3 0 - 8] + TX、トリデモルフ [8 1 4 1 2 - 4 3 - 3] + TX、シプロジニル [1 2 1 5 5 2 - 6 1 - 2] + TX、メパニピリム [1 1 0 2 3 5 - 4 7 - 7] + TX、ピリメタニル [5 3 1 1 2 - 2 8 - 0] + TX、フェンピクロニル [7 4 7 3 8 - 1 7 - 3] + TX、フルジオキソニル [1 3 1 3 4 1 - 8 6 - 1] + TX、ベナラキシル [7 1 6 2 6 - 1 1 - 4] + TX、フララキシル [5 7 6 4 6 - 3 0 - 7] + TX、メタラキシル [5 7 8 3 7 - 1 9 - 1] + TX、R - メタラキシル [7 0 6 3 0 - 1 7 - 0] + TX、オフレース [5 8 8 1 0 - 4 8 - 3] + TX、オキサジキシル [7 7 7 3 2 - 0 9 - 3] + TX、ベノミル [1 7 8 0 4 - 3 5 - 2] + TX、カルベンダジム [1 0 6 0 5 - 2 1 - 7] + TX、デバカルブ [6 2 7 3 2 - 9 1 - 6] + TX、フベリダゾール [3 8 7 8 - 1 9 - 1] + TX、チアベンダゾール [1 4 8 - 7 9 - 8] + TX、クロゾリネット [8 4 3 3 2 - 8 6 - 5] + TX、ジクロゾリン [2 4 2 0 1 - 5 8 - 9] + TX、イプロジオン [3 6 7 3 4 - 1 9 - 7] + TX、マイクロゾリン [5 4 8 6 4 - 6 1 - 8] + TX、プロシミドン [3 2 8 0 9 - 1 6 - 8] + TX、ピンクロゾリン [5 0 4 7 1 - 4 4 - 8] + TX、ボスカリド [1 8 8 4 2 5 - 8 5 - 6] + TX、カルボキシン [5 2 3 4 - 6 8 - 4] + TX、フェンフラム [2 4 6 9 1 - 8 0 - 3] + TX、フルトラニル [6 6 3 3 2 - 9 6 - 5] + TX、メプロニル [5 5 8 1 4 - 4 1 - 0] + TX、オキシカルボキシン [5 2 5 9 - 8 8 - 1] + TX、ベンチオピラド [1 8 3 6 7 5 - 8 2 - 3] + TX、チフルザミド [1 3 0 0 0 0 - 4 0 - 7] + TX、グアザチン [1 0 8 1 7 3 - 9 0 - 6] + TX、ドジン [2 4 3 9 - 1 0 - 3] [1 1 2 - 6 5 - 2] (遊離塩基) + TX、イミノクタジン [1 3 5 1 6 - 2 7 - 3] + TX、アゾキシストロビン [1 3 1 8 6 0 - 3 3 - 8] + TX、ジモキシストロビン [1 4 9 9 6 1 - 5 2 - 4] + TX、エヌステロブリン { Proc. B C P C, Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93 } + TX、フルオキサストロビン [3 6 1 3 7 7 - 2 9 - 9] + TX、クレソキシム - メチル [1 4 3 3 9 0 - 8 9 - 0] + TX、メトミノストロビン [1 3 3 4 0 8 - 5 0 - 1] + TX、トリフロキシストロビン [1 4 1 5 1 7 - 2 1 - 7] + TX、オリザストロビン [2 4 8 5 9 3 - 1 6 - 0] + TX、ピコキシストロビン [1 1 7 4 2 8 - 2 2 - 5] + TX、ピラクロストロビン [1 7 5 0 1 3 - 1 8 - 0] + TX、フェルバム [1 4 4 8 4 - 6 4 - 1] + TX、マンコゼブ [8 0 1 8 - 0 1 - 7] + TX、マネブ [1 2 4 2 7 - 3 8 - 2] + TX、メチラム [9 0 0 6 - 4 2 - 2] + TX、プロピネブ [1 2 0 7 1 - 8 3 - 9] + TX、チラム [1 3 7 - 2 6 - 8] + TX、ジネブ [1 2 1 2 2 - 6 7 - 7] + TX、ジラム [1 3 7 - 3 0 - 4] + TX、カプタホール [2 4 2 5 - 0 6 - 1] + TX、カプタン [1 3 3 - 0 6 - 2] + TX、ジクロフルアニド [1 0 8 5 - 9 8 - 9] + TX、フルオロイミド [4 1 2 0 5 - 2 1 - 4] + TX、ホルペット [1 3 3 - 0 7 - 3] + TX、トリルフルアニド [7 3 1 - 2 7 - 1] + TX、ボルドー液 [8 0 1 1 - 6 3 - 0] + TX、水酸化銅 [2 0 4 2 7 - 5 9 - 2] + TX、オキシ塩化銅 [1 3 3 2 - 4 0 - 7] + TX、硫酸銅 [7 7 5 8 - 9 8 - 7] + TX、酸化銅 [1 3 1 7 - 3 9 - 1] + TX、マンコッパー (man copper) [5 3 9 8 8 - 9 3 - 5] + TX、オキシン銅 [1 0 3 8 0 - 2 8 - 6] + TX、ジノカップ [1 3 1 - 7 2 - 6] + TX、ニトロタール - イソプロピル [1 0 5] 50

5 2 - 7 4 - 6] + TX、エディフェンホス [1 7 1 0 9 - 4 9 - 8] + TX、イプロベ
ンホス [2 6 0 8 7 - 4 7 - 8] + TX、イソプロチオラン [5 0 5 1 2 - 3 5 - 1] +
TX、ホスジフェン [3 6 5 1 9 - 0 0 - 3] + TX、ピラゾホス [1 3 4 5 7 - 1 8 -
6] + TX、トルクロホス - メチル [5 7 0 1 8 - 0 4 - 9] + TX、アシベンゾラル -
S - メチル [1 3 5 1 5 8 - 5 4 - 2] + TX、アニラジン [1 0 1 - 0 5 - 3] + TX
、ベンチアバリカルブ [4 1 3 6 1 5 - 3 5 - 7] + TX、プラストサイジン - S [2 0
7 9 - 0 0 - 7] + TX、キノメチオナト [2 4 3 9 - 0 1 - 2] + TX、クロロネブ [
2 6 7 5 - 7 7 - 6] + TX、クロロタロニル [1 8 9 7 - 4 5 - 6] + TX、シフルフ
エナミド [1 8 0 4 0 9 - 6 0 - 3] + TX、シモキサニル [5 7 9 6 6 - 9 5 - 7] +
TX、ジクロン [1 1 7 - 8 0 - 6] + TX、ジクロシメット [1 3 9 9 2 0 - 3 2 - 4]
+ TX、ジクロメジン [6 2 8 6 5 - 3 6 - 5] + TX、ジクロラン [9 9 - 3 0 - 9]
+ TX、ジエトフェンカルブ [8 7 1 3 0 - 2 0 - 9] + TX、ジメトモルフ [1 1 0
4 8 8 - 7 0 - 5] + TX、SYP - LI 9 0 (フルモルフ) [2 1 1 8 6 7 - 4 7 - 9]
+ TX、ジチアノン [3 3 4 7 - 2 2 - 6] + TX、エタボキサム [1 6 2 6 5 0 - 7
7 - 3] + TX、エトリジアゾール [2 5 9 3 - 1 5 - 9] + TX、ファモキサドン [1
3 1 8 0 7 - 5 7 - 3] + TX、フェナミドン [1 6 1 3 2 6 - 3 4 - 7] + TX、フェ
ノキサニル [1 1 5 8 5 2 - 4 8 - 7] + TX、フェンチン [6 6 8 - 3 4 - 8] + TX
、フェリムゾン [8 9 2 6 9 - 6 4 - 7] + TX、フルアジナム [7 9 6 2 2 - 5 9 - 6]
+ TX、フルオピコリド [2 3 9 1 1 0 - 1 5 - 7] + TX、フルスルファミド [1 0
6 9 1 7 - 5 2 - 6] + TX、フェンヘキサミド [1 2 6 8 3 3 - 1 7 - 8] + TX、ホ
セチル - アルミニウム [3 9 1 4 8 - 2 4 - 8] + TX、ヒメキサゾール [1 0 0 0 4 -
4 4 - 1] + TX、イプロバリカルブ [1 4 0 9 2 3 - 1 7 - 7] + TX、IKF - 9 1
6 (シアゾファミド) [1 2 0 1 1 6 - 8 8 - 3] + TX、カスガマイシン [6 9 8 0 -
1 8 - 3] + TX、メタスルホカルブ [6 6 9 5 2 - 4 9 - 6] + TX、メトラフェノン
[2 2 0 8 9 9 - 0 3 - 6] + TX、ペンシクロン [6 6 0 6 3 - 0 5 - 6] + TX、フ
タリド [2 7 3 5 5 - 2 2 - 2] + TX、ポリオキシン [1 1 1 1 3 - 8 0 - 7] + TX
、プロベナゾール [2 7 6 0 5 - 7 6 - 1] + TX、プロパモカルブ [2 5 6 0 6 - 4 1
- 1] + TX、プロキンアジド [1 8 9 2 7 8 - 1 2 - 4] + TX、ピロキロン [5 7 3
6 9 - 3 2 - 1] + TX、キノキシフェン [1 2 4 4 9 5 - 1 8 - 7] + TX、キントゼ
ン [8 2 - 6 8 - 8] + TX、硫黄 [7 7 0 4 - 3 4 - 9] + TX、チアジニル [2 2 3
5 8 0 - 5 1 - 6] + TX、トリアゾキシド [7 2 4 5 9 - 5 8 - 6] + TX、トリシク
ラゾール [4 1 8 1 4 - 7 8 - 2] + TX、トリホリン [2 6 6 4 4 - 4 6 - 2] + TX
、バリダマイシン [3 7 2 4 8 - 4 7 - 8] + TX、ゾキサミド (RH 7 2 8 1) [1 5
6 0 5 2 - 6 8 - 5] + TX、マンジプロパミド [3 7 4 7 2 6 - 6 2 - 2] + TX、イ
ソピラザム [8 8 1 6 8 5 - 5 8 - 1] + TX、セダキサン [8 7 4 9 6 7 - 6 7 - 6]
+ TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 (9 -
ジクロロメチレン - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 1, 4 - メタノ - ナフタレン - 5 -
イル) - アミド (国際公開第2007/048556号パンフレットに開示される) + TX、3 - ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - カルボン酸 [2 - (2
, 4 - ジクロロフェニル) - 2 - メトキシ - 1 - メチル - エチル] - アミド (国際公開第
2008/148570号パンフレットに開示される) + TX、1 - [4 - [4 - [(5
S) 5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキサゾール -
3 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル] - 2 - [5 - メチ
ル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン + TX、1 -
[4 - [4 - [5 - (2, 6 - ジフルオロフェニル) - 4, 5 - ジヒドロ - 1, 2 - オキ
サゾール - 3 - イル] - 1, 3 - チアゾール - 2 - イル] ピペリジン - 1 - イル] - 2 -
[5 - メチル - 3 - (トリフルオロメチル) - 1H - ピラゾール - 1 - イル] エタノン [
1 0 0 3 3 1 8 - 6 7 - 9]、両方とも国際公開第2010/123791号パンフレット、国際公開第2008/0136
22号パンフレットおよび国際公開第2011/051243号パンフレットの20頁に 50

開示される) + TX、および3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸(3',4',5'-トリフルオロ-ビフェニル-2-イル)-アミド(国際公開第2006/087343号パンフレットに開示される) + TXからなる群から選択される生物学的に活性な化合物。

【0142】

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

10

20

30

40

50

【0143】

上記の活性成分のほとんどは、上記においていわゆる「一般名」で呼ばれ、関連する「ISO一般名」または別の「一般名」が、個々の場合に使用される。表記が「一般名」でない場合、代わりに使用される表記の性質が、特定の化合物について丸括弧中に示され; その場合、IUPAC名、IUPAC/ケミカルアブストラクト名、「化学名」、「慣用名」、「化合物名」または「開発コード」が使用され、あるいは、それらの表記の1つも使用されず、「一般名」も使用されない場合、「代替名」が用いられる。「CAS登録番号」は、ケミカルアブストラクト登録番号を意味する。

【0144】

各組合せにおける任意の2つの成分の質量比は、所望の、例えば、相乗作用を得るように選択される。一般に、質量比は、具体的な成分および幾種類の成分が組合せ中に存在するかに応じて変化するであろう。一般に、本発明の任意の組合せにおける任意の2つの成分間の質量比は、互いに独立して、99:1、98:2、97:3、96:4、95:5、94:6、93:7、92:8、91:9、90:10、89:11、88:12、87:13、86:14、85:15、84:16、83:17、82:18、81:19、80:20、79:21、78:22、77:23、76:24、75:25、74:26、73:27、72:28、71:29、70:30、69:31、68:32、67:33、66:34、65:45、64:46、63:47、62:48、61:49、60:40、59:41、58:42、57:43、56:44、55:45、54:46、53:47、52:48、51:49、50:50、49:51、48:52、47:53、46:54、45:55、44:56、43:57、42:58、41:59、40:60、39:61、38:62、37:63、36:64、35:65、34:66、33:67、32:68、31:69、30:70、29:71、28:72、27:73、26:74、25:75、24:76、23:77、22:78、21:79、20:80、19:81、18:82、17:83、16:84、15:85、14:86、13:87、12:88、11:89、10:90、9:91、8:92、7:93、6:94、5:95、4:96、3:97、2:98から1:99を含む、100:1から1:100である。本発明の任意の2つの成分間の好ましい質量比は、75:1から1:75、より好ましくは、50:1から1.50、特に、25:1から1:25、有利には、10:1から1:10(5:1から1:5、例えば1:3から3:1など)であ

る。混合比は、一方では、質量比を、また、他方ではモル比を含むものと理解される。

【0145】

本発明の化合物およびその組成物のための施用方法、すなわち、農業における有害生物/真菌を防除する方法の例は、噴霧、霧化(a t o m i z i n g)、散布、はけ塗り(b r u s h i n g o n)、粉衣(d r e s s i n g)、拡散(s c a t t e r i n g)または注ぎかけ(p o u r i n g)であり - これらは、そのときの状況における意図される目的に合わせて選択されるべきである。

【0146】

農業における施用の好ましい方法は、植物の茎葉への施用(葉面施用)であり、該当する有害生物/真菌による加害の危険性に合わせて施用頻度および施用量を選択することができる。あるいは、活性成分は、植物の場所に化合物を施用することによって、例えば、化合物の液体組成物を土壤中に(灌注によって)施用することによって、または粒剤の形態の固体形態の化合物を土壤に施用すること(土壤施用)によって、根系(全身作用)を介して植物に到達することができる。水稻植物の場合、このような粒剤は、水田に計量供給され得る。

