(19)日本国特許庁(JP)　(12)特　許　公　報(B2)　(11)特許番号
特許第5834006号
(P5834006)
(45)発行日　平成27年12月16日(2015.12.16)　(24)登録日　平成27年11月6日(2015.11.6)

(51)Int.Cl.　　F I
C07D 495/04 (2006.01)　C07D 495/04 105Z
A01N 43/90 (2006.01)　C07D 495/04 CSP
A01P 7/02 (2006.01)　A01N 43/90 103
A01P 7/04 (2006.01)　A01P 7/02
　　A01P 7/04

請求項の数 34　(全 79 頁)

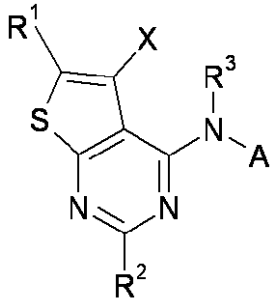
(21)出願番号　特願2012-523042(P2012-523042)
(86)(22)出願日　平成22年7月29日(2010.7.29)
(65)公表番号　特表2013-500985(P2013-500985A)
(43)公表日　平成25年1月10日(2013.1.10)
(86)国際出願番号　PCT/US2010/043717
(87)国際公開番号　WO2011/014660
(87)国際公開日　平成23年2月3日(2011.2.3)
審査請求日　平成25年7月23日(2013.7.23)
(31)優先権主張番号　61/229,769
(32)優先日　平成21年7月30日(2009.7.30)
(33)優先権主張国　米国(US)

(73)特許権者　304040692
メリアル　リミテッド
アメリカ国　ジョージア　３００９６　ダルース　サテライトブルーバード　３２３９
(74)代理人　100092093
弁理士　辻居　幸一
(74)代理人　100082005
弁理士　熊倉　禎男
(74)代理人　100084663
弁理士　箱田　篤
(74)代理人　100093300
弁理士　浅井　賢治
(74)代理人　100119013
弁理士　山崎　一夫

最終頁に続く

(54)【発明の名称】殺虫性４－アミノ－チエノ［２，３－ｄ］－ピリミジン化合物及びその使用方法

(57)【特許請求の範囲】
【請求項１】
下記式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物；或いはそのエナンチオマー、ジアステレオマー又は農業上若しくは獣医学的に許容できる塩：
【化１】



(式I)

（式中、
Xは、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから選択され；
R^1は、水素、ハロゲン、ホルミル、C_1-C_{10}-アルキル、C_1-C_{10}-アルケニル、C_1-C_{10}-アルキニル、C_1-C_{10}-ハロアルキル、C_1-C_{10}-ハロアルケニル、C_1-C_{10}-ハロアルキニル、C_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、C_1-C_{10}-アルキルチオ、C_1-C_{10}-ハロアルキルチオ、C_1-C_{10}-アルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-ハロア

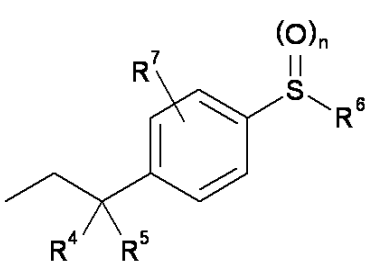
ルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-アルキルスルホニル、C_1-C_{10}-ハロアルキル-スルホニル、C_1-C_{10}-アルキルアミノ、C_1-C_{10}-ハロアルキルアミノ、ジ(C_1-C_{10}-アルキル)アミノ、ジ(C_1-C_{10})-ハロアルキルアミノ、CN、$-CR^3=NOH$、$-CR^3=NOCH_3$及び$-CR^3=NOC_2H_5$から成る群より選択され；

R^2は、水素、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルキル、C_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、C_1-C_{10}-アルキルチオ、C_1-C_{10}-ハロアルキルチオ、C_1-C_{10}-アルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-ハロアルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-アルキルスルホニル、C_1-C_{10}-ハロアルキル-スルホニル、C_1-C_{10}-アルキルアミノ、C_1-C_{10}-ハロアルキルアミノ、ジ(C_1-C_{10}-アルキル)アミノ及びジ(C_1-C_{10})-ハロアルキルアミノから成る群より選択され；

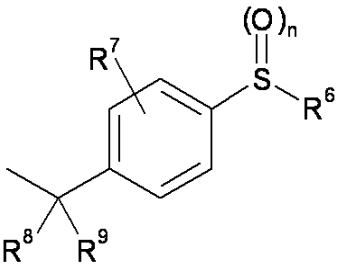
R^3は、水素、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから選択され；

Aは、下記式

【化２】



(A.1) **又は**



(A.2)

（式中、

nは、0、1又は2であり；

R^4、R^5、R^8及びR^9は、相互独立に、水素、CN、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから選択され；

R^6は、トリフルオロメチル、$-CH_2-CF_3$又は$-CF_2-CF_3$であり；

R^7は、水素、ハロゲン、CN、C_1-C_{10}-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルキル、C_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、C_1-C_{10}-アルキルチオ及びC_1-C_{10}-ハロアルキルチオから成る群より選択される）である）。

【請求項２】

AがA2であり；かつ

R^9が、水素、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから成る群より選択される、

請求項１に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。

【請求項３】

AがA2であり；

R^8が水素であり；かつ

R^9がC_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルである、

請求項１に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。

【請求項４】

AがA2であり；

R^8が水素であり；

R^9がC_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルであり；かつ

R^8及びR^9が結合しているキラル炭素原子にある置換基が(S)-配置である、

請求項３に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。

【請求項５】

AがA2であり；

R^8が水素であり；かつ

R^9がメチルである、

請求項１に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。

【請求項６】

AがA2であり；
R^8が水素であり；
R^9がメチルであり；かつ
R^8及びR^9が結合しているキラル炭素原子にある置換基が(S)-配置である、
請求項５に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項７】
R^7が水素である、
請求項１～６のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項８】
R^3が水素である、
請求項１～７のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項９】
R^2が、水素、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル及びC_1-C_{10}-ハロアルキルから成る群より選択される、
請求項１～８のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１０】
R^2が水素である、
請求項１～９のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１１】
R^1が、水素、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル及びC_1-C_{10}-ハロアルキルから成る群より選択される、
請求項１～１０のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１２】
R^1が水素又はクロロである、
請求項１～１１のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１３】
Xがハロゲンである、
請求項１～１２のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１４】
Xがクロロである、
請求項１～１３のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１５】
nが0である、
請求項１～１４のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物。
【請求項１６】
有効量の、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの少なくとも1種の4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物を含む、農業用又は獣医学的組成物。
【請求項１７】
昆虫、クモ又は線虫を駆除又は防除するための、請求項１６に記載の組成物。
【請求項１８】
昆虫、クモ又は線虫を駆除又は防除するための方法であって、前記昆虫、クモ又は線虫を、有効量の、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物、又はその少なくとも1種の化合物を含む組成物と接触させる工程を含む方法。
【請求項１９】

昆虫、クモ又は線虫による攻撃又は侵襲から作物及び成長している植物を保護するための方法であって、植物、又は植物がその中で成長している土壌若しくは水を、有効量の、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物、又はその少なくとも1種の化合物を含む組成物と接触させる工程を含む方法。

【請求項２０】

土壌昆虫からの植物種子の保護並びに土壌昆虫及び葉昆虫からの実生の根及び新芽の保護方法であって、前記植物種子を播種前及び／又は発芽前処理後に、有効量の、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの少なくとも1種の4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物、又はその少なくとも1種の化合物を含む組成物と接触させる工程を含む方法。

【請求項２１】

種子100kg当たり100mg～10kgの量で前記式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物を適用する、請求項２０に記載の方法。

【請求項２２】

得られる植物の根及び新芽が保護される、請求項２０に記載の方法。

【請求項２３】

種子100kg当たり0.1g～10kgの量で請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの化合物又はその農業上有用な塩を含む種子。

【請求項２４】

寄生虫による侵襲又は感染に対して動物（ヒトを除く）を処置、防除、予防又は保護するための方法であって、前記動物（ヒトを除く）に、有効量の、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物、又はその少なくとも1種の化合物を含む組成物を経口、局所又は非経口投与する工程を含む方法。

【請求項２５】

双翅目、ノミ目、シラミ目及びクモ目由来の寄生虫が駆除される、請求項２４に記載の方法。

【請求項２６】

蚊、ハエ、ノミ及び／又はマダニが駆除される、請求項２４に記載の方法。

【請求項２７】

内部寄生虫が駆除される、請求項２４に記載の方法。

【請求項２８】

前記内部寄生虫が、線虫、条虫、吸虫、及び原虫である、請求項２７に記載の方法。

【請求項２９】

前記動物が飼育動物である、請求項２４に記載の方法。

【請求項３０】

前記動物がネコ、イヌである、請求項２９に記載の方法。

【請求項３１】

前記動物がヒツジ、ウシ、ウマ、ブタ又はニワトリである、請求項２４に記載の方法。

【請求項３２】

寄生虫による侵襲又は感染に対して動物を処置、防除、予防又は保護するための経口、局所又は非経口適用可能若しくは投与可能な獣医学的薬物の調製のための、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの化合物の使用。

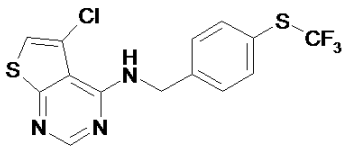
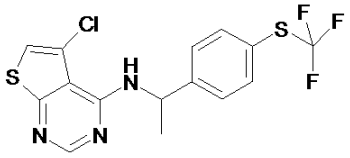
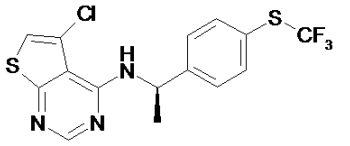
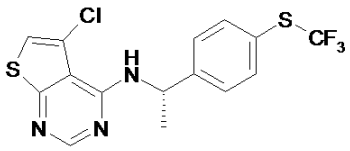
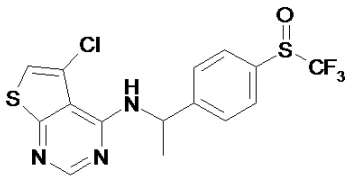
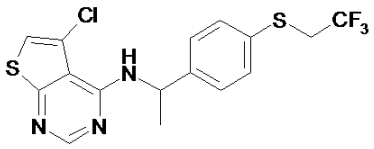
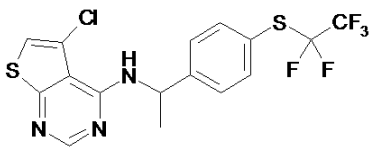
【請求項３３】