10

【0147】

ヘクタール当たりの典型的な施用量は、一般に、ヘクタール当たり 1 ~ 2 0 0 0 g の活性成分、特に、10 ~ 1 0 0 0 g / h a、好ましくは、50 ~ 3 0 0 g / h a などの 10 ~ 6 0 0 g / h a である。

20

【0148】

本発明の化合物およびその組成物は、上記のタイプの有害生物からの、植物繁殖材料、例えば、果実、塊茎または穀粒などの種子、または苗の保護にも有用である。繁殖材料は、植え付けの前にこの化合物で処理され得、例えば、種子は、種まきの前に処理され得る。あるいは、この化合物は、種子仁を液体組成物に浸漬することによって、または固体組成物の層を塗布することによって、種子仁に塗付され得る(コーティング)。繁殖材料が施用の場所に植え付けられる場合、この組成物を、例えば、ドリルまき(d r i l l i n g)の際に畝間に施用することも可能である。植物繁殖材料のためのこれらの処理方法およびこのように処理された植物繁殖材料は、本発明のさらなる主題である。典型的な処理率は、植物および防除される有害生物/真菌に応じて決まり、一般に、1 0 0 k g の種子当たり 1 ~ 2 0 0 グラム、好ましくは、1 0 0 k g の種子当たり 5 ~ 1 5 0 グラム(1 0 0 k g の種子当たり 1 0 ~ 1 0 0 グラムなど)である。

30

【0149】

種子という用語は、真正種子(t r u e s e e d)、種子片、吸枝、トウモロコシ粒(c o r n)、鱗茎、果実、塊茎、穀粒、根茎、挿し木、挿し芽(c u t s h o o t)などを含むがこれらに限定されないあらゆる種類の種子および植物の珠芽を包含し、好ましい実施形態において、真正種子を意味する。

【0150】

本発明は、式 I の化合物で被覆または処理されるかあるいはそれを含有する種子も含む。「で被覆または処理されるかおよび/またはそれを含有する」という用語は、一般に、活性成分が、ほとんどの場合、施用時に種子の表面上にあるが、施用方法に応じて、成分の一部が、程度の差はあるが、種子材料中に浸透し得ることを示す。前記種子製品が(再度)植え付けられるとき、活性成分を吸収し得る。一実施形態において、本発明は、式(I)の化合物が付着された植物繁殖材料を利用可能にする。さらに、これによって、式(I)の化合物で処理された植物繁殖材料を含む組成物が利用可能になる。

40

【0151】

種子処理は、種子粉衣、種子コーティング、種子散布、種子浸漬および種子ペレッティング(p e l l e t i n g)などの、当該技術分野において公知の全ての好適な種子処理技術を含む。式 I の化合物の種子処理適用は、種まき/種子の植え付けの前またはその際に噴霧または種子を散布することなどによる、任意の公知の方法によって行われ得る。

【0152】

50

好適な標的植物は、特に、コムギ、オオムギ、ライムギ、オートムギ、イネ、トウモロコシまたはソルガムなどの穀物；テンサイまたは飼料用ビートなどのビート；果実、例えば、リンゴ、西洋ナシ、プラム、モモ、アーモンド、サクランボまたは液果類、例えば、イチゴ、ラズベリーもしくはブラックベリーなどの、仁果類、核果類または柔らかい果物；インゲンマメ、レンズマメ、エンドウマメまたはダイズなどのマメ科植物；ナタネ、カラシナ、ケシ、オリーブ、ヒマワリ、ヤシ、ヒマ、カカオまたはアメリカホドイモ (ground nut) などの油脂植物；カボチャ、キュウリまたはメロンなどのウリ科植物；ワタ、アマ、麻またはジュートなどの纖維植物；オレンジ、レモン、グレープフルーツまたはタンジェリンなどの柑橘類の果物；ホウレンソウ、レタス、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、トマト、ジャガイモまたはピーマンなどの野菜類；アボカド、シナモンまたはショウノウなどのクスノキ科 (Lauraceae) の植物；およびさらにタバコ、堅果類、コーヒー、ナス、サトウキビ、茶、コショウ、ブドウ、ホップ、オオバコ科の植物、ラテックス植物および観賞植物（花、および芝草または芝生など）である。

10

【0153】

一実施形態において、植物は、穀物、トウモロコシ、ダイズ、イネ、サトウキビ、野菜類および油脂植物から選択される。

【0154】

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

20

【0155】

このようなトランスジェニック植物によって発現され得る毒素としては、例えば、セレウス菌 (Bacillus cereus) またはバチルス・ポピリエ (Bacillus popilliae) に由来する殺虫タンパク質；または - エンドトキシン、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9Cなどの、バチルス・チューリングエンシス (Bacillus thuringiensis) に由来する殺虫タンパク質、または植物性殺虫タンパク質 (Vip) 、例えばVip1、Vip2、Vip3もしくはVip3A；または細菌コロニー形成線虫、例えば、フォトラブダス・ルミネセンス (Photorhabdus luminescens) 、キセノラブダス・ネマトフィルス (Xenorhabdus nematophilus) などのフォトラブダス属 (Photorhabdus spp.) またはキセノラブダス属 (Xenorhabdus spp.) の殺虫タンパク質；サソリ毒素、クモ形類毒素、ハチ毒素および他の昆虫に特有の神経毒素などの、動物によって產生される毒素；ストレプトマイセス属 (Streptomyces) 毒素などの、真菌によって產生される毒素、エンドウレクチン、オオムギレクチンまたはユキノハナレクチンなどの植物レクチン；凝集素；トリプシン阻害剤、セリンプロテアーゼ阻害剤、パタチン、シスタチン、パパイン阻害剤などのプロティナーゼ阻害剤；リシン、トウモロコシ - RIP、アブリン、ルフィン、サポリンまたはブリオジンなどのリボソーム不活性化タンパク質 (RIP) ；3 - ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド - UDP - グリコシリ - トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン阻害剤、HMG - COA - レダクターなどのステロイド代謝酵素、ナトリウムチャネルまたはカルシウムチャネルの遮断薬などのイオンチャネル遮断薬、幼若ホルモンエステラーゼ、利尿剤ホルモン受容体、スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼおよびグルカナーゼが挙げられる。

30

【0156】

本発明に関して、 - エンドトキシンは、例えばCry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1もしくはCry9C、または植物性殺虫タンパク質 (Vip) 、例えばVip1、Vip2、Vip3もしく

40

50

は V i p 3 A 、また、明確に、ハイブリッド毒素、切断毒素 (t r u n c a t e d t o x i n) および改变毒素によって理解される。ハイブリッド毒素は、それらのタンパク質の異なるドメインの新たな組合せによって組み換えにより產生される (例えば、国際公開第 0 2 / 1 5 7 0 1 号パンフレットを参照) 。切断毒素、例えば、切断 C r y 1 A b が公知である。改变毒素の場合、天然毒素の 1 つ以上のアミノ酸が置換される。このようなアミノ酸置換では、好ましくは、天然に存在しないプロテアーゼ認識配列が、毒素に挿入され、例えば、 C r y 3 A 0 5 5 の場合、カテプシン - G - 認識配列が、 C r y 3 A 毒素に挿入される (国際公開第 0 3 / 0 1 8 8 1 0 号パンフレットを参照) 。

【 0 1 5 7 】

このような毒素またはこのような毒素を合成することが可能なトランスジェニック植物の例が、例えば、欧州特許出願公開第 0 3 7 4 7 5 3 号明細書、国際公開第 9 3 / 0 7 2 7 8 号パンフレット、国際公開第 9 5 / 3 4 6 5 6 号パンフレット、欧州特許出願公開第 0 4 2 7 5 2 9 号明細書、欧州特許出願公開第 4 5 1 8 7 8 号明細書および国際公開第 0 3 / 0 5 2 0 7 3 号パンフレットに開示されている。

10

【 0 1 5 8 】

このようなトランスジェニック植物の調製のための方法は、当業者に一般に知られており、例えば、上記の刊行物に記載されている。 C r y I 型のデオキシリボ核酸およびそれらの調製が、例えば、国際公開第 9 5 / 3 4 6 5 6 号パンフレット、欧州特許出願公開第 0 3 6 7 4 7 4 号明細書、欧州特許出願公開第 0 4 0 1 9 7 9 号明細書および国際公開第 9 0 / 1 3 6 5 1 号パンフレットから公知である。

20

【 0 1 5 9 】

トランスジェニック植物に含まれる毒素は、害虫に対する耐性を植物に与える。このような昆虫は、昆虫の分類群において見られるが、カブトムシ (鞘翅目 (C o l e o p t e r a)) 、双翅昆虫 (双翅目 (D i p t e r a)) およびチョウ (鱗翅目 (L e p i d o p t e r a)) において特に一般的にみられる。

【 0 1 6 0 】

殺虫剤耐性 (i n s e c t i c i d a l r e s i s t a n c e) をコードし、1 つ以上の毒素を発現する 1 つ以上の遺伝子を含むトランスジェニック植物が公知であり、それらのいくつかが、市販されている。このような植物の例は、 Y i e l d G a r d (登録商標) (C r y 1 A b 毒素を発現するトウモロコシ変種) ; Y i e l d G a r d R o o t w o r m (登録商標) (C r y 3 B b 1 毒素を発現するトウモロコシ変種) ; Y i e l d G a r d P l u s (登録商標) (C r y 1 A b および C r y 3 B b 1 毒素を発現するトウモロコシ変種) ; S t a r l i n k (登録商標) (C r y 9 C 毒素を発現するトウモロコシ変種) ; H e r c u l e x I (登録商標) (C r y 1 F a 2 毒素、および除草剤グルホシネットアンモニウムに対する耐性を得るために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 (P A T) を発現するトウモロコシ変種) ; N u C O T N 3 3 B (登録商標) (C r y 1 A c 毒素を発現するワタ変種) ; B o l l g a r d I (登録商標) (C r y 1 A c 毒素を発現するワタ変種) ; B o l l g a r d I I (登録商標) (C r y 1 A c および C r y 2 A b 毒素を発現するワタ変種) ; V i p C o t (登録商標) (V i p 3 A および C r y 1 A b 毒素を発現するワタ変種) ; N e w L e a f (登録商標) (C r y 3 A 毒素を発現するジャガイモ変種) ; N a t u r e G a r d (登録商標) 、 A g r i s u r e (登録商標) G T A d v a n t a g e (G A 2 1 グリホサート耐性形質) 、 A g r i s u r e (登録商標) C B A d v a n t a g e (B t 1 1 アワノメイガ (C B) 形質) および P r o t e c t a (登録商標) である。

30

【 0 1 6 1 】

このようなトランスジェニック植物のさらなる例は以下のとおりである :

1 . S y n g e n t a S e e d s S A S (C h e m i n d e l ' H o b i t 2 7 , F - 3 1 7 9 0 S t . S a u v e u r , F r a n c e) 製の B t 1 1 トウモロコシ、登録番号 C / F R / 9 6 / 0 5 / 1 0 。切断 C r y 1 A b 毒素のトランスジェニック発現によって、ヨーロッパアワノメイガ (アワノメイガ (O s t r i n i a n u b i l

40

50

alis) およびセサミア・ノナグリオイデス (Sesamia nonagrioides) による攻撃に対する耐性を与えた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt11トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。

2. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France) 製のBt176トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。Cry1Ab毒素のトランスジェニック発現によって、ヨーロッパアワノメイガ(アワノメイガ(Ostrinia nubilalis) およびセサミア・ノナグリオイデス(Sesamia nonagrioides) による攻撃に対する耐性を与えた遺伝子組み換えトウモロコシ。Bt176トウモロコシは、除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るために酵素PATも遺伝子組み換えにより発現する。
10

3. Syngenta Seeds SAS (Chemin de l'Hobit 27, F-31790 St. Sauveur, France) 製のMIR604トウモロコシ、登録番号C/FR/96/05/10。改変Cry3A毒素のトランスジェニック発現によって、耐虫性にされたトウモロコシ。この毒素は、カテプシン-G-プロテアーゼ認識配列の挿入によって修飾されたCry3A055である。このようなトランスジェニックトウモロコシ植物の調製が、国際公開第03/018810号パンフレットに記載されている。

4. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のMON863トウモロコシ、登録番号C/DE/02/9。MON863は、Cry3Bb1毒素を発現し、特定の鞘翅目(Coleoptera)昆虫に対する耐性を有する。
20

5. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のIPC531ワタ、登録番号C/ES/96/02。

6. Pioneer Overseas Corporation (Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium) 製の1507トウモロコシ、登録番号C/NL/00/10。特定の鱗翅目(Lepidoptera)昆虫に対する耐性を得るためにタンパク質Cry1F、および除草剤グルホシネートアンモニウムに対する耐性を得るためにPATタンパク質の発現のための遺伝子組み換えトウモロコシ。
30

7. Monsanto Europe S.A. (270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium) 製のNK603 × MON810トウモロコシ、登録番号C/GB/02/M3/03。遺伝子組み換え変種NK603およびMON810を交配することによる従来法で育種した雑種トウモロコシ変種からなる。NK603 × MON810トウモロコシは、除草剤Roundup(登録商標)(グリホサートを含有する)に対する耐性を与える、アグロバクテリウム属(Agrobacterium sp.)菌株CP4から得られるタンパク質CP4EPSPS、およびヨーロッパアワノメイガを含む特定の鱗翅目(Lepidoptera)に対する耐性をもたらす、バチルス・チューリングンシス亞種クルスターキ(Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)から得られるCry1Ab毒素も遺伝子組み換えにより発現する。
40

【0162】

一般に、本発明の化合物は、担体を含有する組成物(例えば製剤)の形態で使用される。本発明の化合物およびその組成物は、エアゾールディスペンサ、カプセル懸濁液、冷煙霧濃縮物(cold fogging concentrate)、粉剤、乳化性濃縮物、水中油乳剤、油中水乳剤、カプセル化した粒剤、細粒剤、種子処理用のフロアブル剤、(加圧)ガス、ガス生成剤(gas generating product)、粒剤、温煙霧濃縮物(hot fogging concentrate)、大型粒剤(mac
50

ro granule)、微粒剤(micro granule)、油分散性粉剤、油混和性フロアブル剤、油混和性液体、ペースト、植物用棒状剤(plant rodlet)、乾燥種子処理用の粉剤、農薬で被覆された種子、可溶性濃縮物、可溶性粉剤、種子処理用の液剤、懸濁濃縮物(フロアブル剤)、微量散布用液剤(ultra low volume (ulv) liquid)、微量散布用懸濁剤(ultra low volume (ulv) suspension)、顆粒水和剤または水分散性錠剤、スラリー処理用の水和剤(water dispersible powder for slurry treatment)、水溶性粒剤または水溶性錠剤、種子処理用の水溶性粉剤および水和剤などの様々な形態で使用され得る。

【0163】

10

製剤は、典型的に、液体または固体担体および、任意に、固体または液体助剤であり得る1つ以上の通例の製剤助剤、例えば、非エポキシ化またはエポキシ化植物油(例えばエポキシ化ヤシ油、ナタネ油またはダイズ油)、消泡剤、例えば、シリコーン油、防腐剤、粘土、無機化合物、粘性調節剤、界面活性剤、結合剤および/または粘着付与剤を含む。この組成物は、本発明の化合物と、殺菌剤、殺真菌剤、抗線虫剤、植物活性化剤、殺ダニ剤、および殺虫剤などの1つ以上の他の生物学的に活性な物質との組合せを含むだけでなく、肥料、微量栄養素供与体(micronutrient donor)または植物の成長に影響を与える他の調製物もさらに含み得る。

【0164】

20

したがって、本発明は、本発明の化合物と、農学的に担体と、任意の1つ以上の通例の製剤助剤とを含む組成物も利用可能にする。

【0165】

この組成物は、例えば、本発明の固体化合物を粉碎し、篩にかけ、および/または圧縮することによって、助剤の非存在下で、および、例えば、本発明の化合物を、1つまたは複数の助剤と均質混合し、および/または粉碎することによって、少なくとも1つの助剤の存在下で、それ自体公知の方法で調製される。本発明の固体化合物の場合、化合物の粉碎/ミリングは、特定の粒径を確保するために行われる。この組成物の調製のためのこれら的方法およびこれらの組成物の調製のための本発明の化合物の使用も本発明の主題である。

【0166】

30

農業に使用するための組成物の例は、乳剤、懸濁濃縮物、マイクロエマルション、油分散性の、直接噴霧可能または希釈可能な液剤、延展可能なペースト、希釈乳剤、可溶性粉剤、分散性粉剤、水和剤、ダスト剤(dust)、粒剤またはポリマー物質中の封入物であり、これは、-少なくとも-本発明に係る化合物を含み、組成物のタイプは、意図される目的およびそのときの状況に合わせて選択されるべきである。

【0167】

好適な液体担体の例は、非水素化または部分的に水素化された芳香族炭化水素、好ましくは、キシレン混合物、アルキル化ナフタレンまたはテトラヒドロナフタレンなどのアルキルベンゼンのC₈~C₁₂留分、パラフィンまたはシクロヘキサンなどの脂肪族または脂環式炭化水素、エタノール、プロパノールまたはブタノール、グリコールなどのアルコールならびにプロピレングリコール、ジプロピレングリコールエーテル、エチレングリコールまたはエチレングリコールモノメチルエーテルまたはエチレングリコールモノエチルエーテルなどの、それらのエーテルおよびエステル、シクロヘキサン、イソホロンまたはジアセトンアルコールなどのケトン、N-メチルピロリド-2-オン、ジメチルスルホキシドまたはN,N-ジメチルホルムアミドなどの強い極性の溶媒、水、非エポキシ化またはエポキシ化ナタネ油、ヒマシ油、ヤシ油またはダイズ油、およびシリコーン油などのエポキシ化またはエポキシ化植物油である。

【0168】

例えば、ダスト剤および分散性粉剤に使用される固体担体の例は、一般に、方解石、タルク、カオリン、モンモリロナイトまたはアタパルジャイトなどの粉碎された天然鉱物で

40

50

ある。物理的特性を向上させるために、高度に分散したシリカまたは高度に分散した吸収性ポリマーを加えることも可能である。粒剤のための好適な粒子状吸着性担体は、軽石、レンガ砂（brick grit）、海泡石またはベントナイトなどの多孔質型であり、好適な非吸収性担体材料は、方解石または砂である。さらに、多くの無機性または有機性的粒状材料、特に、ドロマイトまたは粉碎した植物残渣が使用され得る。

【0169】

好適な表面活性化合物は、製剤化される活性成分のタイプに応じて、良好な乳化、分散および湿潤特性を有する非イオン性、カチオン性および／またはアニオン界面活性剤あるいは界面活性剤混合物である。後述される界面活性剤は、例としてみなされるに過ぎず；製剤化の技術分野において通常使用され、および本発明にしたがって好適な多くのさらなる界面活性剤が、関連文献に記載されている。

10

【0170】

好適な非イオン性界面活性剤は、特に、脂肪族または脂環式アルコールのポリグリコールエーテル誘導体、飽和または不飽和脂肪酸のポリグリコールエーテル誘導体、またはアルキルフェノールのポリグリコールエーテル誘導体であり、これは、約3～約30個のグリコールエーテル基および約8～約20個の炭素原子を（環状）脂肪族炭化水素基に含有し得、または約6～約18個の炭素原子をアルキルフェノールのアルキル部分に含有し得る。アルキル鎖中の1～約10個の炭素原子および約20～約250個のエチレングリコールエーテル基および約10～約100個のプロピレングリコールエーテル基を有する、ポリプロピレングリコール、エチレンジアミノポリプロピレングリコールまたはアルキルポリプロピレングリコールとの水溶性ポリエチレンオキシド付加物も好適である。通常、上記の化合物は、1つのプロピレングリコール単位につき1～約5つのエチレングリコール単位を含む。挙げられる例は、ノニルフェノキシポリエトキシエタノール、ヒマシ油ポリグリコールエーテル、ポリプロピレングリコール／ポリエチレンオキシド付加物、トリプチルフェノキシポリエトキシエタノール、ポリエチレングリコールまたはオクチルフェノキシポリエトキシエタノールである。ポリオキシエチレンソルビタントリオレエートなどのポリオキシエチレンソルビタンの脂肪酸エステルも好適である。

20

【0171】

カチオン性界面活性剤は、特に、置換基として約8～約22個のC原子を有する少なくとも1つのアルキル基およびさらなる置換基として（非ハロゲン化またはハロゲン化）低級アルキルまたはヒドロキシアルキルまたはベンジル基を一般に有する第四級アンモニウム塩である。塩は、好ましくは、ハロゲン化物、メチル硫酸塩またはエチル硫酸塩の形態である。例は、塩化ステアリルトリメチルアンモニウムおよび臭化ベンジルビス（2-クロロエチル）エチルアンモニウムである。

30

【0172】

好適なアニオン界面活性剤の例は、水溶性の石けんまたは水溶性の合成表面活性化合物である。好適な石けんの例は、オレイン酸またはステアリン酸の、または例えば、ヤシ油またはトール油から得られる天然脂肪酸混合物のナトリウム塩またはカリウム塩などの、約10～約22個のC原子を有する脂肪酸のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩または（非置換または置換）アンモニウム塩であり；脂肪酸メチルタウレートも挙げられるべきである。しかしながら、合成界面活性剤、特に、脂肪族スルホネート、脂肪族サルフェート、スルホン酸化ベンズイミダゾール誘導体またはアルキルアリールスルホネートがより高い頻度で使用される。一般に、脂肪族スルホネートおよび脂肪族サルフェートは、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩または（置換または非置換）アンモニウム塩として存在し、一般に、約8～約22個のC原子のアルキル基を有し、アルキルはまた、アシリル基のアルキル部分を含むものと理解されるべきであり；その挙げられる例は、リグノスルホ酸の、ドデシル硫酸エステルのまたは天然の脂肪酸から調製される脂肪族アルコールサルフェート混合物のナトリウム塩またはカルシウム塩である。この基は、脂肪族アルコール／エチレンオキシド付加物の硫酸エステルおよびスルホン酸の塩も含む。スルホン酸化ベンズイミダゾール誘導体は、好ましくは、2つのスルホニル基および約8～約22個のC

40

50

原子の脂肪酸基を含む。アルキルアリールスルホネートの例は、デシルベンゼンスルホ酸の、ジブチルナフタレンスルホン酸のまたはナフタレンスルホン酸／ホルムアルデヒド縮合物のナトリウム塩、カルシウム塩またはトリエタノールアンモニウム塩である。さらに、p-ノニルフェノール／(4-14)エチレンオキシド付加物のリン酸エステル、またはリン脂質の塩などの好適なホスフェートも可能である。

【0173】

一般に、この組成物は、0.1～99%、特に、0.1～95%の、本発明に係る化合物と、1～99.9%、特に、5～99.9%の、少なくとも1つの固体または液体担体とを含み、一般に、組成物の0～25%、特に、0.1～20%が、界面活性剤であることが可能である(% はそれぞれ、重量パーセントを意味する)。濃縮された組成物が商品として好ましい傾向があるが、最終消費者は、一般に、かなり低い濃度の活性成分を有する希釈組成物を使用する。好ましい組成物は、特に以下のように構成される(% = 重量パーセント) :

【0174】

乳剤 :

活性成分 : 1～95%、好ましくは5～20%

界面活性剤 : 1～30%、好ましくは10～20%

溶媒 : 5～98%、好ましくは70～85%

【0175】

ダスト剤 :

活性成分 : 0.1～10%、好ましくは0.1～1%

固体担体 : 99.9～90%、好ましくは99.9～99%

【0176】

懸濁濃縮物およびフロアブル剤 :

活性成分 : 5～75%、好ましくは10～50%

水 : 94～24%、好ましくは88～30%

界面活性剤 : 1～40%、好ましくは2～30%

【0177】

水和剤 :

活性成分 : 0.5～90%、好ましくは1～80%

界面活性剤 : 0.5～20%、好ましくは1～15%

固体担体 : 5～99%、好ましくは15～98%

【0178】

粒剤 :

活性成分 : 0.5～30%、好ましくは3～15%

固体担体 : 99.5～70%、好ましくは97～85%

【0179】

10

20

30

【表28】

製剤化実施例(%=重量パーセント)

実施例 F1:乳剤濃縮物	a)	b)	c)	
活性成分	25 %	40 %	50 %	
ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム	5 %	8 %	6 %	
ヒマシ油ポリエチレングリコールエーテル				
(36 モルの EO)	5 %	-	-	10
トリプチルフェノキシポリエチレングリコールエーテル				
(30 モルの EO)	-	12 %	4 %	
シクロヘキサン	-	15 %	20 %	
キシレン混合物	65 %	25 %	20 %	

【0180】

任意の所望の濃度の乳剤が、水による希釈によってこのような濃縮物から調製され得る。

【0181】

【表29】

実施例 F2:液剤	a)	b)	c)	d)	
活性成分	80 %	10 %	5 %	95 %	
エチレングリコールモノメチルエーテル	20 %	-	-	-	
ポリエチレングリコール(分子量 400)	-	70 %	-	-	
N-メチルピロリド-2-オン	-	20 %	-	-	
エポキシ化ヤシ油	-	-	1 %	5 %	
石油エーテル(沸点範囲: 160~190°)	-	-	94 %	-	30

【0182】

この液剤は、微液滴の形態で使用するのに好適である。

【0183】

【表30】

実施例 F3:粒剤	a)	b)	c)	d)	
活性成分	5 %	10 %	8 %	21 %	
カオリン	94 %	-	79 %	54 %	
高度に分散したシリカ	1 %	-	13 %	7 %	
アタパルジャイト	-	90 %	-	18 %	40

【0184】

活性成分は、ジクロロメタンに溶解され、その溶液が、担体に噴霧され、その後、溶媒が、減圧下で蒸発される。

【0185】

【表31】

<u>実施例F4:ダスト剤</u>	a)	b)
活性成分	2 %	5 %
高度に分散したシリカ	1 %	5 %
タルク	97 %	-
カオリン	-	90 %

【0186】

即時使用可能なダスト剤が、担体および活性成分を均質混合することによって得られる 10
。

【0187】

【表32】

<u>実施例F5:水和剤</u>	a)	b)	c)
活性成分	25 %	50 %	75 %
リグノスルホン酸ナトリウム	5 %	5 %	-
ラウリル硫酸ナトリウム	3 %	-	5 %
ジイソブチルナフタレンスルホン酸ナトリウム	-	6 %	10 %
オクチルフェノキシポリエチレングリコールエーテル (7~8モルのEO)	-	2 %	-
高度に分散したシリカ	5 %	10 %	10 %
カオリン	62 %	27 %	-

【0188】

活性成分は、添加剤と混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎される。これにより、水和剤が得られ、これは、水で希釈されて、任意の所望の濃度の懸濁液が得られる。 20

【0189】

実施例F6:押出粒剤

活性成分: 10 %

リグノスルホン酸ナトリウム: 2 %

カルボキシメチルセルロース: 1 %

カオリン: 87 %

活性成分は、添加剤と混合され、混合物は、粉碎され、水で濡らされ、押し出され、粒状にされ、空気流中で乾燥される。 30

【0190】

実施例F7:被覆粒剤

活性成分: 3 %

ポリエチレングリコール(分子量200): 3 %

カオリン: 94 %

ミキサー中で、微粉化された活性成分は、ポリエチレングリコールで濡らされたカオリンに均一に適用される。これにより、ほこりのない被覆された粒剤が得られる。 40

【0191】

実施例F8:懸濁濃縮物

活性成分: 40 %

エチレングリコール: 10 %

ノニルフェノキシポリエチレングリコールエーテル(15モルのEO): 6 % 50

リグノスルホン酸ナトリウム : 10 %
 カルボキシメチルセルロース : 1 %
 37 % のホルムアルデヒド水溶液 : 0.2 %
 シリコーン油 (75 % の水性乳剤) : 0.8 %
 水 : 32 %

微粉化された活性成分は、添加剤と均質混合される。任意の所望の濃度の懸濁液が、水による希釈によって、このように得られた懸濁濃縮物から調製され得る。

【0192】

【表33】

実施例F9:乾燥種子処理用の粉剤	a)	b)	c)
活性成分	25 %	50 %	75 %
軽油	5 %	5 %	5 %
高度に分散したケイ酸	5 %	5 %	-
カオリン	65 %	40 %	-
タルカム	-	-	20 %

10

【0193】

この組合せは、補助剤と十分に混合され、混合物が、好適なミルにおいて十分に粉碎され、種子処理に直接使用され得る粉剤が得られる。

【0194】

実施例F10:乳化性濃縮物

活性成分 : 10 %

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

ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム : 3 %

ヒマシ油ポリグリコールエーテル (35モルのエチレンオキシド) : 4 %

シクロヘキサン : 30 %

キシレン混合物 : 50 %

30

植物保護に使用され得る、任意の所要の希釈率の乳剤が、水による希釈によって、この濃縮物から得られる。

【0195】

実施例F11:種子処理用のフロアブル剤

活性成分 : 40 %

プロピレングリコール : 5 %

コポリマーブタノールPO/EO : 2 %

10~20モルのEOを含むトリスチレンフェノール : 2 %

1,2-ベンズイソチアゾリン-3-オン (水中20 % の溶液の形態) : 0.5 %

モノアゾ-顔料カルシウム塩 : 5 %

40

シリコーン油 (水中75 % の乳剤の形態) : 0.2 %

水 : 45.3 %

この微粉化された組合せは、補助剤と均質混合され、懸濁濃縮物が得られ、この懸濁濃縮物から、任意の所望の希釈率の懸濁液が、水による希釈によって得られる。このような希釈を用いて、生きた植物ならびに植物繁殖材料が処理され、噴霧、注ぎかけまたは浸漬によって、微生物による加害から保護され得る。