寄生虫による侵襲又は感染に対して動物を処置、防除、予防又は保護するための薬物の製造のための、請求項１～１５のいずれか１項に記載の式Iの化合物の使用。

【請求項３４】

下記構造を有する、請求項１に記載の化合物。

【化３】

化合物 実施例番号	構造
C.1	 ,
C.3	 ,
C.3-R	 ,
C.3-S	 ,
C.4	 ,
C.5	 又は
C.6	

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【０００１】

関連出願の相互参照

この出願は、2009年7月30日に出願の米国仮特許出願第61/229,769号の優先権の利益を主張し、その内容は、参照によってその全体が本明細書で援用される。

発明の分野

本発明は、新規の殺虫剤及び殺虫性4-アミノ－チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物、該化合物を含む組成物、並びにそれらの新規の使用方法に関する。

【背景技術】

【０００２】

発明の背景

動物害虫は、育成中の作物及び収穫作物を駄目にし、木造住宅及び商業構造を攻撃し、食糧の供給と特性に多大な経済的損失をもたらす。多数の殺虫性薬剤が知られているが、標的害虫の前記薬剤耐性を生じる能力のため、動物害虫を駆除するための新規薬剤に対して継続的な要求がある。特に、昆虫及びコナダニ類などの動物害虫を効率的に防除するのは困難である。

チエノピリミジンは技術上周知であり、記述されている。EP-A 0370704及びUS5,141,941には殺細菌特性を有するアラルキルアミン誘導体として4-アミノ-チエノピリミジンが言及され、EP424125にはさらなるアラルキルアミン誘導体がその殺真菌用として記述されている。4-アミノ-チエノピリミジン誘導体は、真菌、ウイルス及び細菌の植物病及び虫害を防除するためDE-A2654090及びUS4,146,716にも記述されている。EP-A0452002では、殺真菌、殺昆虫及び殺ダニ有用性のあるN置換チエノピリミジン-4-アミンが開示されている。JP-A2004-238380は、4-フェニルエチルアミノピリミジンの製法及びそれらの殺虫剤としての使用について記述している。殺真菌活性を有するチエノピリミジン化合物がWO2006/047397及びUS2006/0089370A1及びWO2007/046809に記述されている。アルコキシル化4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がWO2007/135029及びUS2009/0203524A1に記述されている。除草、成長調節及び殺虫活性のあるN置換4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がEP-A0447891に記述されている。上で引用した各出版物の内容は、参照によってその全体が本明細書で援用される。

本明細書で引用するいずれの公開された出願及び特許、並びにその中で又はそれらの審査中に引用されたすべての文書(「出願引用文書」)及び出願引用文書で引用又は参照された全ての文書、並びに本明細書で引用又は参照する全ての文書(「本明細書引用文書」)、並びに本明細書引用文書で引用又は参照された全ての文書は、本明細書又は本明細書に参照によって援用されたいずれの文書についてのいずれの製造業者の説明書、明細書、製品仕様書、及び製品シートと共に、参照によって本明細書で援用され、かつ本発明の実施で利用される。

この出願におけるいずれの文書の引用又は同定も該文書を本発明の先行技術として利用できると認めるものではない。

【発明の概要】

【発明が解決しようとする課題】

【０００３】

殺虫活性のあるいくつかのチエノピリミジンが報告されているが、特にコナダニ類に対する殺虫活性及び殺寄生虫活性が改善された化合物が継続的に要望されている。

従って、本発明の目的は、特に昆虫及びコナダニ類の防除の難しさに対して良い殺虫活性を有する方法及び化合物を提供することである。

【課題を解決するための手段】

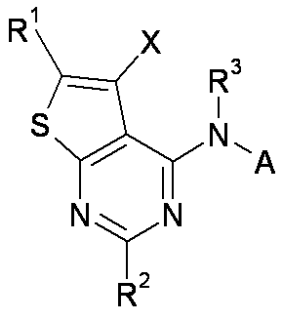
【０００４】

概要

本発明の目的は、下記一般式I：

【０００５】

【化１】



式I

【０００６】
（式中、可変記号X、A、R^1、R^2及びR^3は、後述する通りである）
の新規4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン誘導体、又はその薬学的に許容できる塩によって解決されることが分かった。

一実施形態では、本発明は、有効量の、式Iの少なくとも1種の化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩を、農業上許容できるか又は獣医学的に許容できる担体と組み合わせて含む農業用及び獣医学的組成物を提供する。

別の実施形態では、本発明は、式Iの少なくとも1種の化合物を、別の殺虫又は寄生虫活性薬及び農業上許容できるか又は獣医学的に許容できる担体と組み合わせて含む農業用及び獣医学的組成物を提供する。

別の実施形態では、本発明は、式Iの化合物又は該化合物を含む組成物を用いて動物害虫を駆除又は防除するため、作物を保護するため又は植物繁殖材料を保護するための方法であって、作物、植物繁殖材料又は動物害虫、動物害虫が成長しているか若しくは成長し得るそれらの生息地、繁殖地、餌供給源、植物、種子、土壌、区域、材料若しくは環境、又は動物害虫の攻撃若しくは侵襲から保護すべき材料、植物、種子、土壌、表面若しくは空間を、殺虫有効量の、式Iの少なくとも1種の化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩と接触させる工程を含む方法を提供する。

動物内又は動物上の寄生虫を駆除するため、動物上の寄生虫の感染又は侵襲を処置、防除又は予防するための方法及び使用であって、殺寄生虫有効量の、式Iの少なくとも1種の化合物或いは該化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは獣医学的に許容できる塩を含む組成物を動物に投与する工程を含む方法をも提供する。

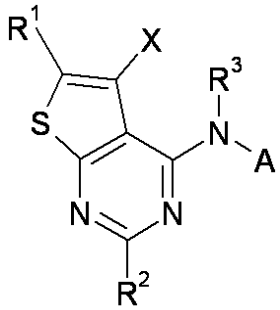
この開示中、特に特許請求の範囲及び／又はパラグラフ中、「含む」、「含まれる」、「含んでいる」等の用語は、米国特許法においてこれらに帰属されている意味を有し；例えば、それらは、「包含する」、「包含される」、「包含している」等を意味することがあり；かつ「本質的に～から成っている」又は「本質的に～から成る」等の用語は、米国特許法においてこれらに帰属されている意味を有し、例えば、それらは、明確に列挙されていない要素を考慮に入れるが、先行技術で見つけられるか又は本発明の基本的若しくは新規な特徴に影響を及ぼす要素を除外する。

これら及び他の実施形態は、以下の詳細な説明によって開示されるか又はそれから明白であり、かつそれに包含される。

【発明を実施するための形態】
【０００７】
詳細な説明

本発明は、下記一般式Iの新規かつ独創的な4-アミノ-チエノ[2,3-d]ピリミジン誘導体、及び／又はその少なくとも1種のエナンチオマー、ジアステレオマー又は農業上若しくは獣医学的に許容できる塩を提供する：

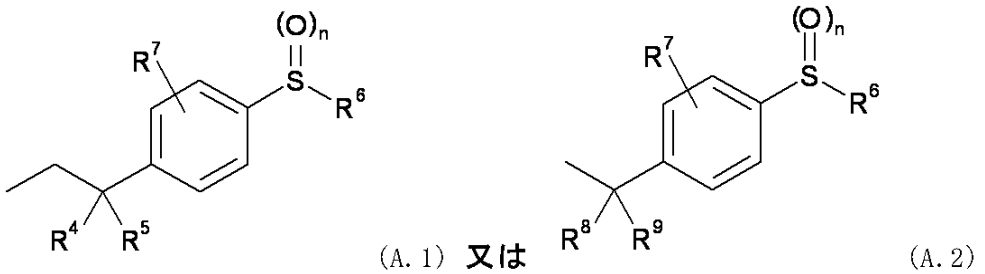
【０００８】
【化２】



式I

【０００９】
式中、

Xは、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから選択され；
R^1は、水素、ハロゲン、ホルミル、C_1-C_{10}-アルキル、C_1-C_{10}-アルケニル、C_1-C_{10}-アルキニル、C_1-C_{10}-ハロアルキル、C_1-C_{10}-ハロアルケニル、C_1-C_{10}-ハロアルキニル、C_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、C_1-C_{10}-アルキルチオ、C_1-C_{10}-ハロアルキルチオ、C_1-C_{10}-アルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-ハロアルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-アルキルスルホニル、C_1-C_{10}-ハロアルキル-スルホニル、C_1-C_{10}-アルキルアミノ、C_1-C_{10}-ハロアルキルアミノ、ジ(C_1-C_{10}-アルキル)アミノ、ジ(C_1-C_{10})-ハロアルキルアミノ、CN、$-CR^3=NOH$、$-CR^3=NOCH_3$及び$-CR^3=NOC_2H_5$から成る群より選択され；
R^2は、水素、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルキル、C_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、C_1-C_{10}-アルキルチオ、C_1-C_{10}-ハロアルキルチオ、C_1-C_{10}-アルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-ハロアルキルスルフィニル、C_1-C_{10}-アルキルスルホニル、C_1-C_{10}-ハロアルキル-スルホニル、C_1-C_{10}-アルキルアミノ、C_1-C_{10}-ハロアルキルアミノ、ジ(C_1-C_{10}-アルキル)アミノ及びジ(C_1-C_{10})-ハロアルキルアミノから成る群より選択され；
R^3は、水素、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから選択され；
Aは、下記式
【００１０】
【化３】



【００１１】
（式中、
nは、0、1又は2であり；
R^4、R^5、R^8及びR^9は、相互独立に、水素、CN、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから選択され；
R^6は、C_1-C_{10}フルオロハロアルキル、C_2-C_{10}フルオロハロアルケニル、C_2-C_{10}フルオロハロアルキニル及びC_3-C_7フルオロハロシクロアルキルから成る群より選択され、ここで、前記フルオロハロアルキル基の炭素原子は、さらにC_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、シアノ及び(C=O)R^qで置換されていてもよく、かつ
R^qは、アミノ、C_1-C_6-アルコキシ、C_1-C_6-ハロアルコキシ、C_1-C_6-アルキルアミノ、C_1-C_6-ハロアルキルアミノ、ジ(C_1-C_6-アルキル)アミノ及びジ(C_1-C_6)-ハロアルキルアミノから成る群より選択され；
R^7は、水素、ハロゲン、CN、C_1-C_{10}-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルキル、C_1-C_{10}-アルコキシ、C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル、C_1-C_{10}-ハロアルコキシ、C_1-C_{10}-アルキルチオ及びC_1-C_{10}-ハロアルキルチオから成る群より選択される）である。
【００１２】
置換パターンによっては、本発明の化合物は1つ以上のキラル中心を含むことがあり、この場合、本化合物はエナンチオマー又はジアステレオマー混合物として存在する。この発明の主題は、これらの混合物を含む組成物のみならず、純粋なエナンチオマー又はジアステレオマーを含む当該組成物でもある。
本発明の化合物は、発明用途に合わせて変化した様々な結晶性で存在してもよく、それらの生物学的活性が異なることもある。これらの様々な結晶変態も本発明の対象である。
さらに、本発明の化合物は、結晶形内で特定の化学量論量の水又は溶媒が分子と会合し