【0196】

プレミックス組成物用の茎葉製剤タイプの例は、以下のとおりである:

G R : 粒剤

W P : 水和剤

50

W G : 水和性顆粒 (粉剤)

S G : 水溶性粒剤

S L : 可溶濃縮剤

E C : 乳化性濃縮物

E W : 水中油乳剤

M E : マイクロエマルション

S C : 水性懸濁濃縮物

C S : 水性カプセル懸濁剤

O D : 油系懸濁濃縮物、および

S E : 水性サスペンション (s u s p e n s i o n) 。

10

【 0197 】

一方、プレミックス組成物用の種子処理製剤タイプの例は、以下のとおりである：

W S : 種子処理スラリー用の水和剤

L S : 種子処理用の液剤

E S : 種子処理用の乳剤

F S : 種子処理用の懸濁濃縮物

W G : 水和性顆粒、および

C S : 水性カプセル懸濁剤。

【 0198 】

タンクミックス (t a n k - m i x) 組成物に好適な製剤タイプの例は、液剤、希釈乳剤、懸濁剤、またはそれらの混合物、およびダスト剤である。

20

【 0199 】

製剤の性質と同様に、葉面施用、灌注、噴霧、霧化、散布、拡散、塗布または注ぎかけなどの施用方法は、意図される目的およびそのときの状況に応じて選択される。

【 0200 】

タンクミックス組成物は、一般に、異なる有害生物防除剤、および任意にさらなる助剤を含有する1つ以上のプレミックス組成物を溶媒 (例えば、水) で希釈することによって調製される。

【 0201 】

好適な担体および補助剤は、固体または液体であり得、製剤化技術に通常用いられる物質、例えば、天然または再生鉱物物質、溶媒、分散剤、湿潤剤、粘着付与剤、増粘剤、結合剤または肥料である。

30

【 0202 】

一般に、葉面施用または土壤施用のためのタンクミックス製剤は、0.1 ~ 20%、特に、0.1 ~ 15%の所望の成分、および99.9 ~ 80%、特に、99.9 ~ 85%の固体または液体助剤 (例えば、水などの溶媒を含む) を含み、助剤は、タンクミックス製剤を基準にして、0 ~ 20%、特に、0.1 ~ 15%の量の界面活性剤であり得る。

【 0203 】

典型的に、葉面施用のためのプレミックス製剤は、0.1 ~ 99.9%、特に、1 ~ 95%の所望の成分、および99.9 ~ 0.1%、特に、99 ~ 5%の固体または液体補助剤 (例えば、水などの溶媒を含む) を含み、助剤は、プレミックス製剤を基準にして、0 ~ 50%、特に、0.5 ~ 40%の量の界面活性剤であり得る。

40

【 0204 】

通常、種子処理施用のためのタンクミックス製剤は、0.25 ~ 80%、特に、1 ~ 75%の所望の成分、および99.75 ~ 20%、特に、99 ~ 25%の固体または液体助剤 (例えば、水などの溶媒を含む) を含み、助剤は、タンクミックス製剤を基準にして、0 ~ 40%、特に、0.5 ~ 30%の量の界面活性剤であり得る。

【 0205 】

典型的に、種子処理施用のためのプレミックス製剤は、0.5 ~ 99.9%、特に、1 ~ 95%の所望の成分、および99.5 ~ 0.1%、特に、99 ~ 5%の固体または液体

50

補助剤（例えば、水などの溶媒を含む）を含み、助剤は、プレミックス製剤を基準にして、0～50%、特に、0.5～40%の量の界面活性剤であり得る。

【0206】

市販の製品は、好ましくは、濃縮物（例えば、プレミックス組成物（製剤））として製剤化されるであろうが、最終使用者は、通常、希釈製剤（例えば、タンクミックス組成物）を用いるであろう。

【0207】

好ましい種子処理プレミックス製剤は、水性懸濁濃縮物である。この製剤は、流動床技術、ローラーミル法、ロトスタティック種子処理機（rotostatic seed treater）、およびドラムコーティング機（drum coaters）などの、従来の処理技術および機械を用いて種子に施用され得る。噴流床などの他の方法も有用であり得る。種子は、塗布の前に予め分級され得る。塗布の後、種子は、典型的に、乾燥され、次に、分級のために分級機に移される。このような手順は、当該技術分野において公知である。

10

【0208】

一般に、本発明のプレミックス組成物は、0.5～99.9、特に、1～95、有利には、1～50質量%の所望の成分、および99.5～0.1、特に、99～5質量%の固体または液体補助剤（例えば、水などの溶媒を含む）を含有し、助剤（または補助剤）は、プレミックス製剤の質量を基準にして、0～50、特に、0.5～40質量%の量の界面活性剤であり得る。

20

【0209】

式（I）の化合物は、いずれの他の実施形態からも独立した好ましい実施形態において、植物繁殖材料処理（または保護）組成物の形態であり、前記植物繁殖材料保護組成物は、着色料をさらに含む。植物繁殖材料保護組成物または混合物は、処理される植物繁殖材料への活性成分の付着性を向上させる水溶性および水分散性塗膜形成ポリマーからの少なくとも1つのポリマーも含んでいてもよく、このポリマーは、一般に、少なくとも10,000～約100,000の平均分子量を有する。

【0210】

本発明の組合せ（すなわち、本発明の化合物および1つ以上の他の生物学的活性剤を含む組合せ）は、同時にまたは順次施用され得る。

30

【0211】

組合せの成分が、順次（すなわち、相次いで）施用される場合、成分は、数時間または数日間などの、生物学的性能を得るために互いの適度な期間内に順次施用される。組合せの成分を施用する順序、すなわち、式（I）の化合物を最初に施用するか否かは、本発明の実施にとって重要ではない。

【0212】

組合せの成分が、本発明において同時に施用される場合、それらは、組合せを含む組成物として施用されてもよく、その場合、（A）組合せにおける式（I）の化合物および1つ以上の他の成分が、別の製剤供給源から得られ、互いに混合されるか（タンクミックス、即時に施用可能（ready-to-apply）、スプレー・ロス（spray bath）、またはスラリーとして公知である）、または（B）式（I）の化合物および1つ以上の他の成分が、単一の製剤混合物供給源として得られる（プレミックス、レディミックス（ready-mix）、濃縮物、または配合済みの製品として公知である）。

40

【0213】

他の実施形態から独立した一実施形態において、本発明に係る化合物は、組合せとして施用される。したがって、本発明は、本明細書に記載される本発明に係る化合物と、1つ以上の他の生物学的活性剤と、任意に1つ以上の通例の製剤助剤とを含む組成物も提供し；これは、タンクミックスまたはプレミックス組成物の形態であり得る。

【0214】

生物学的活性に関する実際の相乗作用の代わりに、本発明に係る組合せは、より広い意

50

味で、相乗活性として表すこともできる意外な有利な特性も有し得る。挙げられるこのような有利な特性の例は、製剤化中および／または施用の際、例えば、粉碎、篩分け、乳化、溶解または分散の際の有利な挙動；向上した貯蔵安定性；向上した光に対する安定性；より有利な分解性；向上した毒物学的および／または生態毒性挙動；または当業者に周知の任意の他の利点である。

【 0 2 1 5 】

本発明の化合物は、貯蔵品および貯蔵室の保護、原料（木材および織物など）、床仕上げ材および建築物の保護、および衛生管理において - 特に、有害生物からのヒト、家畜および生産性家畜（productive livestock）の保護のうちの1つ以上などの他の分野においても用途があり得る。したがって、本発明は、このような使用のための殺虫組成物およびそのための方法も利用可能にする。この組成物は、特定の使用の際に使用のために改変される必要がなく、当業者は、任意の特定の使用のためにこのような組成物を利用可能にすることができるであろう。

【 0 2 1 6 】

衛生分野において、本発明に係る組成物は、カタダニ（hard tick）、ヒメダニ（soft tick）、疥癬ダニ、ツツガムシ、ハエ（サシバエおよび舐性（licking）のハエ）、寄生性のハエ幼虫、シラミ、ケジラミ、ハジラミおよびノミなどの外部寄生生物に対して有効である。

このような寄生生物の例は以下のとおりである：

- シラミ目 (Anoplurida) のうち: ブタジラミ属 (Haematopinus spp.)、ホソジラミ属 (Linognathus spp.)、ペディクルス属 (Pediculus spp.) およびケジラミ属 (Phthirus spp.)、ソレノポテス属 (Solenopotes spp.)。

- ハジラミ目 (Mallrophagida) のうち: トリメノポン属 (Trimenopon spp.)、タンカクハジラミ属 (Menopon spp.)、トリノトン属 (Trinoton spp.)、ボビコラ属 (Bovicola spp.)、ウェルネッキエラ属 (Werneckiella spp.)、レピケントロン属 (Lepikentron spp.)、ダマリナ属 (Damalina spp.)、トリコデクテス属 (Trichodectes spp.) およびフェリコラ属 (Felicola spp.)。

- 双翅目 (Diptera) ならびにその亜目であるネマトセリナ亜目 (Nematocephalina) および短角亜目 (Brachycerina) のうち、例えば、ヤブカ属 (Aedes spp.)、ハマダラカ属 (Anopheles spp.)、イエカ属 (Culex spp.)、ブヨ属 (Simulium spp.)、ツノマユブユ属 (Eusimulium spp.)、サシチョウバエ属 (Phlebotomus spp.)、ルツォミヤ属 (Lutzomyia spp.)、キュリコイデス属 (Culicoides spp.)、メクラアブ属 (Chrysops spp.)、ヒボミトラ属 (Hybomitra spp.)、キイロアブ属 (Atylotus spp.)、アブ属 (Tabanus spp.)、ゴマアブ属 (Haematopota spp.)、フィリポミア属 (Philopomyia spp.) ブラウラ属 (Braula

、シドリホモジニ属 (Acalyptratae spp.) 、シジミホモジニ属 (Lycoperdidae spp.) 、イエバエ属 (Musca spp.) 、トゲアシメマトイ属 (Hydrotaea spp.) 、サシバエ属 (Stomoxys spp.) 、ヘマトビア属 (Haematobia spp.) 、モレリア属 (Morellia spp.) 、ヒメイエバエ属 (Fannia spp.) 、ツェツエバエ属 (Glossina spp.) 、オオクロバエ属 (Calliphora spp.) 、キンバエ属 (Lucilia spp.) 、オビキンバエ属 (Chrysomyia spp.) 、ヴォールファールトニクバエ属 (Wohlfahrtia spp.) 、ニクバエ属 (Sarcophaga spp.) 、ヒツジバエ属 (Oestrus spp.) 、ウシバエ属 (Hypoderma spp.) 、ウマバエ属 (Gasterophilus spp.) 、シラミバエ属 (Hippoboscidae spp.) 、シカシラミバエ属 (Lipoptena spp.) 、

pp.) およびヒツジシラミバエ属 (*Melophagus* spp.)。

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

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

- ゴキブリ目 (*Blattarida*) のうち、例えば、トウヨウゴキブリ (*Blatta orientalis*)、ワモンゴキブリ (*Periplaneta americana*)、チャバネゴキブリ (*Blattelagermanica*) およびスペラ属 (*Supella* spp.)。

- ダニ亜綱 (*Acaria* (*Acarida*)) ならびにマダニ亜目 (*Metastigmata*) および中気門亜目 (*Mesostigmata*) のうち、例えば、ナガヒメダニ属 (*Argas* spp.)、カズキダニ属 (*Ornithodoros* spp.)、オトビウス属 (*Otobius* spp.)、タネガタマダニ属 (*Ixodes* spp.)、キララマダニ属 (*Amblyomma* spp.)、ウシマダニ属 (*Boophilus* spp.)、カクマダニ属 (*Dermacentor* spp.)、チマダニ属 (*Haemophysalis* spp.)、イボマダニ属 (*Hyalomma* spp.)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus* spp.)、デルマニスス属 (*Dermanyssus* spp.)、ライリエチア属 (*Railletia* spp.)、ニューモニスス属 (*Pneumonyssus* spp.)、ステルノストマ属 (*Sternostoma* spp.) およびバロア属 (*Varroa* spp.)。

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

【0217】

本発明に係る組成物はまた、木材、織物、プラスチック、接着剤、のり、塗料、紙および厚紙、皮革、床仕上げ材および建築物などの材料の場合、昆虫の加害から保護するのに好適である。本発明に係る組成物は、例えば、以下の有害生物に対して使用され得る：ヨーロッパイエカミキリ (*Hylobius baicalensis*)、クロロホルス・ピロシス (*Chlorophorus pilosus*)、アノビウム・ punctatum (*Anobium punctatum*)、キセストビウム・ルホビロスム (*Xestobium rufovillosum*)、ブチリヌスペクチコルニス (*Ptilinus specticornis*)、デンドロビウム・ペルチネクス (*Dendrobium pertinax*)、マツザイシバンムシ (*Ernobius mollis*)、オオナガシバンムシ (*Prionium carpini*)、ヒラタキクイムシ (*Lyctus brunneus*)。

10

20

30

40

50

nneus)、アフリカヒラタキクイムシ(*Lyctus africanus*)、アメリカヒラタキクイムシ(*Lyctus planicollis*)、ナラヒラタキクイムシ(*Lyctus linearis*)、リクツス・プベセンス(*Lyctus pubescens*)、トロゴキシロン・エクアレ(*Trogoxyylon aequale*)、ミンテスルギコリス(*Minthes rugicollis*)、キシリボルス属種(*Xyleborus spec.*)、トリプトデンドロン属種(*Tryptodendron spec.*)、アパテ・モナクス(*Apate monachus*)、ボストリクス・カプシヌス(*Bostrychus capucinus*)、ヘテロボストリクス・ブルンネウス(*Heterobostrychus brunneus*)、シノキシロン属種(*Sinoxylon spec.*)およびチビタケナガシンクイムシ(*Dinodeurus minutus*)などのカブトムシ、ならびにさらにコルリキバチ(*Sirrex juvencus*)、モミノオオキバチ(*Urocerus gigas*)、ウロセルス・ギガス・タイグヌス(*Urocerus gigas taignuss*)およびウロセルス・アウグル(*Urocerus augur*)などの膜翅類の昆虫(*hymenopteran*)、ならびにカロテルメス・フラヴィコリス(*Kalotermes flavicollis*)、ニシインドカンザイシロアリ(*Cryptotermes brevis*)、ヘテロテルメス・インディコラ(*Heterotermes indicola*)、キアシシロアリ(*Reticulitermes flavipes*)、レティクリテルメス・サントネンシス(*Reticulitermes santonensis*)、レティキュリテルメス・ルシフグス(*Reticulitermes lucifugus*)、ムカシシロアリ(*Mastotermes darwiniensis*)、ネバダオオシロアリ(*Zootermopsis nevadensis*)およびイエシロアリ(*Coptotermes formosanus*)などのシロアリ、ならびにセイヨウシミ(*Lepisma saccharina*)などのシミ。
10