ている水和物又は溶媒和物として存在することがある。式Iの化合物の水和物及び溶媒和物も本発明の対象である。

【００１３】

本発明は、該化合物を適用し、かつ以下の実施形態を含む殺虫及び殺寄生虫方法に関する。

－ある量の式Iの少なくとも1種の化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩を含む農業用及び獣医学的組成物；

－動物害虫を駆除又は防除するための式Iの化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩の使用；

－動物害虫、動物害虫が成長しているか若しくは成長し得るそれらの生息地、繁殖地、餌供給源、植物、種子、土壌、区域、材料若しくは環境、又は動物害虫の攻撃若しくは侵襲から保護すべき材料、植物、種子、土壌、表面若しくは空間を、殺虫有効量の式Iの少なくとも1種の化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩と接触させる工程を含む方法；

－動物害虫による攻撃又は侵襲から作物を保護する方法であって、作物を、殺虫有効量の式Iの少なくとも1種の化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩と接触させる工程を含む方法；

－土壌昆虫からの植物繁殖材料、特に種子の保護並びに土壌昆虫及び葉昆虫からの実生の根及び新芽の保護方法であって、植物繁殖材料、特に種子を播種前及び／又は発芽前処理(pregermination)後に式Iの少なくとも1種の化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩と接触させる工程を含む方法；

－式Iの化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは塩を含む種子；

－式Iの化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは獣医学的に許容できる塩の、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するための使用；

－式Iの化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー若しくは獣医学的に許容できる塩の、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するための薬物の製造における使用；

－寄生虫による侵襲又は感染に対して動物を処置、防除、予防又は保護するための方法であって、殺寄生虫有効量の式Iの化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー及び／若しくは獣医学的に許容できる塩を動物に経口、局所又は非経口投与又は適用する工程を含む方法；

－殺寄生虫有効量の式Iの化合物、又はそのエナンチオマー、ジアステレオマー及び／若しくは獣医学的に許容できる塩を含む、寄生虫による侵襲又は感染に対して動物を処置、防除、予防又は保護するための組成物の調製方法。

【００１４】

WO2006/047397に開示されている、無置換チオアルキル置換基を含む当該化合物に比し、本発明のフルオロハロゲン化チオアルキル置換4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物は、驚くべきことに、より良い殺虫活性を示す。本化合物は、WO2007/135029のアルコキシル化4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物より良い効率をも示す。

式Iの化合物、及びそれらの農業上又は獣医学的に許容できる塩は、動物害虫、すなわち有害な節足動物及び線虫類に対して、特に昆虫及びコナダニ類を防除する難しさに対して非常に活性である。

さらに、式Iの化合物の塩は、好ましくは農業上又は獣医学的に許容できる塩である。通例の方法で、例えば式Iの化合物が塩基官能性を有する場合は該化合物を当該アニオンの酸と反応させることによって、又は式Iの酸性化合物を適切な塩基と反応させることによって当該塩を形成することができる。

有用な塩は、特に、当該カチオンの塩又は当該酸の酸付加塩（それらのカチオン及びアニオンは、それぞれ本発明の化合物の作用に如何なる悪影響をも及ぼさない）である。適切なカチオンは、特にアルカリ金属、好ましくはリチウム、ナトリウム及びカリウム、アルカリ土類金属、好ましくはカルシウム、マグネシウム及びバリウム、並びに遷移金属、好ましくはマンガン、銅、亜鉛及び鉄のイオン、並びにアンモニウム(NH_4^+)及び置換アン

モニウム（1～4個の水素原子がC_1-C_4-アルキル、C_1-C_4-ヒドロキシアルキル、C_1-C_4-アルコキシ、C_1-C_4-アルコキシ-C_1-C_4-アルキル、ヒドロキシ-C_1-C_4-アルコキシ-C_1-C_4-アルキル、フェニル又はベンジルと置き換わっている）である。置換アンモニウムイオンの例は、メチルアンモニウム、イソプロピルアンモニウム,ジメチルアンモニウム、ジイソプロピルアンモニウム、トリメチルアンモニウム、テトラメチルアンモニウム、テトラエチルアンモニウム、テトラブチルアンモニウム、2-ヒドロキシエチルアンモニウム、2-(2-ヒドロキシエトキシ)エチル-アンモニウム、ビス(2-ヒドロキシエチル)アンモニウム、ベンジルトリメチルアンモニウム及びベンジルトリエチルアンモニウム、さらにホスホニウムイオン、スルホニウムイオン、好ましくはトリ(C_1-C_4-アルキル)スルホニウム、及びスルホキソニウムイオン、好ましくはトリ(C_1-C_4-アルキル)スルホキソニウムを含む。

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

【００１５】

本明細書で用いられる用語は、特に断らない限り、当該技術でそれらの通例の意味を有するであろう。上で示した式Iの定義中、置換基は以下の意味を有する。

可変記号の上記定義で言及された有機部分（用語ハロゲンのような）は、個々の群のメンバーの個々のリストの総称である。接頭語C_n-C_mは、各場合にその基中で可能な数の炭素原子を示す。

用語ハロゲンは、各場合にフッ素、臭素、塩素又はヨウ素を表す。本発明の一実施形態では、ハロゲンはフッ素又は塩素である。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルキル」並びにアルキルアミノ及びジアルキルアミノのアルキル部分は、飽和直鎖又は分岐炭化水素基を表し、それぞれ1～10個の炭素原子、1～6個の炭素原子及び1～4個の炭素原子を有するものがある。C_1-C_{10}アルキルの例として、限定するものではないが、メチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル、1,1-ジメチルエチル、ペンチル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、2,2-ジメチルプロピル、1-エチルプロピル、ヘキシル、1,1-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、ヘプチル、オクチル、2-エチルヘキシル、ノニル及びデシル及びそれらの異性体が挙げられる。C_1-C_4-アルキルは、例えばメチル、エチル、プロピル、1-メチルエチル、ブチル、1-メチルプロピル、2-メチルプロピル又は1,1-ジメチルエチルを意味する。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-ハロアルキル」は、1～10個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基(上述した通り)であって、これらの基中の一部又は全ての水素原子が上述した通りのハロゲン原子と置き換わっている当該アルキル基を表す。例えばC_1-C_4-ハロアルキルとして、限定するものではないが、クロロメチル、ブロモメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、クロロフルオロメチル、ジクロロフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2-クロロ-2-フルオロエチル、2-クロロ-2,2-ジフルオロエチル、2,2-ジクロロ-2-フルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル等が挙げられる。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_2-フルオロアルキル」は、1、2、3、4又は5個のフッ

素原子を持っているC_1-C_2-アルキル、例えばジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、1,1,2,2-テトラフルオロエチル又はペンタフルオロエチルを表す。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-フルオロハロアルキル」は、1～10個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基(上述した通り)であって、少なくとも1個のフッ素原子を持ち、かつこれらの基中の一部又は全ての残存水素が、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素から相互独立に選択されるハロゲン原子と置き換わっている当該アルキル基を表す。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルコキシ」は、1～10個の炭素原子を有し、酸素原子を介して結合している直鎖又は分岐飽和アルキル基(上述した通り)を表す。例として、C_1-C_6-アルコキシ、例えばメトキシ、エトキシ、OCH_2-C_2H_5、$OCH(CH_3)_2$、n-ブトキシ、$OCH(CH_3)$-C_2H_5、OCH_2-$CH(CH_3)_2$、$OC(CH_3)_3$、n-ペントキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチル-プロポキシ、1-エチルプロポキシ、n-ヘキソキシ、1-メチルペントキシ、2-メチルペントキシ、3-メチルペントキシ、4-メチルペントキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ等が挙げられる。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-ハロアルコキシ」は、部分的又は完全にフッ素、塩素、臭素及び／又はヨウ素で置換されている上述した通りのC_1-C_{10}-アルコキシ基、すなわち、例えば、C_1-C_6-ハロアルコキシ、例えばクロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、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、クロロフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、2-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2-クロロ-2-フルオロエトキシ、2-クロロ-2,2-ジフルオロエトキシ、2,2-ジクロロ-2-フルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2-フルオロプロポキシ、3-フルオロプロポキシ、2,2-ジフルオロプロポキシ、2,3-ジフルオロプロポキシ、2-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、2-ブロモプロポキシ、3-ブロモプロポキシ、3,3,3-トリフルオロプロポキシ、3,3,3-トリクロロプロポキシ、2,2,3,3,3-ペンタフルオロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1-(フルオロメチル)-2-フルオロエトキシ、1-(クロロメチル)-2-クロロエトキシ、1-(ブロモメチル)-2-ブロモエトキシ、4-フルオロブトキシ、4-クロロブトキシ、4-ブロモブトキシ、ノナフルオロブトキシ、5-フルオロ-1-ペントキシ、5-クロロ-1-ペントキシ、5-ブロモ-1-ペントキシ、5-ヨード-1-ペントキシ、5,5,5-トリクロロ-1-ペントキシ、ウンデカフルオロペントキシ、6-フルオロ-1-ヘキソキシ、6-クロロ-1-ヘキソキシ、6-ブロモ-1-ヘキソキシ、6-ヨード-1-ヘキソキシ、6,6,6-トリクロロ-1-ヘキソキシ又はドデカフルオロヘキソキシを表す。本発明の一実施形態では、「C_1-C_{10}-ハロアルコキシ」は、クロロメトキシ、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-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ及び2,2,2-トリフルオロエトキシからなる群より選択される。

【００１６】

本明細書で用いられる用語「C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルキル」は、上述した通りのC_1-C_6-アルコキシによって置換されているC_1-C_6-アルキル、すなわち、例えば、CH_2-OCH_3、CH_2-OC_2H_5、n-プロポキシメチル、CH_2-$OCH(CH_3)_2$、n-ブトキシメチル、(1-メチルプロポキシ)メチル、(2-メチルプロポキシ)メチル、CH_2-$OC(CH_3)_3$、2-(メトキシ)エチル、2-(エトキシ)エチル、2-(n-プロポキシ)エチル、2-(1-メチルエトキシ)エチル、2-(n-ブトキシ)エチル、2-(1-メチルプロポキシ)エチル、2-(2-メチルプロポキシ)エチル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)エチル、2-(メトキシ)プロピル、2-(エトキシ)プロピル、2-(n-プロポキシ)プロピル、2-(1-メチルエトキシ)プロピル、2-(n-ブトキシ)プロピル、2-(1-メチルプロポキシ)プロピル、2-(2-メチルプロポキシ)プロピル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)プロ