【0218】

化合物またはその組成物を、貯蔵品、貯蔵室、原料(木材および織物など)、床仕上げ材および建築物に、および衛生管理に施用するための施用方法は、当該技術分野において公知である。

【0219】

本発明は、蠕虫、クモ形類および節足動物の内部寄生生物および外部寄生生物による加害および感染に対して、ヒトを含む温血動物、および魚類を治療、治癒、防除、予防、および保護するための方法であって、駆虫的に、殺ダニ的にまたは内部寄生生物駆除にまたは外部寄生生物駆除に有効な量の式(I)の化合物を、前記動物に、経口で、局所的にまたは非経口的に投与または施用する工程を含む方法も提供する。
30

【0220】

上記の方法は、ウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、家禽、魚類、ウサギ、ヤギ、ミンク、キツネ、チンチラ、イヌおよびネコならびにヒトなどの温血動物における蠕虫、線虫、コナダニおよび節足動物の内部寄生生物および外部寄生生物の加害および感染を防除および予防するのに特に有用である。

【0221】

温血動物における加害および感染の防除および予防に関して、本発明の化合物は、蠕虫および線虫の防除に特に有用である。蠕虫の例は、吸虫または扁形動物として一般的に知られている吸虫綱(*Trematoda*)のメンバー、特に、肝蛭属(*Fasciola*)、ファシオロプシス属(*Fascioloides*)、双口吸虫属(*Paramphistomum*)、槍形吸虫属(*Dicrocoelium*)、ユーリトレマ属(*Eurytrema*)、肝吸虫属(*Ophisthorchis*)、肥大吸虫属(*Fasciolopsis*)、棘口吸虫属(*Echinostoma*)および肺吸虫属(*Paragonimus*)のメンバーである。式(I)の化合物によって防除され得る線虫としては、捻轉胃虫属(*Haemonchus*)、オステルタジア属(*Ostertagia*)、クーペリア属(*Cooperia*)、腸結節虫属(*Oesphagastomum*)、ネマトジル
40

10

20

20

30

40

50

ス属 (*Nematodirus*)、ディクチオカウルス属 (*Dictyocaulus*)、鞭虫属 (*Trichuris*)、イヌ糸状虫属 (*Dirofilaria*)、十二指腸虫属 (*Ancylostoma*)、回虫属 (*Ascaria*) などが挙げられる。

【0222】

本発明の化合物は、ウシバエおよび胃ウマバエ (*stomach bot*) などの内部寄生性節足動物の加害も防除し得る。さらに、刺咬性のシラミ、吸血シラミ、ヒツジバエ、サシバエ、キンバエ (*muscoïd fly*)、ハエ、ハエウジ幼虫 (*myiasitic fly larvae*)、ブヨ、蚊、ノミ、ダニ、マダニ、ハナバエ (*nasal bot*)、ヒツジシラミバエ (*ked*) およびツツガムシの幼虫 (*chigger*) を含む、温血動物および魚類におけるコナダニおよび節足動物外部寄生生物の加害は、本発明の化合物によって、防除され、予防されまたはなくされ得る。刺咬性のシラミとしては、ウシハジラミ (*Bovicola bovis*)、イヌハジラミ (*Trichodectes canis*) およびヒツジハジラミ (*Damalinia ovis*) などのハジラミ目 (*Mallophaga*) のメンバーが挙げられる。吸血シラミとしては、ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*) およびケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) などのシラミ目 (*Anoplura*) のメンバーが挙げられる。刺咬性のシラミとしては、ノサシバエ属 (*Haematobia*) のメンバーが挙げられる。マダニとしては、ウシマダニ属 (*Boophilus*)、コイタマダニ属 (*Rhipicephalus*)、タネガタマダニ属 (*Ixodes*)、ダニ属 (*Hyalomma*)、キララマダニ属 (*Amblyomma*) およびカクマダニ属 (*Dermacentor*) が挙げられる。本発明の化合物はまた、アカリホルメス目 (*Acariformes*) およびパラサイチホルメス目 (*Parasitiformes*) のダニを含む、温血哺乳動物および家禽に寄生するダニを防除するのに使用され得る。

【0223】

温血動物への経口投与の場合、本発明の化合物は、動物飼料、動物飼料プレミックス、動物飼料濃縮物、丸薬、液剤、ペースト、懸濁剤、灌注液、ゲル、錠剤、ボーラス剤およびカプセル剤として製剤化され得る。さらに、本発明の化合物は、飲料水として動物に投与され得る。経口投与の場合、選択される剤形は、本発明の化合物を1日当たり約0.01mg/kg～100g/kg（動物の体重）で動物に与えるものである必要がある。

【0224】

あるいは、本発明の化合物は、非経口的に、例えば、第一胃内、筋肉内、静脈内または皮下注射によって動物に投与され得る。本発明の化合物は、皮下注射用の生理学的に許容可能な担体に分散または溶解され得る。あるいは、本発明の化合物は、皮下投与用のインプラントへと製剤化され得る。さらに、本発明の化合物は、動物に経皮投与され得る。非経口投与の場合、選択される剤形は、本発明の化合物を1日当たり約0.01mg/kg～100mg/kg（動物の体重）で動物に与えるものである必要がある。

【0225】

本発明の化合物はまた、浸漬剤 (*dip*)、ダスト剤、粉剤、カラー (*collear*)、メダリオン (*medallion*)、スプレーおよびポアオン (*pour-on*) 製剤の形態で動物に局所的に塗布され得る。局所塗布の場合、浸漬剤およびスプレーは、通常、約0.5ppm～5,000ppm、好ましくは約1ppm～3,000ppmの本発明の化合物を含有する。さらに、本発明の化合物は、動物、特に、ウシおよびヒツジなどの四足動物向けの耳標として製剤化され得る。

【0226】

本発明の化合物はまた、ベンズイミダゾール、ピペラジン、レバミソール、ピランテル、プラジカンテルなどの駆虫剤；アベルメクチン、ミルベマイシンなどの内外部寄生生物駆除剤 (*endectocide*)；アリールピロール、有機リン酸エステル、カルバメート、フィプロニル、ピレスロイド、スピノサド、イミダクロプリドを含む 酪酸阻害剤

10

20

30

40

50

などの外部寄生生物駆除剤；ピリプロキシフェン、シロマジンなどの昆虫成長調節剤；およびフルフェノクスロンを含むベンゾイル尿素などのキチンシンターゼ阻害剤を含むがこれらに限定されない、1つ以上の他の寄生生物駆除化合物と組み合わせてまたはこれらとともに使用され得る（活性スペクトルを広げるために）。

【0227】

本発明の寄生生物駆除組成物は、寄生生物駆除に有効な量の本発明の化合物または、経口、経皮および局所投与用の獣医学上の実務から公知の1つ以上の生理学的に許容可能な不活性な固体または液体担体と混合されたその組合せを含む。このような組成物は、安定剤、消泡剤、粘性調節剤、結合剤および粘着付与剤などのさらなる添加剤を含んでいてもよく、一方、市販の製品は、好ましくは、濃縮物として製剤化されるであろうが、最終使用者は、通常、希釈製剤を用いるであろう。

10

【0228】

本発明に係る組成物は、例えば、真菌症、皮膚病、白癬菌性疾患（trichophyton disease）およびカンジダ症またはアスペルギルス属（Aspergillus spp.）、例えば、アスペルギルス・フミガーツス（Aspergillus fumigatus）によって引き起こされる疾患などのヒトおよび動物の真菌病を治療的または予防的に処置するのに有用な組成物の調製にも使用され得る。

20

【0229】

いずれの他の実施形態からも独立した一実施形態において、式（I）の化合物は、抗蠕虫化合物である。

20

【0230】

いずれの他の実施形態からも独立した一実施形態において、式（I）の化合物は、殺虫化合物、好ましくは殺線虫化合物である。

【0231】

本発明の各態様および実施形態において、「から本質的になる（consisting essentially）」およびその活用形は、「を含む（comprising）」およびその活用形の好ましい実施形態であり、「からなる（consisting of）」およびその活用形は、「から本質的になる（consisting essentially of）」およびその活用形の好ましい実施形態である。

30

【0232】

本出願における開示は、本明細書に開示される実施形態のあらゆる組合せを利用可能にする。

【0233】

以下の実施例は、本発明を例示する働きを果たす。実施例は、本発明を限定するものではない。温度はで示され；溶媒の混合比は体積部（parts by volume）で示される。

30

【実施例】

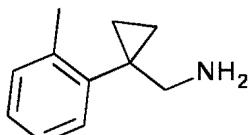
【0234】

調製実施例1：3-メチル-ピリジン-2-カルボン酸（1-o-トリル-シクロプロピルメチル）-アミド（化合物A.9）

40

工程1：C-（1-o-トリル-シクロプロピル）-メチルアミン（化合物Q.1）

【化8】



4.56 gの1-o-トリル-シクロプロパンカルボニトリルを150mlのメタノールに溶解させ、40mlのアンモニア（メタノール中7Nの溶液）を加えた後、4.5gのラネーニッケルを加えた。反応器を密閉し、反応混合物を、周囲温度で2日間、1バー

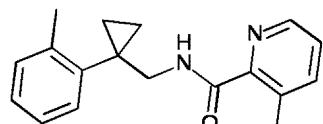
50

ルの水素下で攪拌した。次に、反応混合物をセライト上でろ過し、ろ液を濃縮した。酢酸エチル／メタノール／トリエチルアミン（90：5：5）を溶離剤として用いた、シリカゲルにおけるクロマトグラフィーによって残渣を精製した。ここで、4.01 g の C - (1 - o - トリル - シクロプロピル) - メチルアミンが油として得られた。¹H - NMR (CDCl₃) : 7.25 ppm (m, 1H)、7.13 ppm (m, 3H)、2.70 ppm (s, 2H)、2.41 ppm (s, 3H)、1.40 ppm (s, 2H, broad)、0.80 ppm (m, 4H)。

【 0 2 3 5 】

工程 2 : 3 - メチル - ピリジン - 2 - カルボン酸 (1 - o - トリル - シクロプロピルメチル) - アミド (化合物 A . 9)

【化 9】

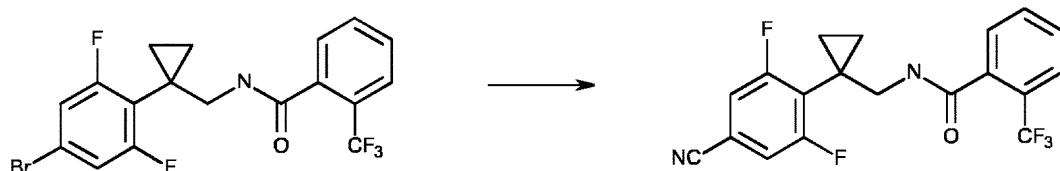


150 mg の C - (1-o-トリル-シクロプロピル) - メチルアミン (工程1) を 5 ml のジクロロメタンに溶解させ、0 に冷却した。次に、188 mg のトリエチルアミンを加えた後、1 ml のジクロロメタン中の 145 mg の 3 - メチル - ピリジン - 2 - カルボニルクロリドの溶液を滴下して加えた。反応混合物を周囲温度で 3 日間攪拌した。次に、6 ml の水を加え、得られた相を分離し、有機相を、2 N の水酸化ナトリウム水溶液で、次に、1 N の塩酸水溶液および塩水で洗浄し、硫酸ナトリウム上で乾燥させ、ろ過し、濃縮した。シクロヘキサン / 酢酸エチル (5 : 1) を溶離剤として用いた、シリカゲルにおけるクロマトグラフィーによって残渣を精製した。ここで、51 mg の 3 - メチル - ピリジン - 2 - カルボン酸 (1-o-トリル-シクロプロピルメチル) - アミドが油として得られた。¹H - NMR (CDC1₃) : 8.83 ppm (m, 1 H)、8.15 ppm (s, 1 H, broad)、7.55 ppm (m, 1 H)、7.30 ppm (m, 1 H)、7.27 ppm (m, 1 H)、7.12 ppm (m, 3 H)、3.55 (d, 2 H)、2.70 ppm (s, 3 H)、2.50 ppm (s, 3 H)、1.02 ppm (m, 2 H)、0.82 ppm (m, 2 H)。

[0 2 3 6]

調製実施例 2 : N - [[1 - (4 - シアノ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) シクロプロピル] メチル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (化合物 A . 57)

【化 10】



N-[[1 - (4 - ブロモ - 2 , 6 - ジフルオロ - フェニル) シクロプロピル] メチル] - 2 - (トリフルオロメチル) ベンズアミド (100 mg) および Zn (CN) 2 (16.2 mg) を、不活性雰囲気下で脱酸素化 DMF に溶解させた。 Pd (PPh3) 4 (13.5 mg) を加え、バイアルを、不活性雰囲気下で密閉し、予熱した 80 の油浴に入れ、 2.5 時間攪拌した。 TLC は、微量の生成物を示すに過ぎない。 Pd (PPh3) 4 (13.5 mg) および Zn (CN) 2 (16.2 mg) を加え、反応混合物を 80 で一晩攪拌した。 TLC は、微量の生成物を示すに過ぎず、 Pd (PPh3) 4 (27 mg) および Zn (CN) 2 (32.4 mg) を加え、反応混合物を 100 で攪拌したところ、白色の沈殿物とともに黄色の溶液が形成された。 TLC は、ほぼ完全な転化を示す。反応混合物を室温に冷まし、トルエンで希釈し、 2 M の NH4OH 溶液および塩水で

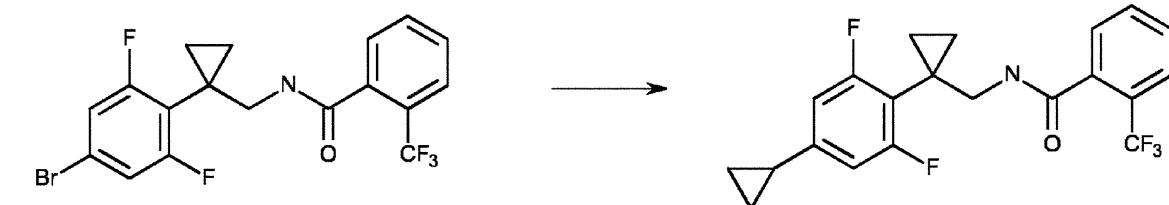
2回洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、溶媒を蒸発させたところ、145mgの黄色の油が得られた。分取TLC：ヘキサン：EtOAc 4：1により、71.7mgの生成物が得られ、それを結晶化させて、黄色の固体にした。融点100～102。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.72 (d, 1H); 8.26 (d, 1H); 7.89 (br s, 1H); 7.58 (dd, 1H); 7.15 (m, 2H); 3.63 (d, 2H); 1.16 (t, 2H); 0.98 (t, 2H)。

【0237】

調製実施例3：N-[1-(4-シクロプロピル-2,6-ジフルオロ-フェニル)シクロプロピル]メチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(化合物A.58)

【化11】



トルエン(1.5ml)および水(0.04ml)中のN-[1-(4-ブロモ-2,6-ジフルオロ-フェニル)シクロプロピル]メチル]-2-(トリフルオロメチル)ベンズアミド(100mg)、シクロプロピルボロン酸(66mg)、 $\text{P}(\text{Cy})_3$ (13mg)、および K_3PO_4 (349mg)に、不活性雰囲気下で $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (5.3mg)を加えた。反応混合物を22時間にわたって100まで加熱した。EtOAcおよび水を加え、相を分離した。有機層を塩水で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、濃縮したところ、210mgの淡褐色の油が得られた。分取TLC(ヘキサン/EtOAc 9:1、7倍の溶離)により、165.4mgの生成物が黄色の油として得られた。

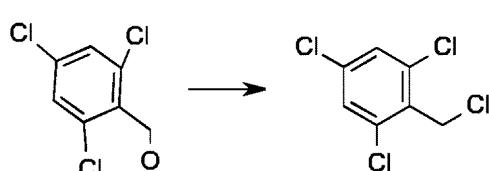
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : 8.73 (d, 1H); 8.12 (d, 1H); 7.89 (br s, 1H); 7.53 (dd, 1H); 6.53 (m, 2H); 3.55 (d, 2H); 1.82 (m, 1H); 1.08～0.86 (m, 6H); 0.63 (m, 2H)。

【0238】

調製実施例4：N-[1-(2,4,6-トリクロロフェニル)シクロプロピル]メチル]-3-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-カルボキサミド(化合物A29)

工程1：1,3,5-トリクロロ-2-(クロロメチル)ベンゼン

【化12】



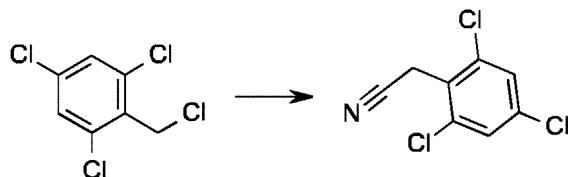
N_2 の雰囲気下で保持されたクロロホルム(20mL)中の(2,4,6-トリクロロフェニル)メタノール(2g、9.4574mmol)の搅拌溶液に、塩化チオニル(1.25mL、17.023mmol)を、10分間にわたって0でゆっくりと加えた後、触媒量のDMF(35mg、0.4733mmol)を加えた。反応混合物を室温で2時間搅拌させた。反応混合物を10mLの水でクエンチし；水層をジクロロメタンで(3回)抽出した。組み合わされた有機層を、5%の Na_2CO_3 溶液(2*10mL)、その後、 NaCl (10mL)で洗浄し、 Na_2SO_4 上で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させたところ、黄色の油(1.78g)が得られた。油をEtOAc中で希釈し、 NaCl (3mL)で2回洗浄し、次に、 Na_2SO_4 上で乾燥させ、ろ過し、蒸発させたところ、1.58gの所望の生成物が得られた。

¹H - N M R (C D C l ₃) : 7 . 4 (s , 2 H) ; 4 . 8 (s , 2 H) 。

【 0 2 3 9 】

工程 2 : 2 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) アセトニトリル

【 化 1 3 】



10

E t O H (5 . 7 m L) 中の 1 , 3 , 5 - トリクロロ - 2 - (クロロメチル) ベンゼン (1 . 7 g 、 7 . 3 9 m m o l) の攪拌溶液に、 H 2 O (1 . 7 m L) 中の N a C N (0 . 4 1 1 g 、 8 . 1 3 m m o l) を室温で加えた。反応混合物を、 4 時間にわたって還流させて、反応を完了させた。 E t O H を蒸発させ、白色の固体を水 (6 m L) 中で希釈した。水層を E t O A c で (3 回) 抽出した。組み合わされた有機層を、 N a C l (1 0 m L) で洗浄し、 N a 2 S O 4 上で乾燥させた。溶媒を減圧下で蒸発させたところ、白色の固体 (1 . 5 8 5 g r) が得られた。粗生成物を、フラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサン / E t O A c (A / B) : 1 0 0 % の A から 5 0 % の B) によって精製したところ、 1 . 0 9 8 g の所望の生成物が得られた。

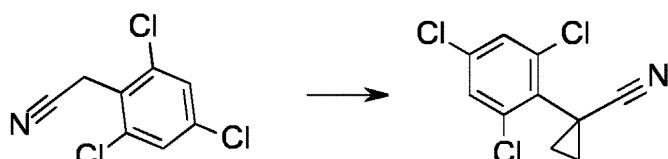
¹H - N M R (C D C l ₃) : 7 . 4 5 (s , 2 H) ; 3 . 9 5 (s , 2 H) 。

20

【 0 2 4 0 】

工程 3 : 1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) シクロプロパンカルボニトリル

【 化 1 4 】



乾燥 T H F (1 . 5 m L) 中の油 (0 . 3 8 7 g 、 9 . 6 7 m m o l) 中 6 0 % の N a H の溶液に、アルゴン下で、 0 で、 T H F (1 . 5 m L) 中の 2 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) アセトニトリル (0 . 7 4 8 g 、 3 . 2 2 m m o l) の溶液を滴下して加えた。黄色の混合物を、ガス発生が終了するまで攪拌した。次に、 1 , 2 - ジブロモエタン (2 . 4 5 g 、 1 2 . 9 m m o l) を 0 で滴下して加えた。反応混合物を 0 で 3 0 分間攪拌し、次に、 2 時間室温のままにした。反応混合物を、 0 で、 N H 4 C l 水溶液 (1 2 m L) でクエンチした。 E t O A c を加えた。相を分離した。水相を、 E t O A c で再度抽出した。組み合わされた有機相を、 N a ₂ S O ₄ を用いて乾燥させ、ろ過し、有機相を蒸発させたところ、ピンク色の固体 (1 . 4 2 g) が得られ、それを、フラッシュクロマトグラフィー (溶媒 : シクロヘキサン / E t O A c 4 / 1) によって精製したところ、白色の固体 (0 . 7 0 4 g) が得られた。

30

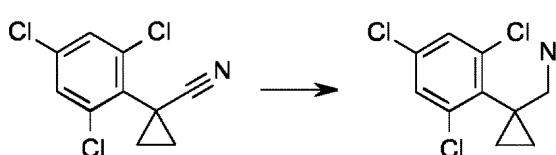
¹H - N M R (C D C l ₃) : 7 . 4 (s , 2 H) ; 1 . 9 5 (m , 2 H) 、 1 . 4 5 (m , 2 H) 。

40

【 0 2 4 1 】

工程 4 : [1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) シクロプロピル] メタンアミン

【 化 1 5 】



50

E t 2 O (6 mL) 中の 1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) シクロプロパンカルボニトリル (0 . 7 0 2 g , 2 . 8 5 mmol) の溶液に、E t 2 O (4 . 2 7 mL , 4 . 2 7 mmol) (発熱性、5 ~ 10 の温度を保持) 中の L i A 1 H 4 (1 M) を、0 で注意深く加えた。懸濁液を 0 で 1 時間攪拌した。次に、反応混合物を希釈し、6 mL の E t 2 O を加え、次に、3 mL の水 (発熱性、激しく反応する、ガス) 、次に、6 mL の 4 M の N a O H 水溶液、次に、9 mL の水で、非常に注意深く 0 でクエンチした。反応混合物を室温で 10 分間攪拌し、次に、N a 2 S O 4 を加え、反応混合物をさらに 5 分間攪拌した。全ての塩をセライト上でろ過した。有機相を塩水で洗浄した。有機層を、N a 2 S O 4 を用いて乾燥させ、ろ過し、有機相を蒸発させたところ、黄色の油 (5 2 4 mg) が得られた。

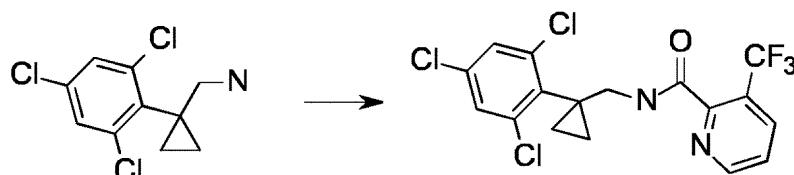
10

¹H - N M R (C D C l 3) : 7 . 3 5 (s , 2 H) ; 2 . 8 5 (s , 2 H) , 1 . 6 (b s , 2 H) , 1 . 0 (m , 2 H) , 0 . 9 5 (m , 2 H) 。

【 0 2 4 2 】

工程 5 : N - [[1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) シクロプロピル] メチル] - 3 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボキサミド (化合物 A 2 9)

【 化 1 6 】



20

乾燥ジクロロメタン (1 . 8 mL) 中の [1 - (2 , 4 , 6 - トリクロロフェニル) シクロプロピル] メタンアミン (1 . 1 0 mL , 0 . 4 5 8 mmol) の溶液に、アルゴン下で、E t 3 N (0 . 1 2 9 mL , 0 . 9 1 5 mmol) を加え、次に、混合物を 0 で冷却した。次に、E D C I . H C l (0 . 1 7 5 g , 0 . 9 1 5 mmol) 、H O B T . H 2 O (0 . 1 2 5 g , 0 . 9 1 5 mmol) 、3 - (トリフルオロメチル) ピリジン - 2 - カルボン酸 (0 . 0 8 7 4 g , 0 . 4 5 8 mmol) を加え、反応混合物を室温で一晩攪拌した。水を加え、水溶液をジクロロメタンで (3 回) 抽出し、組み合わされた有機層を、N a C l によって洗浄し、N a 2 S O 4 上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させたところ、黄色の油 (1 9 8 mg) が得られた。粗生成物を、シリカゲルを用いたフラッシュクロマトグラフィー (シクロヘキサンからシクロヘキサン / A c O E t : 1 / 4) によって精製したところ、所望の生成物が白色の固体 (1 1 5 . 7 mg) として得られた。

30

¹H - N M R (C D C l 3) : 8 . 7 (d , 1 H) ; 8 . 1 5 (d , 1 H) , 8 . 0 (b s , 1 H) , 7 . 5 5 (m , 1 H) , 7 . 3 (s , 2 H) , 3 . 6 7 (d , 2 H) , 1 . 2 5 (m , 2 H) , 1 . 0 5 (m , 2 H) 。

30

【 0 2 4 3 】

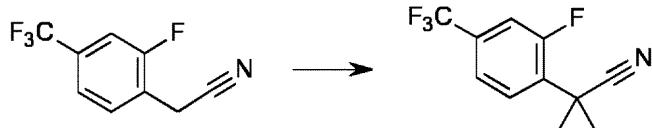
調製実施例 5 : 3 - クロロ - N - [[1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロピル] メチル] ピリジン - 2 - カルボキサミド (化合物 A 3 7)

40

工程 1 : 1 - [2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] シクロプロパンカルボニトリル

40

【 化 1 7 】



2 - フルオロ - 4 - (トリフルオロメチル) フェニルアセトニトリル (3 g , 1 4 , 4 7 mmol) を T H F (3 0 mL) に溶解させた。水素化ナトリウム (1 . 7 3 6 6 g , 4 3 , 4 2 mmol) を、0 で数回に分けて加えた。反応混合物を、ガス発生が検出できなくなるまで攪拌した。そのとき、反応混合物は、赤色の懸濁液であった。0 で、1

50

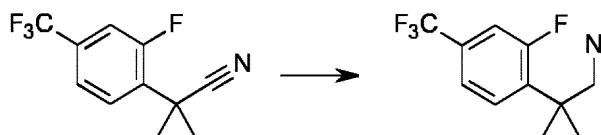
- ブロモ - 2 - クロロ - エタン (4.80 mL、57.89 mmol) を滴下して加えた。反応混合物を、0°で30分間、次に、50°で2時間攪拌した。それを室温に冷ました。懸濁液を *Hyflo* 上でろ過した。ろ液を蒸発させた。残渣は、3.7 g の濃い赤色の液体 / 油であった。粗生成物を、フラッショクロマトグラフィー (溶媒: シクロヘキサン / EtOAc 1/1) によって精製したところ、1.81 g の黄色の油、所望の生成物が得られた。

¹H-NMR (CDCl₃) : 7.5 (t, 1H)、7.45~7.35 (m, 2H)、1.75 (m, 2H)、1.45 (m, 2H)。

【0244】

工程2: [1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル]メタンアミン

【化18】



Et₂O (20 mL、8.404 mmol) 中の 1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロパンカルボニトリル (1.926 g、8.404 mmol) の溶液に、Et₂O (6.723 mL、6.723 mmol) (発熱性、5~10°の温度を保持) 中の LiAlH₄ (1M) を 0°で注意深く加えた。無色溶液が、オレンジ色の懸濁液に変化し、それを 0°で 1 時間攪拌した。

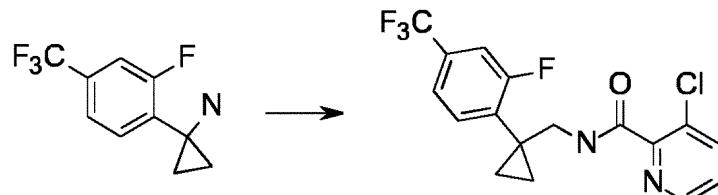
いくらかの出発材料が残ったため、1.6 mL の LiAlH₄ (Et₂O 中 1M) を加え、反応混合物をさらに 1 時間攪拌した。次に、反応混合物を希釈し、20 mL の Et₂O を加え、次に、6 mL の水 (発熱性、激しく反応する、ガス)、次に、5 mL の 2M の NaOH 水溶液、次に、6 mL の水で非常に注意深く 0°でクエンチした。反応混合物を室温で 10 分間攪拌し、次に、Na₂SO₄ を加え、反応混合物をさらに 5 分間攪拌した。全ての塩をセライト上でろ過した。ろ液を塩水で洗浄した。有機層を、Na₂SO₄ を用いて乾燥させ、ろ過し、蒸発させたところ、黄色の油 (1.66 g) が得られ、これは所望の生成物であった。