ピル、3-(メトキシ)プロピル、3-(エトキシ)プロピル、3-(n-プロポキシ)プロピル、3-(1-メチルエトキシ)プロピル、3-(n-ブトキシ)プロピル、3-(1-メチルプロポキシ)プロピル、3-(2-メチルプロポキシ)プロピル、3-(1,1-ジメチルエトキシ)プロピル、2-(メトキシ)ブチル、2-(エトキシ)ブチル、2-(n-プロポキシ)ブチル、2-(1-メチルエトキシ)ブチル、2-(n-ブトキシ)ブチル、2-(1-メチルプロポキシ)ブチル、2-(2-メチルプロポキシ)ブチル、2-(1,1-ジメチルエトキシ)ブチル、3-(メトキシ)ブチル、3-(エトキシ)ブチル、3-(n-プロポキシ)ブチル、3-(1-メチルエトキシ)ブチル、3-(n-ブトキシ)ブチル、3-(1-メチルプロポキシ)ブチル、3-(2-メチルプロポキシ)ブチル、3-(1,1-ジメチルエトキシ)ブチル、4-(メトキシ)ブチル、4-(エトキシ)ブチル、4-(n-プロポキシ)ブチル、4-(1-メチルエトキシ)ブチル、4-(n-ブトキシ)ブチル、4-(1-メチルプロポキシ)ブチル、4-(2-メチルプロポキシ)ブチル、4-(1,1-ジメチルエトキシ)ブチル等を表す。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_6-アルコキシ-C_1-C_6-アルコキシ」は、上述した通りのC_1-C_6-アルコキシで置換されているC_1-C_6-アルコキシ、すなわち、例えば、OCH_2-OCH_3、OCH_2-OC_2H_5、n-プロポキシメトキシ、OCH_2-$OCH(CH_3)_2$、n-ブトキシメトキシ、(1-メチルプロポキシ)メトキシ、(2-メチルプロポキシ)メトキシ、OCH_2-$OC(CH_3)_3$、2-(メトキシ)エトキシ、2-(エトキシ)エトキシ、2-(n-プロポキシ)エトキシ、2-(1-メチルエトキシ)エトキシ、2-(n-ブトキシ)エトキシ、2-(1-メチルプロポキシ)エトキシ、2-(2-メチルプロポキシ)エトキシ、2-(1,1-ジメチルエトキシ)エトキシ、2-(メトキシ)プロポキシ、2-(エトキシ)プロポキシ、2-(n-プロポキシ)プロポキシ、2-(1-メチルエトキシ)プロポキシ、2-(n-ブトキシ)プロポキシ、2-(1-メチルプロポキシ)プロポキシ、2-(2-メチルプロポキシ)プロポキシ、2-(1,1-ジメチルエトキシ)プロポキシ、3-(メトキシ)プロポキシ、3-(エトキシ)プロポキシ、3-(n-プロポキシ)プロポキシ、3-(1-メチルエトキシ) プロポキシ、3-(n-ブトキシ)プロポキシ、3-(1-メチルプロポキシ)プロポキシ、3-(2-メチルプロポキシ)プロポキシ、3-(1,1-ジメチルエトキシ)プロポキシ、2-(メトキシ)ブトキシ、2-(エトキシ)ブトキシ、2-(n-プロポキシ)ブトキシ、2-(1-メチルエトキシ)ブトキシ、2-(n-ブトキシ)ブトキシ、2-(1-メチルプロポキシ)ブトキシ、2-(2-メチルプロポキシ)ブトキシ、2-(1,1-ジメチルエトキシ)ブトキシ、3-(メトキシ)ブトキシ、3-(エトキシ)ブトキシ、3-(n-プロポキシ)ブトキシ、3-(1-メチルエトキシ)ブトキシ、3-(n-ブトキシ)ブトキシ、3-(1-メチルプロポキシ)ブトキシ、3-(2-メチルプロポキシ)ブトキシ、3-(1,1-ジメチルエトキシ)ブトキシ、4-(メトキシ)ブトキシ、4-(エトキシ)ブトキシ、4-(n-プロポキシ)ブトキシ、4-(1-メチルエトキシ)ブトキシ、4-(n-ブトキシ)ブトキシ、4-(1-メチルプロポキシ)ブトキシ、4-(2-メチルプロポキシ)ブトキシ、4-(1,1-ジメチルエトキシ)ブトキシ等を表す。

【００１７】

本明細書で用いられる用語「C_1-C_4-アルコキシ-C_1-C_4-アルコキシ-C_1-C_4-アルコキシ」は、上述した通りのC_1-C_4-アルコキシ-C_1-C_4-アルコキシで置換されているC_1-C_4-アルコキシ、すなわち、例えば、2-(2-メトキシエチルオキシ)エチルオキシ、2-(2-エトキシエチルオキシ)エチルオキシを表す。

【００１８】

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルキルカルボニル」は、1～10個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基(上述した通り)（該アルキル基中のいずれかの結合のところで該カルボニル基の炭素原子を介して結合している）を表す。例として、C_1-C_6-アルキルカルボニル、例えばCO-CH_3、CO-C_2H_5、n-プロピルカルボニル、1-メチルエチルカルボニル、n-ブチルカルボニル、1-メチルプロピルカルボニル、2-メチルプロピルカルボニル、1,1-ジメチルエチルカルボニル、n-ペンチルカルボニル、1-メチルブチルカルボニル、2-メチルブチルカルボニル、3-メチルブチルカルボニル、1,1-ジメチルプロピルカルボニル、1,2-ジメチルプロピルカルボニル、2,2-ジメチルプロピルカルボニル、1-エチルプロピルカルボニル、n-ヘキシルカルボニル、1-メチルペンチルカルボニル、2-メチルペンチルカルボニル、3-メチルペンチルカルボニル、4-メチルペンチルカルボニル、1,1-ジメチルブチルカルボニル、1,2-ジメチルブチルカルボニル、1,3-ジメチルブチルカルボニル

、2,2-ジメチルブチルカルボニル、2,3-ジメチルブチルカルボニル、3,3-ジメチルブチルカルボニル、1-エチルブチルカルボニル、2-エチルブチルカルボニル、1,1,2-トリメチルプロピルカルボニル、1,2,2-トリメチルプロピルカルボニル、1-エチル-1-メチルプロピルカルボニル又は1-エチル-2-メチルプロピルカルボニル等が挙げられる。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルコキシカルボニル」は、1～10個の炭素原子を有する直鎖又は分岐アルコキシ基(上述した通り)（該カルボニル基の炭素原子を介して結合している）を表す。例として、(C_1-C_6-アルコキシ)カルボニル、例えば CO-OCH_3、CO-OC_2H_5、COO-CH_2-C_2H_5、CO-$OCH(CH_3)_2$、n-ブトキシカルボニル、CO-$OCH(CH_3)$-C_2H_5、CO-OCH_2-$CH(CH_3)_2$、CO-$OC(CH_3)_3$、n-ペントキシカルボニル、1-メチルブトキシカルボニル、2-メチルブトキシカルボニル、3-メチルブトキシカルボニル、2,2-ジメチルプロポキシカルボニル、1-エチルプロポキシカルボニル、n-ヘキソキシカルボニル、1,1-ジメチルプロポキシカルボニル、1,2-ジメチルプロポキシカルボニル、1-メチルペントキシカルボニル、2-メチルペントキシカルボニル、3-メチルペントキシカルボニル、4-メチルペントキシカルボニル、1,1-ジメチルブトキシカルボニル、1,2-ジメチルブトキシカルボニル、1,3-ジメチルブトキシカルボニル、2,2-ジメチルブトキシカルボニル、2,3-ジメチルブトキシカルボニル、3,3-ジメチルブトキシカルボニル、1-エチルブトキシカルボニル、2-エチルブトキシカルボニル、1,1,2-トリメチルプロポキシカルボニル、1,2,2-トリメチルプロポキシカルボニル、1-エチル-1-メチルプロポキシカルボニル又は 1-エチル-2-メチルプロポキシカルボニルが挙げらえる。

【００１９】

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルキルチオ(C_1-C_{10}-アルキルスルファニル：C_1-C_{10}-アルキル-S-)」は、1～10個の炭素原子を有する、イオウ原子を介して結合している直鎖又は分岐飽和アルキル基(上述した通り)、例えばC_1-C_4-アルキルチオ、例えばメチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、1-メチルエチルチオ、ブチルチオ、1-メチルプロピルチオ、2-メチルプロピルチオ又は1,1-ジメチルエチルチオを表す。

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルキルスルフィニル」(C_1-C_{10}-アルキル-S(=O)-)は、1～10個の炭素原子を有する直鎖又は分岐置換炭化水素基(上述した通り)（該アルキル基中のいずれかの結合のところで該スルフィニル基のイオウ原子を介して結合している）を表す。例として、C_1-C_6-アルキルスルフィニル：SO-CH_3、SO-C_2H_5、n-プロピルスルフィニル、1-メチルエチルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、1-メチルプロピルスルフィニル、2-メチルプロピルスルフィニル、1,1-ジメチルエチルスルフィニル、n-ペンチルスルフィニル、1-メチルブチルスルフィニル、2-メチルブチルスルフィニル、3-メチルブチルスルフィニル、1,1-ジメチルプロピルスルフィニル、1,2-ジメチルプロピルスルフィニル、2,2-ジメチルプロピルスルフィニル、1-エチルプロピルスルフィニル、n-ヘキシルスルフィニル、1-メチルペンチルスルフィニル、2-メチルペンチルスルフィニル、3-メチルペンチルスルフィニル、4-メチルペンチルスルフィニル、1,1-ジメチルブチルスルフィニル、1,2-ジメチルブチルスルフィニル、1,3-ジメチルブチルスルフィニル、2,2-ジメチルブチルスルフィニル、2,3-ジメチルブチルスルフィニル、3,3-ジメチルブチルスルフィニル、1-エチルブチルスルフィニル、2-エチルブチルスルフィニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルフィニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルフィニル又は1-エチル-2-メチルプロピルスルフィニルが挙げられる。