¹H-NMR (CDCl₃) : 7.44 (t, 1H)、7.37 (d, 1H)、7.30 (d, 1H)、2.80 (s, 2H)、1.15 (bs, 2H)、0.84 (m, 4H)。

【0245】

工程3: 3-クロロ-N-[1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル]メチル]ピリジン-2-カルボキサミド (化合物 A37)

【化19】



乾燥ジクロロメタン (2.0 mL、0.510 mmol) 中の [1-[2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]シクロプロピル]メタンアミン (0.500 mL、0.510 mmol) の溶液に、アルゴン下で、Et₃N (0.144 mL、1.02 mmol) を加え、次に、混合物を 0°で冷却した。EDCI·HCl (0.196 g、1.02 mmol)、HOBT·H₂O (0.139 g、1.02 mmol)、3-クロロピリジン-2-カルボン酸 (0.0803 g、0.510 mmol) を加え、反応混合物を室温で一晩攪拌した。水を加え、水溶液をジクロロメタンで (3回) 抽出し、組み合わされた有機層を、NaCl によって洗浄し、Na₂SO₄ 上で乾燥させ、ろ過し、減圧下で蒸発させたところ、油 (0.316 mg) が得られ、それを、フラッショクロマトグラフィー (シクロヘキサンからシクロヘキサン / AcOEt : 4/1) によって精製した

10

20

30

40

50

。所望の化合物を無色油 (143.0 mg) として単離した。

¹H-NMR (CDCl₃) : 8.43 (d, 1H)、7.88 (bs, 1H)、7.80 (d, 1H)、7.46 (t, 1H)、7.40~7.30 (m, 3H)、3.63 (d, 2H)、1.10 (m, 2H)、0.91 (m, 2H)。

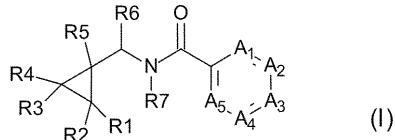
【0246】

上記の方法にしたがって、表AおよびQ中の化合物を調製した。

【0247】

【表34】

表A: 式(I)の化合物



	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	[M+H] ⁺	方法LC-MS	融点(°C)
A.1	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-H	C-CH ₃	C-H	1.89	314 / 316	ZCQ11	
A.2	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N	1.56	268	ZMD11	
A.3	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.72	321 / 323 / 325	ZCQ11	

【0248】

【表35】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	[M+H] ⁺	方法LC-MS	融点(°C)
A.4	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.75	301 / 303	ZMD11	
A.5	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	1.86	314 / 316	ZCQ11	110-113
A.6	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H		1.86	294	ZMD11	
A.7	H	H	H	H		H	H	N	C-H	C-H	C-H	N	1.54	288 / 290	ZCQ11	
A.8	H	H	H	H		H	H	C-CH ₃	C-H	C-CH ₃	C-H	C-H	1.89	314 / 316	ZCQ11	109-114

【0249】

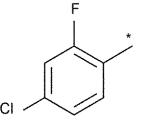
10

20

30

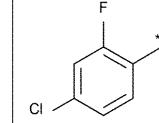
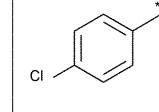
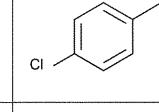
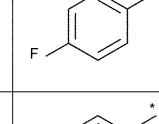
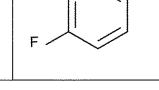
40

【表 3 6】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	[M+H] ⁺	方法LC-MS	融点(℃)
A.9	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-H	N	1.82	281	ZMD11	
A.10	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-CH3	C-H	C-H	1.89	294	ZMD11	104-106
A.11	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-CH3	C-H	C-H	C-H	1.88	294	ZMD11	95-99
A.12	H	H	H	H		H	H	C-CH3	C-H	C-H	C-H	N	1.82	301 / 303	ZCQ11	
A.13	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N				48-49

【0 2 5 0】

【表 3 7】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	[M+H] ⁺	方法LC-MS	融点(℃)	
A.14	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N					97-98
A.15	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N				油	
A.16	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N				69-71	
A.17	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N				79-81	
A.18	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N				油	

【0 2 5 1】

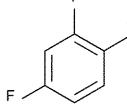
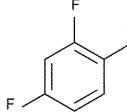
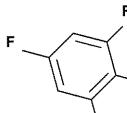
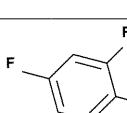
10

20

30

40

【表38】

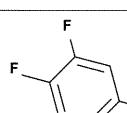
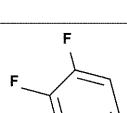
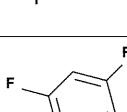
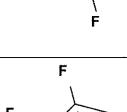
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.19	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N				98-99
A.20	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N				93-94
A.21	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.02	438	標準	
A.22	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	0.98	340.9	標準	128-129

10

20

【0252】

【表39】

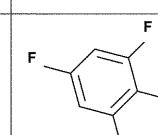
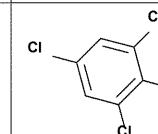
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.23	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.03	375	標準	106-107
A.24	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	0.99	340.9	標準	79-80
A.25	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	0.96	325	標準	90-91
A.26	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	0.98	325	標準	

30

40

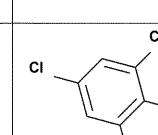
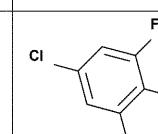
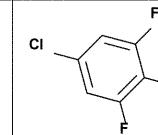
【0253】

【表40】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.27	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N	0.99	373.9	標準	124-125
A.28	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N	1	386.9	標準	99-100
A.29	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.19	425	標準	142-144

【0254】

【表41】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.30	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	1.12	375	標準	
A.31	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.08	391	標準	
A.32	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	1.02	341	標準	

【0255】

【表42】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.33	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.03	357	標準	
A.34	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.14	475	標準	99-100
A.35	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.11	389	標準	111-112

【0 2 5 6】

【表43】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.36	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.09	407	標準	
A.37	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.03	373	標準	
A.38	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	1.03	357	標準	
A.39	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.1	374	標準	

【0 2 5 7】

【表44】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.40	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N	1.1	419	標準	
A.41	H	H	H	H		H	H	N	C-CF3	C-H	C-H	C-H	1.2	423	標準	
A.42	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.08	389	標準	
A.43	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N	1.11	434	標準	

【0258】

10

【表45】

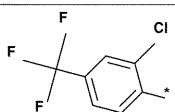
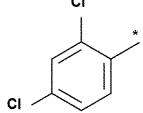
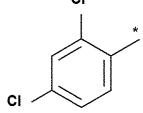
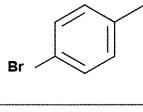
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.44	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.11	407	標準	
A.45	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.08	356	標準	
A.46	H	H	H	H		H	H	C-Br	C-H	C-H	C-H	N	1.08	401	標準	
A.47	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	1.07	373	標準	

【0259】

30

40

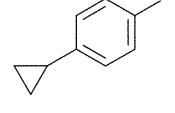
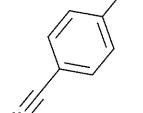
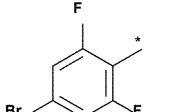
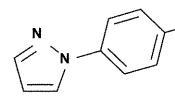
【表46】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(°C)
	LC-MS															
A.48	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.02	424	標準	
A.49	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.83	355/357	ZDQ11	
A.50	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	1.81	339/341	ZDQ11	
A.51	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N				83-84

【0260】

10

【表47】

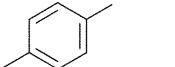
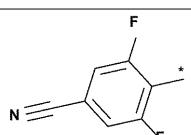
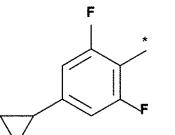
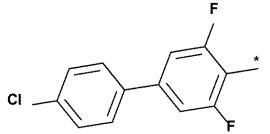
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(°C)
	LC-MS															
A.52	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	1.04	311	ZDQ12	
A.53	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	0.84	296	ZDQ12	
A.54	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N				122-124
A.55	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	0.89	337	ZDQ12	

【0261】

30

40

【表48】

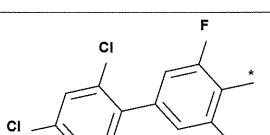
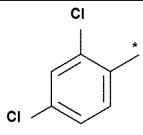
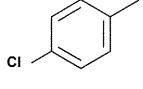
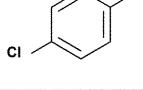
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.56	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	N	0.99	285	ZDQ12	
A.57	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N				100-102
A.58	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.11	397	ZDQ12	
A.59	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N				143-145

10

20

【0262】

【表49】

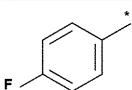
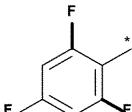
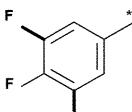
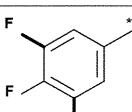
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.60	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N				126-128
A.61	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H				120-121
A.62	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F				94-96
A.63	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				97-99

30

40

【0263】

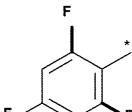
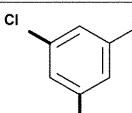
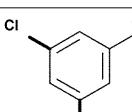
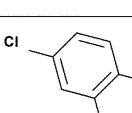
【表 5 0】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.64	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				68-71
A.65	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				96-97
A.66	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N	1.71	342	標準	
A.67	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				113-114

【0 2 6 4】

10

【表 5 1】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)	
A.68	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N					98-99
A.69	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N				112-113	
A.70	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				102-103	
A.71	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F				100-103	

【0 2 6 5】

30

40

【表 5 2】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
	RI	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
A.72	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F				82-84
A.73	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				73-75
A.74	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F				125-127
A.75	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				73-75

10

20

【0 2 6 6】

【表 5 3】

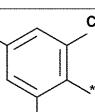
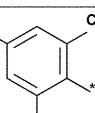
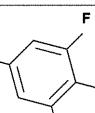
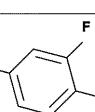
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
	RI	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
A.76	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				76-78
A.77	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N				96-97
A.78	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N				97-98
A.79	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				95-97

30

40

【0 2 6 7】

【表 5 4】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)	
A.80	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H					145-177
A.81	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N	0.88	372/374	標準		
A.82	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H	1.09	390	標準		
A.83	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H	1.02	391	標準		

10

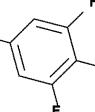
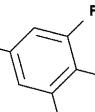
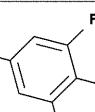
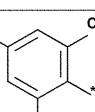
20

30

40

【0 2 6 8】

【表 5 5】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
A.84	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N	1	358	標準	
A.85	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N				110-111
A.86	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F				132-133
A.87	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H	1.18	422	標準	

【0 2 6 9】

【表 5 6】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点	
															LC-MS	(°C)	
A.88	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H					129-130
A.89	H	H	H	H		H	H	C-S-CH3	C-H	C-H	C-H	N	1.1	379	ZDQ12		
A.90	H	H	H	H		H	H	C-SO2-CH3	C-H	C-H	C-H	N				37-39	
A.91	H	H	H	H		H	H	C-SO-CH3	C-H	C-H	C-H	N				47-49	

10

20

【0 2 7 0】

【表 5 7】

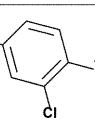
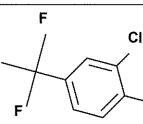
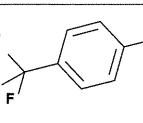
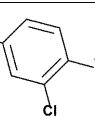
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点	
															LC-MS	(°C)	
A.92	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H					127-128
A.93	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F	1.06	374	標準		
A.94	H	H	H	H		H	H	C-Cl	N	C-H	C-H	N					97-98
A.95	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N	1.05	356	標準		

30

40

【0 2 7 1】

【表 5 8】

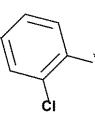
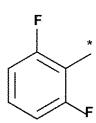
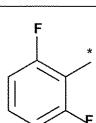
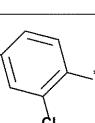
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.96	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N	1.08	356	標準	
A.97	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	N	C-H	N	1.07	391	標準	
A.98	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H				89-92
A.99	H	H	H	H		H	H	C-Br	N	C-H	C-H	C-H	1.02	399	標準	

【0 2 7 2】

10

【表 5 9】

20

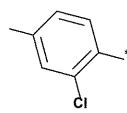
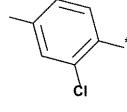
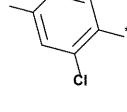
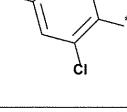
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.100	H	H	H	H		H	H	C-F	N	C-H	C-H	C-H	1.04	339	標準	
A.101	H	H	H	H		H	H	C-F	C-H	C-H	C-H	C-F			100-102	
A.102	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	C-H	1.02	356	ZDQ12	
A.103	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	N	C-H	N			101-103	

【0 2 7 3】

30

40

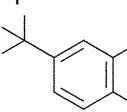
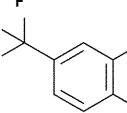
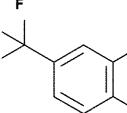
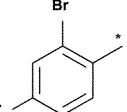
【表 6 0】

	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
	LC-MS															
A.104	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	N	C-H				146-146
A.105	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	N	N			117-119	
A.106	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	N	C-H	C-H			137-139	
A.107	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	N	N	C-H	1.03	390	標準	

【0 2 7 4】

10

【表 6 1】

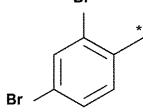
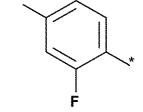
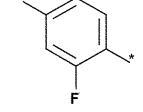
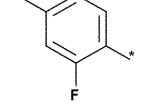
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
	LC-MS															
A.108	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	N				97-99
A.109	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	N	C-H	N	1.05	408	標準	
A.110	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	N	C-H				134-136
A.111	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.14	479	ZDQ12	

【0 2 7 5】

30

40

【表 6 2】

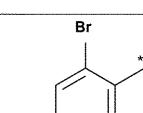
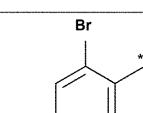
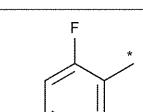
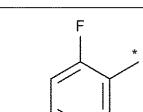
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)	
	LC-MS																
A.112	H	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N	1.12	445	ZDQ12	
A.113	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	C-H	0.94	357	標準		
A.114	H	H	H	H		H	H	C-CF3	N	C-H	C-H	N	0.97	358	標準		
A.115	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	0.99	357	標準		

10

20

【0 2 7 6】

【表 6 3】

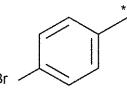
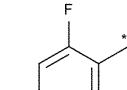
	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法	融点(℃)
	LC-MS															
A.116	H	H	H	H		H	H	C-Cl	C-H	C-H	C-H	N				123-124
A.117	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N				155-157
A.118	Me	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.08	371	ZDQ12	
A.119	H	H	H	H		H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.07	373	ZDQ12	

30

40

【0 2 7 7】

【表64】

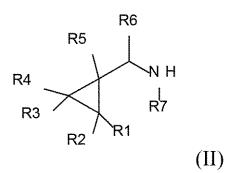
	R1	R2	R3	R4	R5		R6	R7	A1	A2	A3	A4	A5	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
A.120	H	H	H	H			Me	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.14	414	ZDQ12	
A.121	H	H	H	H			H	H	C-CF3	C-H	C-H	C-H	N	1.09	418	ZDQ12	

10

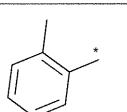
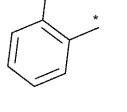
【0278】

【表65】

表Q: 式(II)の化合物



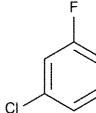
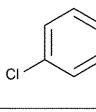
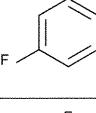
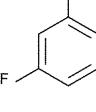
20

	式	CAS 参照番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
Q.1	式(II)	886365-78-2	H	H	H	H		H	H	0.56	162	ZMD11	
Q.2	式(II)	886365-68-0	H	H	H	H		H	H	0.76	182 / 184	ZCQ11	

30

【0279】

【表 6 6】

	式	CAS 参照番号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	保持時間	$[M+H]^+$	方法 LC-MS	融点 (°C)
Q.3	式(II)	-	H	H	H	H		H	H				
Q.4	式(II)	69385-29-1	H	H	H	H		H	H				
Q.5	式(II)	75180-46-0	H	H	H	H		H	H				
Q.6	式(II)	-	H	H	H	H		H	H				

10

20

30

40

【0280】

Waters 製の Z Q 質量分析計 (シングル四重極質量分析計)

機器パラメータ :

イオン化方法 : エレクトロスプレー

極性 : 正イオンおよび負イオン

キャピラリー : 3.00 kV

コーン : 30.00 V

抽出装置 : 2.00 V

イオン源温度 : 100

脱溶媒和温度 : 250

コーンガス流 : 50 L / 時

脱溶媒和ガス流 : 400 L / 時

質量範囲 : 100 ~ 900 Da

Agilent 製の HP 1100 HPLC :

溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

カラム : Phenomenex Gemini C18、3 μm、30 × 3 mm、

温度 : 60

DAD 波長範囲 (nm) : 210 ~ 500

溶媒勾配 :

A = H₂O + 5 % の MeOH + 0.05 % の HCOOH

B = アセトニトリル + 0.05 % の HCOOH

【0281】

【表67】

時間 A% B% 流量(ml/分)

0.00 100 0 1.700

2.00 0 100.0 1.700

2.80 0 100.0 1.700

2.90 100 0 1.700

3.00 100 0 1.700

10

【0282】

Waters製のZQ質量分析計(シングル四重極質量分析計)

機器パラメータ:

イオン化方法: エレクトロスプレー

極性: 正イオンおよび負イオン

キャピラリー: 3.00 kV

コーン: 30 V

抽出装置: 2.00 V

イオン源温度: 150

20

脱溶媒和温度: 350 C

コーンガス流: 50 L/時

脱溶媒和ガス流: 400 L/時

質量範囲: 100 ~ 900 Da

Waters製のAcquity UPLC:

バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

カラム: Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30 × 2.1 mm、

温度: 60

30

DAD波長範囲(nm): 210 ~ 500

溶媒勾配:

A = H2O + 5%のMeOH + 0.05%のHCOOH

B = アセトニトリル + 0.05%のHCOOH

【0283】

【表68】

時間 A% B% 流量(ml/分)

0.00 90 10 0.85

40

1.20 0 100.0 0.85

1.50 0 100.0 0.85

【0284】

Waters製のZQ質量分析計(シングル四重極質量分析計)

機器パラメータ:

イオン化方法: エレクトロスプレー

極性: 正イオンおよび負イオン

キャピラリー: 3.00 kV

コーン: 30.00 V

50

抽出装置：2.00V

イオン源温度：100、

脱溶媒和温度：250

コーンガス流：50L/時

脱溶媒和ガス流：400L/時

質量範囲：100～900Da

Agilent製のHP 1100 HPLC：

溶媒脱ガス装置、クオータナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

カラム：Phenomenex Gemini C18、3mm、30×3mm、

温度：60

DAD波長範囲(nm)：210～500

溶媒勾配：

A = H₂O + 5%のMeOH + 0.05%のHCOOH

B = アセトニトリル + 0.05%のHCOOH

【0285】

【表69】

時間 A% B% 流量(ml/分)

0.00 100 0 1.700

2.00 0 100.0 1.700

2.80 0 100.0 1.700

2.90 100 0 1.700

3.00 100 0 1.700

【0286】

Waters製のZMD質量分析計(シングル四重極質量分析計)

機器パラメータ：

イオン化方法：エレクトロスプレー

極性：正イオンまたは負イオン

キャピラリー：3.80kV

コーン：30.00V

抽出装置：3.00V

イオン源温度：150、

脱溶媒和温度：350

コーンガス流：オフ

脱溶媒和ガス流：600L/時

質量範囲：100～900Da

Agilent製のHP 1100 HPLC：

溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

カラム：Phenomenex Gemini C18、3mm、30×3mm、

温度：60

DAD波長範囲(nm)：200～500

溶媒勾配：

A = H₂O + 5%のMeOH + 0.05%のHCOOH

B = アセトニトリル + 0.05%のHCOOH

【0287】

10

20

30

40

【表70】

時間 A% B% 流量(ml/分)

0.00	100	0	1.700
2.00	0	100.0	1.700
2.80	0	100.0	1.700
2.90	100	0	1.700
3.00	100	0	1.700

10

【0288】

Waters 製の ZQ 質量分析計 (シングル四重極質量分析計)

機器パラメータ :

イオン化方法 : エレクトロスプレー

極性 : 正イオンおよび負イオン

キャピラリー : 3.00 kV

コーン : 30 V

抽出装置 : 2.00 V

イオン源温度 : 150 °C

脱溶媒和温度 : 350 °C

コーンガス流 : 50 L / 時

脱溶媒和ガス流 : 400 L / 時

質量範囲 : 100 ~ 900 Da

Waters 製の Acuity UPLC :

バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

溶媒脱ガス装置、バイナリポンプ、加熱されるカラムコンパートメントおよびダイオードアレイ検出装置。

カラム : Waters UPLC HSS T3、1.8 μm、30 × 2.1 mm、

温度 : 60

DAD 波長範囲 (nm) : 210 ~ 500

30

溶媒勾配 :

A = H2O + 5 % の MeOH + 0.05 % の HCOOH

B = アセトニトリル + 0.05 % の HCOOH

【0289】

【表71】

時間 A% B% 流量(ml/分)

0.00	90	10	0.85
1.20	0	100.0	0.85
1.50	0	100.0	0.85

40

【0290】

生物学的実施例 :

ネコブセンチュウ属 (Meloidogyne spp.) (ネコブセンチュウ) 接触活性、予防、パウチ試験 (Pouch test)。

小さいポケットのあるろ紙 (9 cm × 4.5 cm) を、プラスチックパウチ (12 cm × 6 cm) に入れた。1つのキュウリ cv. トシュカ (cucumber cv. Tochka) 種子を、試験に必要な全てのパウチのろ紙ポケットの中央に入れた。パウチ中のろ紙ポケット中のキュウリ種子に直接溶液をピペットで加えることによって、パウチ中の

50

キュウリ種子を、200 ppmの試験溶液で処理した。施用の前に、化合物溶液を、所要の濃度の2倍で調製し、卵懸濁液を、0.5 ml当たり3000個の卵を含むFORL栄養溶液で調製する。全ての処理を適用した後、3000個の卵(0.5 mlのFORL栄養溶液中)を、パウチにピペットで加えた。パウチを、湿室内で12日間インキュベートし、定期的に水で湿らせて、キュウリ根系を成長させるのに必須の良好なる紙の水分を維持した。この後、発芽したキュウリ苗を含むる紙を、プラスチックパウチから取り出して、根系当たりの、ネコブセンチュウ属(*Meloidogyne spp.*)によって生じたこぶの数を評価した。以下の化合物は、非処理の対照と比較して75%超のこぶの減少を示した: A. 1、A. 2、A. 3、A. 5、A. 6、A. 7、A. 9、A. 11、A. 12、A. 15、A. 18、A. 65、A. 66、A. 67、A. 68、A. 69、A. 70、A. 73、A. 77、A. 84、A. 85、A. 94、A. 101。 10

【0291】

ネコブセンチュウ属(*Meloidogyne spp.*)(ネコブセンチュウ)接触活性、予防、灌注試験(drench test)。

キュウリcv.トシュカ(cucumber cv. Toshka)種子を、砂の下地で満たされたポットに直接蒔いた。6日後、ポットを、20 ppmの試験化合物の5 mlのWP10懸濁液でそれぞれ処理した。この後、サツマイモネコブセンチュウ(*M. incognita*)の3000個の卵を含むポットをインキュベートした。試験的施用および接種の14日後、試験物(trial)を採取した。Zeckの根こぶ指数(Zeck's gall index)(Zeck, 1971)にしたがって、根こぶを評価した。以下の化合物は、非処理の対照と比較して75%超のこぶの減少を示した: A. 1、A. 2、A. 3、A. 6、A. 7、A. 12、A. 14、A. 15、A. 17、A. 19、A. 21、A. 22、A. 23、A. 24、A. 25、A. 27、A. 28、A. 31、A. 32、A. 35、A. 36、A. 37、A. 38、A. 49、A. 50、A. 56、A. 57、A. 58、A. 61、A. 62、A. 65、A. 66、A. 67、A. 72、A. 73、A. 76、A. 77、A. 78、A. 81、A. 84、A. 85、A. 94、A. 95、A. 96、A. 97、A. 100、A. 101。 20

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No PCT/EP2012/071525

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER INV. C07D213/60 C07D239/28 A61K31/44 A61K31/505 A61P33/00 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 A61K A61P

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
--

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT
--

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP 1 997 800 A1 (NIHON NOHYAKU CO LTD [JP]) 3 December 2008 (2008-12-03) tables 1-4 -----	1-42
A	WO 00/25770 A1 (MERCK & CO INC [US]; BAKER ROBERT K [US]; CHEE JENNIFER [US]; BAO JIAN) 11 May 2000 (2000-05-11) example 151 -----	1-42



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	Date of mailing of the international search report
---	--

30 January 2013	07/02/2013
-----------------	------------

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
--	--------------------

Hacking, Michiel

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No
PCT/EP2012/071525

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
EP 1997800	A1 03-12-2008	AR 059960	A1	14-05-2008
		BR P10709030	A2	21-06-2011
		EP 1997800	A1	03-12-2008
		EP 2361503	A2	31-08-2011
		EP 2556749	A1	13-02-2013
		JP 5084721	B2	28-11-2012
		KR 20090009200	A	22-01-2009
		TW 200808693	A	16-02-2008
		US 2011136831	A1	09-06-2011
		WO 2007108483	A1	27-09-2007
<hr/>				
WO 0025770	A1 11-05-2000	AT 423557	T	15-03-2009
		AU 764477	B2	21-08-2003
		AU 1133100	A	22-05-2000
		CA 2348742	A1	11-05-2000
		EP 1143965	A1	17-10-2001
		JP 4504570	B2	14-07-2010
		JP 2002528490	A	03-09-2002
		US 6632836	B1	14-10-2003
		WO 0025770	A1	11-05-2000
<hr/>				

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 31/505 (2006.01)	A 6 1 K 31/505	
C 0 7 D 241/24 (2006.01)	C 0 7 D 241/24	
A 6 1 K 31/4965 (2006.01)	A 6 1 K 31/4965	
A 6 1 K 31/455 (2006.01)	A 6 1 K 31/455	
C 0 7 D 237/24 (2006.01)	C 0 7 D 237/24	
A 6 1 K 31/50 (2006.01)	A 6 1 K 31/50	
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	
A 6 1 P 33/00 (2006.01)	A 6 1 P 33/00	
C 0 7 C 233/66 (2006.01)	C 0 7 C 233/66	
C 0 7 C 231/02 (2006.01)	C 0 7 C 231/02	
A 0 1 N 37/18 (2006.01)	A 0 1 N 37/18	Z
A 0 1 N 43/54 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	A
A 0 1 N 43/40 (2006.01)	A 0 1 N 43/54	B
A 0 1 N 43/58 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 D
A 0 1 N 43/60 (2006.01)	A 0 1 N 43/40	1 0 1 E
A 0 1 P 5/00 (2006.01)	A 0 1 N 43/58	A
A 0 1 P 7/00 (2006.01)	A 0 1 N 43/60	
A 0 1 P 3/00 (2006.01)	A 0 1 P 5/00	
	A 0 1 P 7/00	
	A 0 1 P 3/00	

(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,R,S,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,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,IL,IN,IS,JP,KE,KG,KM,KN,KP,KR,KZ,LA,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,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC

(74) 代理人 100141977

弁理士 中島 勝

(74) 代理人 100138210

弁理士 池田 達則

(72) 発明者 オリビエ ロワゼルール

スイス国, ツェーハー - 4332 シュタイン, シャフハウゼン・トーラーゼ, シンジエンタ クロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチングゼルシャフト

(72) 発明者 トーマス ピッテルナ

スイス国, ツェーハー - 4332 シュタイン, シャフハウゼン・トーラーゼ, シンジエンタ クロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチングゼルシャフト

(72) 発明者 アンソニー コーネリアス オサリバン

スイス国, ツェーハー - 4332 シュタイン, シャフハウゼン・トーラーゼ, シンジエンタ クロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチングゼルシャフト

(72) 発明者 トルステン ルクシュ

スイス国, ツェーハー - 4332 シュタイン, シャフハウゼン・トーラーゼ, シンジエンタ クロップ プロテクション ミュンヒビレン アクチングゼルシャフト

(72) 発明者 アナ キッコバ

スロベニア国, 84215 ブラチスラバ, ムリンスカ ドリナ (アレアル ペーベーエフ ウー

カー) , シンコラ

F ターム(参考) 4C055 AA01 BA02 BA03 BA06 BA13 BA34 BB02 BB14 CA01 CA02
CA05 CA06 CA13 CA34 CA39 CA47 CB01 CB02 DA01 FA15
4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 BC17 BC19 BC41 BC42 BC48 MA01
MA04 NA14 ZB37
4C206 AA01 AA02 AA03 AA04 GA07 GA08 GA23 MA01 MA04 NA14
ZB37
4H006 AA01 AA02 AA03 AB02 AB03 AC53 BA92 BM10 BM30 BM71
BM72 BV72
4H011 AA01 AC01 BB06 BB09 DA14 DA15 DD03 DD04