【００２０】

本明細書で用いられる用語「C_1-C_{10}-アルキルスルホニル」(C_1-C_{10}-アルキル-S(=O)$_2$-)は、1～10個の炭素原子を有する直鎖又は分岐飽和アルキル基(上述した通り)（該アルキル基中のいずれかの結合のところで該スルホニル基のイオウ原子を介して結合している）を表す。例として、C_1-C_6-アルキルスルホニル、例えばSO_2-CH_3、SO_2-C_2H_5、n-プロピルスルホニル、SO_2-$CH(CH_3)_2$、n-ブチルスルホニル、1-メチルプロピルスルホニル、2-メチルプロピルスルホニル、SO_2-$C(CH_3)_3$、n-ペンチルスルホニル、1-メチルブチルスルホニル、2-メチルブチルスルホニル、3-メチルブチルスルホニル、1,1-ジメチルプロピルスルホニル、1,2-ジメチルプロピルスルホニル、2,2-ジメチルプロピルスルホニル、1-エチル

プロピルスルホニル、n-ヘキシルスルホニル、1-メチルペンチルスルホニル、2-メチルペンチルスルホニル、3-メチルペンチルスルホニル、4-メチルペンチルスルホニル、1,1-ジメチルブチルスルホニル、1,2-ジメチルブチルスルホニル、1,3-ジメチルブチルスルホニル、2,2-ジメチルブチルスルホニル、2,3-ジメチルブチルスルホニル、3,3-ジメチルブチルスルホニル、1-エチルブチルスルホニル、2-エチルブチルスルホニル、1,1,2-トリメチルプロピルスルホニル、1,2,2-トリメチルプロピルスルホニル、1-エチル-1-メチルプロピルスルホニル又は1-エチル-2-メチルプロピルスルホニル等が挙げられる。

本明細書で用いられる用語「C_2-C_{10}-アルケニル」は、2～10個の炭素原子と任意の位置に少なくとも1個の二重結合とを有する直鎖又は分岐不飽和炭化水素基を表す。「C_2-C_{10}-アルケニル」基は、鎖内に複数個の二重結合を有し得る。例として、限定するものではないが、エテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-メチル-エテニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチル-1-プロペニル、2-メチル-1-プロペニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル; 1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-メチル-1-ブテニル、2-メチル-1-ブテニル、3-メチル-1-ブテニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-1-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-1-ペンテニル、2-メチル-1-ペンテニル、3-メチル-1-ペンテニル、4-メチル-1-ペンテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-1-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-1-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,2-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-1-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-1-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-1-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-1-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、1-エチル-2-メチル-1-プロペニル及び1-エチル-2-メチル-2-プロペニルが挙げられる。

本明細書で用いられる用語「C_2-C_{10}-アルキニル」は、2～10個の炭素原子を有し、かつ少なくとも1個の三重結合を含有する直鎖又は分岐不飽和炭化水素基、例えばエチニル、プロパ-1-イン-1-イル、プロパ-2-イン-1-イル、n-ブタ-1-イン-1-イル、n-ブタ-1-イン-3-イル、n-ブタ-1-イン-4-イル、n-ブタ-2-イン-1-イル、n-ペンタ-1-イン-1-イル、n-ペンタ-1-イン-3-イル、n-ペンタ-1-イン-4-イル、n-ペンタ-1-イン-5-イル、n-ペンタ-2-イン-1-イル、n-ペンタ-2-イン-4-イル、n-ペンタ-2-イン-5-イル、3-メチルブタ-1-イン-3-イル、3-メチルブタ-1-イン-4-イル、n-ヘキサ-1-イン-1-イル、n-ヘキサ-1-イン-3-イル、n-ヘキサ-1-イン-4-イル、n-ヘキサ-1-イン-5-イル、n-ヘキサ-1-イン-6-イル、n-ヘキサ-2-イン-1-イル、n-ヘキサ-2-イン-4-イル、n-ヘキサ-2-イン-5-イル、n-ヘキサ-2-イン-6-イル、n-ヘキサ-3-イン-1-イル、n-ヘキサ-3-イン-2-イル、3-メチルペンタ-1-イン-1-イル、3-メチルペンタ-1-イン-3-イル、3-メチルペンタ-1-イン-4-イル、3-メチルペンタ-1-イン-5-イル、4-メチルペンタ-1-イン-1-イル、4-メチルペンタ-2-イン-4-イル又は4-メチルペンタ-2-イン-5-イル等を表す。

【００２１】

本明細書で用いられる用語「C_2-C_{10}-フルオロハロアルケニル」又は「C_2-C_{10}-フルオロハロアルキニル」は、2～10個の炭素原子を有し、かつそれぞれ少なくとも1個の二重結合又は1個の三重結合を含有する直鎖若しくは分岐不飽和アルケニル又はアルキニル基（上述した通り）（少なくとも1個のフッ素原子を持っており、かつこれらの基中の一部又は全ての残存水素が、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素から相互独立に選択されるハロゲン原子

と置き換わっている）を表す。

本明細書で用いられる用語「C_3-C_{10}-シクロアルキル」は、3～10個の炭素原子、特に3～8個の炭素原子を有する単環式炭化水素基、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチル、シクロオクチル、シクロノニル又はシクロデシルを表す。

本明細書で用いられる用語「C_3-C_{10}-フルオロハロシクロアルキル」は、3～10個の炭素原子を有する単環式炭化水素基（少なくとも1個のフッ素原子を持っており、かつこれらの基中の一部又は全ての残存水素が、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素から相互独立に選択されるハロゲン原子で置き換わっている）を表す。

「部分的又は完全にハロゲン化されている」という用語は、与えられた基の1個以上、例えば1、2、3、4若しくは5個又は全ての水素原子が、ハロゲン原子、特にフッ素又は塩素と置き換わっていることを意味するものと解釈する。

【００２２】

本発明の様々な使用方法について、特に好ましくは、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物の置換基及び可変記号の以下の意味が各場合にそれら単独又は組合せで与えられる。

AがA2であり、かつR^9が、水素、C_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルから成る群より選択される、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

AがA2であり、R^8が水素であり、かつR^9がC_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がさらに好ましい。

AがA2であり、R^8が水素であり、R^9がC_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルであり、かつR^8とR^9が結合しているキラル炭素原子にある置換基が(S)-配置である、式Iの当該4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が特に好ましい。

AがA2であり、R^8が水素であり、かつR^9がメチルである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が最も好ましい。

AがA2であり、R^8が水素であり、R^9がメチルであり、かつR^8とR^9が結合しているキラル炭素原子にある置換基が(S)-配置である、式Iの当該4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が特に好ましい。

R^7が水素である、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

R^6がC_1-C_{10}-フルオロハロアルキルである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

R^6がトリフルオロメチルである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がさらに好ましい。

R^3が水素である、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

R^2が、水素、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル及びC_1-C_{10}-ハロアルキルから成る群より選択される、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

R^2が水素である、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がさらに好ましい。

R^1が、水素、ハロゲン、C_1-C_{10}-アルキル及びC_1-C_{10}-ハロアルキルから成る群より選択される、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

R^1が水素又はクロロである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がさらに好ましい。

Xがハロゲンである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

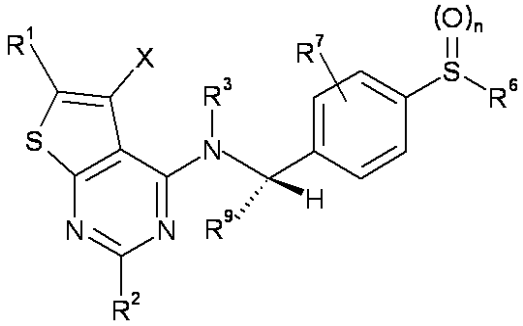
Xがクロロである、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がさらに好ましい。

nが0である、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が好ましい。

下記一般式I-S：

【００２３】

【化４】



(式I-S)

【００２４】

（式中、n、X、R^1、R^2、R^3、R^6、R^7及びR^9は、式Iについての定義通りである）

の4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が特に好ましい。

X、R^1、R^2、R^3、R^6、R^7及びR^9が、式Iについて単独又は組み合わせて上で定義した通りの好ましい置換基を意味する、一般式I-Sの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物がさらに好ましい。

nが0又は1であり、Xがクロロであり、R^1が水素又はハロゲンであり、R^2、R^3及びR^7が水素であり、R^6がC_1-C_{10}-フルオロハロアルキルであり、かつR^9がC_1-C_{10}-アルキル又はC_1-C_{10}-ハロアルキルである、一般式I-Sの4-アミノ-チエノ[2,3-d]-ピリミジン化合物が最も好ましい。

【００２５】

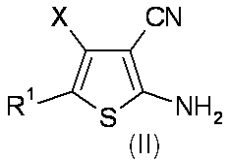
（調製方法）

本発明の式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]ピリミジン化合物は、チエオフェン化合物(II)から4-アミノ-チエノ[2,3-d]ピリミジン化合物を調製するEP0447891Bを参照しているWO2007/135029に記載されている通りに調製し得る。

下記式(II)

【００２６】

【化５】



(II)

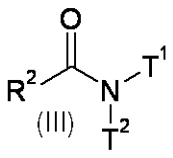
【００２７】

（式中、X及びR^1は前記定義通りである）

のチオフェン誘導体を下記ジアルキルアミド(III)

【００２８】

【化６】



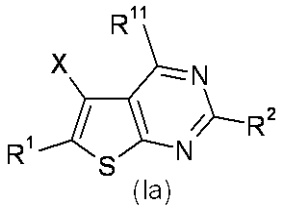
(III)

【００２９】

（式中、T^1及びT^2は、相互独立にC_1-C_4-アルキルであるか又は窒素と一緒に5～7員飽和ヘテロ環を形成し、R^2は、前記定義通りである）と、過剰のハロゲン化ホスホリル、例えば1モルの(II)に比べて2～20モルの塩化ホスホリル又は臭化ホスホリルの存在下で反応させて下記式(Ia)

【００３０】

【化７】



(Ia)

【００３１】

（式中、R^{11}はクロロ又はブロモである）

のチエノ-(2,3-d)-ピリミジン誘導体をもたらす。

上述した通りに得られた式(Ia)の化合物は、 'The Chemistry of Heterocyclic compounds', "The pyrimidines", ed. D.J. Brown, J. Wiley & Sony, New York, London, Vol. 16, (1962); Vol. 16, Suppl. 1, Vol. 16, Suppl. 2 (1985)に記載の既知の方法に従って別の求核残基(rest)による4位でのハロゲン原子の置換によって得られる。

それらは、EP-A447891に記載されているようにNR^3AによるR^{11}の置換によって、式Iの対応する化合物に変換される。

適切なジアルキル-アミド(III)の例は、N,N-ジメチルホルムアミド, N,N-ジメチル-アセトアミド、N,N-ジエチルホルムアミド、N,N-ジエチルアセトアミド、N,N-ジメチルプロピオンアミド及びN,N-ジメチル安息香酸アミドである。

上述したように、チオフェン誘導体(II)に比べて過剰の塩化ホスホリル又は臭化ホスホリルの存在下で反応を行わなければならない。溶媒としてハロゲンホスホリルを用いて反応を行うと有利である。好ましくは1モルのチオフェン誘導体(II)に対して2～6モルのハロゲン化ホスホリルを使用する。

一般にチオフェン誘導体(II)対N,N-ジアルキルアミド(III)のモル比は1:1～1:5である。

通常、例えばクロロベンゾール、ニトロベンゾール、安息香酸メチルエステル、塩化メチレン、ジクロロベンゾール、トリクロロベンゾール、安息香酸 エチルエステル、クロロホルム、テトラクロロ炭素、上掲N,N-ジアルキルアミドの1つ、トリクロロエタン、ヘキサメチルリン酸トリアミド(HMPT)又はテトラクロロエチレン等の不活性溶媒中で反応を行う。好ましい溶媒は、塩化ホスホリル及び臭化ホスホリル又は上掲N,N-ジアルキルアミドの1つである。

【００３２】

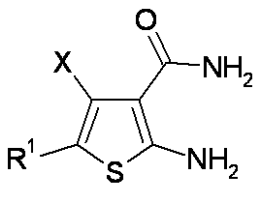
反応は、20℃超えで十分な反応速度を有する。150℃より高い温度では、反応特異性が低下する。好ましくは50～110℃の温度範囲で反応を行う。

塩化カリウム、塩化ナトリウム、塩化鉄(III)、塩化アルミニウム、塩化亜鉛、塩化スズ、五フッ化アンチモン、三フッ化ホウ素若しくは四塩化チタンのような触媒量のルイス酸、又はN,N-ジメチルアニリン若しくはN,N-ジエチルアニリンのような塩基触媒の使用によって、収率の上昇及び反応速度の増加を達成することができる。

式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]ピリミジン化合物の別の調製方法は、下記式(IV)

【００３３】

【化８】



(IV)

【００３４】

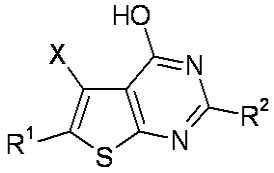
（式中、X及びR^1は前記定義通りである）

の化合物を慣行に従って、少なくとも残基R^2-CO-を含有する酸無水物、又は炭酸R^2-COOH

、又は炭酸とルイス酸の付加体（ここで、R^2はそれぞれ前記意味を有する）と反応させて下記式(Ib)にする。

【００３５】

【化９】



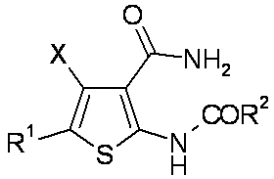
(Ib)

【００３６】

式(Ib)の化合物をハロゲン化ホスホリルを用いて前記定義通りの式(Ia)の化合物に変換する。特定の場合、この変換を二段階で行い、それによって下記式(VI)の中間化合物を単離する。

【００３７】

【化１０】



(VI)

【００３８】

一般に酸無水物又は付加体は、化合物(VI)に対して100～500モル%、好ましくは100～300モル%の量で使用される。

少なくとも1個の残基R^2-CO-を含有する炭酸無水物は、ピバル酸、プロピオン酸又は酢酸のような2つの炭酸R^2-COOHから；又は1つの炭酸R^2-COOHと、リン酸若しくは硫酸のようなオキソ酸とから与えられる。

好ましい炭酸R^2-COOHは、1～4個の炭素原子を有するもの、特にギ酸及び酢酸である。

さらに、炭酸 R^2-COOHと、塩化亜鉛、三フッ化ホウ素及び四塩化チタンのようなルイス酸との付加体も適している。

(IV)から(Ib)への変換は、有利には不活性溶媒、例えばN,N-ジアルキルアミド、好ましくはN,N-ジメチルホルムアミド及びN,N-ジメチルアセトアミド、N-メチル-ピロリドン、N,N-ジメチルプロピレン尿素又はヘキサメチルリン酸トリアミド中、-10～150℃、好ましくは20～120℃、さらに好ましくは80～120℃の温度で行われる。

中間化合物(VI)を単離するため、反応温度は、-10～80℃から選択すべきである。

一般にトリエチルアミン、N-メチル-ピロリドン又はN,N-ジメチルアニリン等の塩基を、炭酸無水物、炭酸又は炭酸-ルイス酸付加体に比べて1～10倍過剰、好ましくは1～5倍過剰に添加すべきである。

ジシクロヘキシルカルボジイミド等の水除去剤、又はビルスメイアー(Vilsmeier)試薬の添加は、反応を速め、かつ式(Ib)の化合物の収率を高めることができる。

式(Ib)の化合物の4位のヒドロキシ基を慣行に従って塩化ホスホリル又は臭化ホスホリルを用いてクロロ又はブロモで置換することができる。

最後に、EP-A 447891に記載されているように、4位のクロロ及びブロモをNR^3Aで置換する。

NR^3Aのチオ置換アリール基Aは、例えばハロゲン原子のような適切な脱離基を有するフルオロアルキル化合物を用いたそれぞれのチオフェノールのアルキル化によって調製され得る。

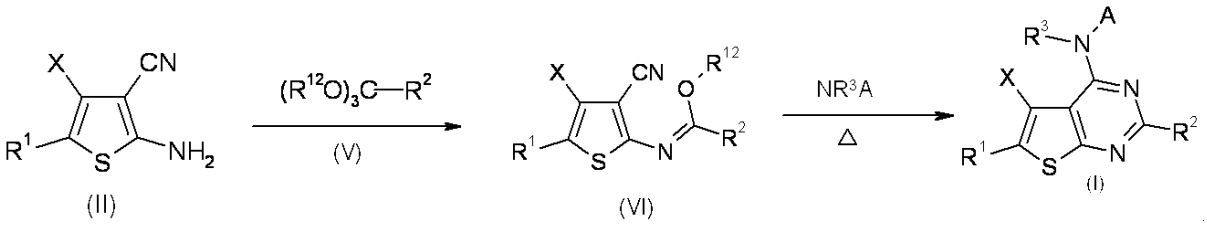
さらに、下記スキーム1に従い、式(II)のチオフェン化合物の、オルトエステル(V)（式中、R^{12}はC_1-C_4-アルキルである）を用いた式(VI)の誘導体への変換後、引き続きアミンN

R^3Aの存在下での環化によって、本発明の式(I)のチエノ[2,3-d]ピリミジン化合物を得ることができる。

スキーム1：

【００３９】

【化１１】



【００４０】

最後に示した反応スキームはDE-A 2654090から公知である。チオフェン誘導体(II)及び(IV)は、EP-A1 0193885に開示されている序論に従って得られる。

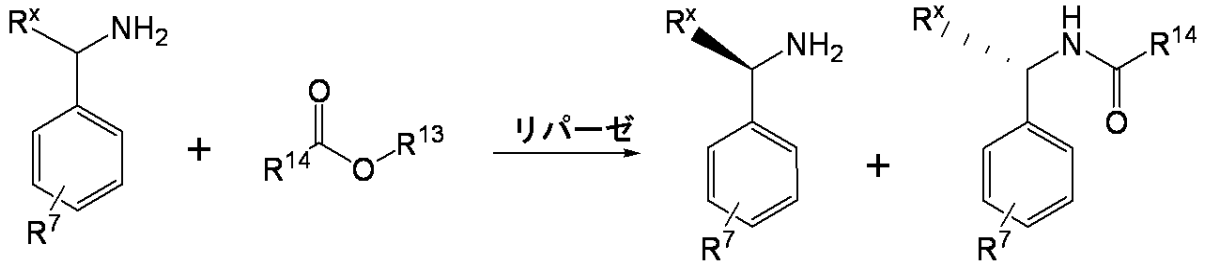
原則として、エナンチオマー濃縮された置換ベンジルアミンNR^3Aは、対応するラセミ体の分割によって又はアキラル前駆体からの不斉合成を介して得られる。

Synthesis 2008, 14, 2283-2287は、ラセミ置換ベンジルアミンのキラル分割用の触媒としてリパーゼを使用する典型的手順について記述している。以下のスキーム2に従い、ラセミ体を例えば低分子アルキル又はアルケニル(式中、R^{13}は例えばC_1-C_4-アルキル、C_1-C_4-アルケニルであり、R^{14}は例えば任意に置換されていてもよいC_1-C_4-アルキル、例えばCH_2OCH_3である)の脂肪族カルボン酸エステルのエステルと反応させて、反応の完了後、一方のエナンチオマーは対応するアミドに変換するが、第2のエナンチオマーは未反応のままであろう。

スキーム2：

【００４１】

【化１２】



【００４２】

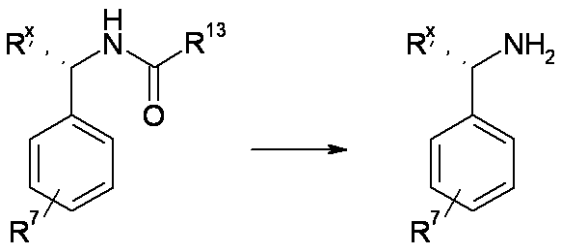
式中、R^xは、上記R^4、R^5、R^7又はR^8の定義通りである。

R^xがメチル等の低分子アルキル基の場合、典型的に(S)-エナンチオマーはアルキル化されるが、(R)-エナンチオマーは未反応のままであろう。反応混合物を例えば蒸留又はクロマトグラフィーによって分離したら、(R)-エナンチオマーは直接使用され、(S)-エナンチオマーは、下記スキーム3に従う加水分解後のアミド結合の開裂後に得られるであろう。

スキーム3：

【００４３】

【化１３】



【００４４】

不斉合成を経てエナンチオマー濃縮されたか又はエナンチオピュアな置換ベンジルアミンをもたらす様々な合成手順が文献に記載されている。典型的に、これらの手順は、下記スキーム4に示すようにC=N結合の還元を含む。このタイプの還元に適した基質は、Org. Lett. 2007, 9, 1793-1795に記載されているようなオキシムエーテル(例えばR^{15}=C_1-C_4-アルコキシ)又は例えばJ. Org. Chem. 2006, 71, 6859-6862に記載されているようなキラルスルホキシイミン(例えばR^{15}=S(=0)tBu)である。

スキーム4：

【００４５】

【化１４】



【００４６】

農業用又は獣医学的使用に適した塩を得るため、式Iの4-アミノ-チエノ[2,3-d]ピリミジン化合物を塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、ギ酸、酢酸、シュウ酸、ベンゼンスルホン酸、p-トルオール-スルホン酸、ドデシルベンゼンスルホン酸、臭化メチル、硫酸ジメチル又は硫酸ジエチルのような通常の塩ビルダー(builder)と0～150℃、好ましくは20～120℃の温度で反応させることができる。

塩の形成は通常、溶解剤又は希釈剤中で行われる。例えばn-ペンタン、n-ヘキサン若しくは石油エーテルのような脂肪族炭化水素、ベンゾール、トルオール若しくはキシロールのような芳香族炭化水素、ベンジン又はジエチルエーテル、メチル-tert.-ブチルエーテル、テトラヒドロフラン若しくはジオキサンのようなエーテル、さらにアセトン、メチル-エチル-ケトン若しくはメチル-イソプロピル-ケトンのようなケトン、並びにクロロベンゾール、塩化メチレン、塩化エチレン、クロロホルム若しくはテトラクロロエチレンのようなハロゲン化炭化水素が適している。当該溶媒の混合物を使用することもできる。

式Iの化合物の塩の調製のため、通常は化学量論比を利用する。一方又は他方の成分の過剰を利用することができる。

記載した調製方法では、可変記号X、R^1、R^2、及びR^3は、前記定義通りの意味、特に、好ましいとして言及した意味を有する。

個々の化合物が上記経路によっては調製できない場合、他の化合物Iの誘導体化によって又は記載した合成経路の通例の変更によって調製できる。

反応混合物は、通例のやり方、例えば水と混合し、相を分離し、また、適切な場合、粗生成物を例えばアルミナ若しくはシリカゲル上でのクロマトグラフィーによって精製することによって仕上げられる。中間体又は最終生成物が無色又は淡褐色の粘性油の形で得られることがあり、それらは減圧下及び適度に高温で揮発成分から遊離又は精製される。中間体及び最終生成物が固体として得られた場合、再結晶又は温浸によってそれらを精製することができる。

【００４７】

（害虫）

式Iの化合物及びそれらの塩は、節足動物害虫、例えばクモ類、多足類(myriapedes)及び昆虫並びに線虫類を効率的に防除するのに特に適している。

式Iの化合物で防除される動物害虫としては例えば以下のものが挙げられる。

鱗翅目(レピドプテラ(Lepidoptera))の昆虫、例えばアグロチス・イプシロン(Agrotis ypsilon)、アグロチス・セゲツム(Agrotis segetum)、アラバマ・アルギラセア(Alabama argillacea)、アンチカルシア・ゲンマタリス(Anticarsia gemmatalis)、アルギレスチア

・コンジュゲラ(Argyresthia conjugella)、オートグラファ・ガンマ(Autographa gamma)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、カコエシア・ムリナナ(Cacoecia murinana)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、ケイマトビア・ブルマタ(Cheimatobia brumata)、コリストネウラ・フミフェラナ(Choristoneura fumiferana)、コリストネウラ・オシデンタリス(choristoneura occidentalis)、シルフィス・ウニプンクタ(Cirphis unipuncta)、シジア・ポモネラ(Cydia pomonella)、デンドロリムス・ピニ(Dendrolimus pini)、ジアファニア・ニチダリス(Diaphania nitidalis)、ジアトラエア・グランジオセラ(Diatraea grandiosella)、エアリアス・インスラナ(Earias insulana)、エラスモパルプス・リグノセルス(Elasmopalpus lignosellus)、ユーポエシリア・アンビグエラ(Eupoecilia ambiguella)、エベトリア・ボウリアナ(Evetria bouliana)、フェルチア・スブテラネア(Feltia subterranea)、ガレリア・メロネラ(Galleria mellonella)、グラホリタ・フネブラナ(Grapholitha funebrana)、グラホリタ・モレスタ(Grapholitha molesta)、ヘリオチス・アルミゲラ(Heliothis armigera)、ヘリオチス・ビレセンス(Heliothis virescens)、ヘリオチス・ゼア(Heliothis zea)、ヘルラ・ウンダリス(Hellula undalis)、ヒベルニア・デホリアリア(Hibernia defoliaria)、ヒファントリア・クネア(Hyphantria cunea)、ヒポノメウタ・マリネルス(Hyponomeuta malinellus)、ケイフェリア・リコペルシセラ(Keiferia lycopersicella)、ランブジナ・フィセラリア(Lambdina fiscellaria)、ラフィグマ・エキシグア(Laphygma exigua)、ロイコプテラ・コフェエラ(Leucoptera coffeella)、ロイコプテラ・シテラ(Leucoptera scitella)、リトコレチス・ブランカルデラ(Lithocolletis blancardella)、ロベシア・ボトラナ(Lobesia botrana)、ロキソステージ・スチクチカリス(Loxostege sticticalis)、リマントリア・ジスパル(Lymantria dispar)、リマントリア・モナカ(Lymantria monacha)、リオネチア・クレルケラ(Lyonetia clerkella)、マラコソマ・ネウストリア(Malacosoma neustria)、マメストラ・ブラッシカエ(Mamestra brassicae)、オルギイア・プソイドツガタ(Orgyia pseudotsugata)、オストリニア・ヌビラリス(Ostrinia nubilalis)、パノリス・フランメア(Panolis flammea)、ペクチノホラ・ゴッシピエラ(Pectinophora gossypiella)、ペリドロマ・サウシア(Peridroma saucia)、ファレラ・ブセファラ(Phalera bucephala)、フトリマエア・オペルクレラ(Phthorimaea operculella)、フィロクニスチス・シトレラ(Phyllocnistis citrella)、ピエリス・ブラッシカ(Pieris brassicae)、プラチペナ・スカブラ(Plathypena scabra)、プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella)、プソイドプルシア・インクルデンス(Pseudoplusia includens)、リアシオニア・フルストラナ(Rhyacionia frustrana)、スクロビパルプラ・アブソルタ(Scrobipalpula absoluta)、シトトロガ・セレアレラ(Sitotroga cerealella)、スパルガノチス・ピレリアナ(Sparganothis pilleriana)、スポドプテラ・フルギペルダ(Spodoptera frugiperda)、スポドプテラ・リットラリス(Spodoptera littoralis)、スポドプテラ・リツラ(Spodoptera litura)、タウマトポエア・ピチオカンパ(Thaumatopoea pityocampa)、トルトリキス・ビリダナ(Tortrix viridana)、トリコプルシア・ニ(Trichoplusia ni)及びゼイラフェラ・カナデンシス(Zeiraphera Canadensis)；

鞘翅目(コレオプテラ(Coleoptera))、例えばアグリルス・シヌアツス(Agrilus sinuatus)、アグリオテス・リネアツス(Agriotes lineatus)、アグリオテス・オブスクルス(Agriotes obscurus)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(Amphimallus solstitialis)、アニサンドラス・ジスパル(Anisandrus dispar)、アントノムス・グランジス(Anthonomus grandis)、アントノムス・ポモルム(Anthonomus pomorum)、アフトナ・ユーホリダエ(Aphthona euphoridae)、アトウス・ヘモロイダリス(Athous haemorrhoidalis)、アトマリア・リネアリス(Atomaria linearis)、ブラストファグス・ピニペルダ(Blastophagus piniperda)、ブリトフェガ・ウンダータ(Blitophaga undata)、ブルクス・ルフィマヌス(Bruchus rufimanus)、ブルクス・ピソルム(Bruchus pisorum)、ブルクス・レンチス(Bruchus lentis)、ビクチスクス・ベツラ(Byctiscus betulae)、カッシダ・ネブロサ(Cassida nebulosa)、セロトマ・トリフルカタ(Cerotoma trifurcata)、セトニア・オーラタ(Cetonia aurata)、シュートリンクス・アッシミリス(Ceuthorrhynchus assimilis)、シュートリンクス

・ナピ(Ceuthorrhynchus napi)、カエトクネマ・チビアリス(Chaetocnema tibialis)、コノデルス・ベスペルチヌス(Conoderus vespertinus)、クリオセリス・アスパラギ(Crioceris asparagi)、クテニセラ種(Ctenicera ssp.)、ジアブロチカ・ロンギコルニス(Diabrotica longicornis)、ジアブロチカ・セミプンククタ(Diabrotica semipunctata)、ジアブロチカ・12-プンクタタ(Diabrotica 12-punctata)、ジアブロチカ・スペシオサ(Diabrotica speciosa)、ジアブロチカ・ビルギフェラ(Diabrotica virgifera)、エピラクナ・バリベスチス(Epilachna varivestis)、エピトリキス・ヒルチペンニス(Epitrix hirtipennis)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(Eutinobothrus brasiliensis)、ヒロビウス・アビエチス(Hylobius abietis)、ヒペラ・ブルンネイペンニス(Hypera brunneipennis)、ヒペラ・ポスチカ(Hypera postica)、イプス・チポグラフス(Ips typographus)、レマ・ビリネアタ(Lema bilineata)、レマ・ビリネアタ(Lema melanopus)、レプチノタルサ・デセムリネアタ(Leptinotarsa decemlineata)、リモニウス・カリホルニクス(Limonius californicus)、リッソロプトルス・オリゾフィルス(Lissorhoptrus oryzophilus)、メラノツス・コンムニス(Melanotus communis)、メリゲテス・アエネウス(Meligethes aeneus)、メロロンタ・ヒッポカスタニ(Melolontha hippocastani)、ロロンタ・メロロンタ(Melolontha melolontha)、オウレマ・オリザエ(Oulema oryzae)、キンケクチブトゾウムシ(オチオリンクス・スルカツス(Otiorrhynchus sulcatus)、オチオリンクス・オバツス(Otiorrhynchus ovatus)、ファエドン・コクレアリエ(Phaedon cochleariae)、フィロビウス・ピリ(Phyllobius pyri)、フィロトレタ・クリソセファラ(Phyllotreta chrysocephala)、フィロファガ種(Phyllophaga sp.)、フィロペルタ・ホルチコラ(Phyllopertha horticola)、フィロトレタ・ネモルム(Phyllotreta nemorum)、フィロトレタ・ストリオラタ(Phyllotreta striolata)、ポピリア・ジャポニカ(Popillia japonica)、シトナ・リネアツス(Sitona lineatus)及びシトフィルス・グラナリア(Sitophilus granaria)；

ハエ、蚊(双翅目(Diptera))、例えばアエデス・アエギプチ(Aedes aegypti)、アエデス・アルボピクツス(Aedes albopictus)、アエデス・ベキサンス(Aedes vexans)、アナストレファ・ルデンス(Anastrepha ludens)、アノフェレス・マクリペンニス(Anopheles maculipennis)、アノフェレス・クルシアンス(Anopheles crucians)、アノフェレス・アルビマヌス(Anopheles albimanus)、アノフェレス・ガンビエ(Anopheles gambiae)、アノフェレス・フレエボルニ(Anopheles freeborni)、アノフェレス・ロイコスフィルス(Anopheles leucosphyrus)、アノフェレス・ミニムス(Anopheles minimus)、アノフェレス・クアドリマクラツス(Anopheles quadrimaculatus)、カリホラ・ビシナ(Calliphora vicina)、セラチチス・カピタタ(Ceratitis capitata)、クリソミア・ベッジアナ(Chrysomya bezziana)、クリソミア・ホミニボラキス(Chrysomya hominivorax)、クリソミア・マセラリア(Chrysomya macellaria)、クリソプス・ジスカリス(Chrysops discalis)、クリソプス・シラセア(Chrysops silacea)、クリソプス・アトランチクス(Chrysops atlanticus)、コクリオミイア・ホミニボラキス(Cochliomyia hominivorax)、コンタリニア・ソルギコラ(Contarinia sorghicola)、コルジルオビア・アントロポファガ(Cordylobia anthropophaga)、クリコイデス・フレンス(Culicoides furens)、クレックス・ピピエンス(Culex pipiens)、クレックス・ニグリパルプス(Culex nigripalpus)、クレックス・キンクファシアツス(Culex quinquefasciatus)、クレックス・タルサリス(Culex tarsalis)、クリセタ・イノルナタ(Culiseta inornata)、クリセタ・メラヌラ(Culiseta melanura)、ダクス・ククルビタ(Dacus cucurbitae)、ダクス・オレア(Dacus oleae)、ダシネウラ・ブラッシカ(Dasineura brassicae)、デリア・アンティーク(Delia antique)、デリア・コアルクタタ(Delia coarctata)、デリア・プラツラ(Delia platura)、デリア・ラジクム(Delia radicum)、デルマトビア・ホミニス(Dermatobia hominis)、ファンニア・カニクラリス(Fannia canicularis)、ゲオミザ・トリプンクタタ(Geomyza Tripunctata)、ガステロフィルス・インテスチナリス(Gasterophilus intestinalis)、グロッシナ・モルシタンス(Glossina morsitans)、グロッシナ・パルパリス(Glossina palpalis)、グロッシナ・フスシペス(Glossina fuscipes)、グロッシナ・タキノイデス(Glossina tachinoides)、ハエマトビア・イリタンス(Haematobia irritans)、ハプロジプロシス・エクエストリス(Haplodiplosis eque

stris)、ヒッペラテス種(Hippelates spp.)、ヒルエミイア・プラツラ(Hylemyia platura)、ヒポデルマ・リネアタ(Hypoderma lineata)、レプトコノプス・トレンス(Leptoconops torrens)、リリオマイザ・サチベ(Liriomyza sativae)、リリオマイザ・トリホリイ(Liriomyza trifolii)、ルシリア・カプリナ(Lucilia caprina)、ルシリア・クプリナ(Lucilia cuprina)、ルシリア・セリカタ(Lucilia sericata)、リコリア・ペクトラリス(Lycoria pectoralis)、マンソニア・チチラヌス(Mansonia titillanus)、マイエチオラ・デストルクトル(Mayetiola destructor)、ムスカ・オータムナリス(Musca autumnalis)、ムスカ・ドメスチカ(Musca domestica)、ムシナ・スタブランス(Muscina stabulans)、オエストルス・オビス(Oestrus ovis)、オポミザ・フロルム(Opomyza florum)、オシネラ・フリット(Oscinella frit)、ペゴミア・ヒソシアミ(Pegomya hysocyami)、ホルビア・アンチクア(Phorbia antiqua)、ホルビア・ブラッシカ(Phorbia brassicae)、ホルビア・コアルクタタ(Phorbia coarctata)、フレボトムス・アルゲンチペス(Phlebotomus argentipes)、プソロホラ・コルンビエ(Psorophora columbiae)、プシラ・ロゼ(Psila rosae)、プソロホラ・ジスコロール(Psorophora discolor)、プロシムリウム・ミクスツム(Prosimulium mixtum)、ラゴレチス・セラシ(Rhagoletis cerasi)、ラゴレチス・ポモネラ(Rhagoletis pomonella)、サルコファガ・ヘモロイダリス(Sarcophaga haemorrhoidalis)、サルコファガ種(Sarcophaga spp.)、シムリウム・ビッタツム(Simulium vittatum)、ストモキス・カルシトランス(Stomoxys calcitrans)、タバヌス・ボビヌス(Tabanus bovinus)、タバヌス・アトラツス(Tabanus atratus)、タバヌス・リネオラ(Tabanus lineola)、及びタバヌス・シミリス(Tabanus similis)、チプラ・オレラセア(Tipula oleracea)、及びチプラ・パルドサ(Tipula paludosa)；

アザミウマ(総翅類(Thysanoptera))、例えばジクロモトリプス・コルベッチ(Dichromothrips corbetti)、ジクロモトリプス種(Dichromothrips ssp.)、フランクリニエラ・フスカ(Frankliniella fusca)、フランクリニエラ・オシデンタリス(Frankliniella occidentalis)、フランクリニエラ・トリチシ(Frankliniella tritici)、シルトトリプス・シトリ(Scirtothrips citri)、トリプス・オリザエ(Thrips oryzae)、トリプス・パルミ(Thrips palmi)及びトリプス・タバシ(Thrips tabaci)、

シロアリ類(等翅目(Isoptera))、例えばカロテルメス・フラビコリス(Calotermes flavicollis)、ロイコテルメス・フラビペス(Leucotermes flavipes)、ヘテロテルメス・アウレアス(Heterotermes aureus)、レチクリテルメス・フラビペス(Reticulitermes flavipes)、レチクリテルメス・ビルギニクス(Reticulitermes virginicus)、レチクリテルメス・ルシフグス(Reticulitermes lucifugus)、レチクリテルメス・サントネンシス(Reticulitermes santonensis)、レチクリテルメス・グラセイ(Reticulitermes grassei)、テルメス・ナタレンシス(Termes natalensis)、及びコプトテルメス・ホルモサヌス(Coptotermes formosanus)；

ゴキブリ類(ゴキブリ目(Blattaria)-ブラットダエ(Blattodea))、例えば ブラッテラ・ゲルマニカ(Blattella germanica)、ブラッテラ・アサヒネ(Blattella asahinae)、ペリプラネタ・アメリカナ(Periplaneta americana)、ペリプラネタ・ジャポニカ(Periplaneta japonica)、ペリプラネタ・ブルンネア(Periplaneta brunnea)、ペリプラネタ・フリギノサ(Periplaneta fuligginosa)、ペリプラネタ・アウストララシエ(Periplaneta australasiae)、及びブラッタ・オリエンタリス(Blatta orientalis)；

虫(bugs)、アブラムシ、ヨコバイ、コナジラミ類、カイガラムシ、セミ (半翅類))、例えばアクロステルヌム・ヒラレ(Acrosternum hilare)、ブリスス・ロイコプテルス(Blissus leucopterus)、シルトペルチス・ノタツス(Cyrtopeltis notatus)、ジスデルクス・シングラツス(Dysdercus cingulatus)、ジスデルクス・インテルメジウス (Dysdercus intermedius)、ユリガステル・インテグリセプス(Eurygaster integriceps)、ユスキスツス・インピクチベントリス(Euschistus impictiventris)、レプトグロッスス・フィロプス(Leptoglossus phyllopus)、リグス・リネオラリス(Lygus lineolaris)、リグス・プラテンシス(Lygus pratensis)、ネザラ・ビリズラ(Nezara viridula)、ピエスマ・クアドラタ(Piesma quadrata)、ソルベア・インスラリス(Solubea insularis)、チアンタ・ペルジト

ル(Thyanta perditor)、アシルトシホン・オノブリキス(Acyrthosiphon onobrychis)、アデルゲス・ラリシス(Adelges laricis)、アフィデュラ・ナスツルチイ(Aphidula nasturtii)、アフィス・ファバエ(Aphis fabae)、アフィス・ホルベシ(Aphis forbesi)、アフィス・ポミ(Aphis pomi)、アフィス・ゴシピイ(Aphis gossypii)、アフィス・グロスラリア(Aphis grossulariae)、アフィス・スクネイデリ(Aphis schneideri)、アフィス・スピラエコラ(Aphis spiraecola)、アフィス・サンブシ(Aphis sambuci)、アシルトシホン・ピスム(Acyrthosiphon pisum)、オーラコルツム・ソラニ(Aulacorthum solani)、ベミシア・アルゲンチホリイ(Bemisia argentifolii)、ブラキカウデュス・カルデュイ(Brachycaudus cardui)、ブラキカウデュス・ヘリクリシ(Brachycaudus helichrysi)、ブラキカウデュス・ペルシカ(Brachycaudus persicae)、ブラキカウデュス・プルニコラ(Brachycaudus prunicola)、ブレビコリン・ブラッシカ(Brevicoryne brassicae)、カピトホルス・ホルニ(Capitophorus horni)、セロシファ・ゴシピイ(Cerosipha gossypii)、カエトシホン・フラガエホリイ(Chaetosiphon fragaefolii)、クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、ドレイフシア・ノルドマンニアナ(Dreyfusia nordmannianae)、ドレイフシア・ピセア(Dreyfusia piceae)、ジサフィス・ラジコラ(Dysaphis radicola)、ジサウラコルツム・プソイドソラニ(Dysaulacorthum pseudosolani)、ジサフィス・プランタギネア(Dysaphis plantaginea)、ジサフィス・ピリ(Dysaphis pyri)、エンポアスカ・ファバエ(Empoasca fabae)、ヒアロプテルス・プルニ(Hyalopterus pruni)、ヒペロミズス・ラクツカエ(Hyperomyzus lactucae)、マクロシフム・アベナエ(Macrosiphum avenae)、マクロシフム・ユーホルビエ(Macrosiphum euphorbiae)、マクロシホン・ロサエ(Macrosiphon rosae)、メゴウラ・ビシエ(Megoura viciae)、メラナフィス・ピラリウス(Melanaphis pyrarius)、メトポロフィウム・ジロデュム(Metopolophium dirhodum)、ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae)、ミズス・アスカロニクス(Myzus ascalonicus)、ミズス・セラシ(Myzus cerasi)、ミズス・バリアンス(Myzus varians)、ナソノビア・リビスニグリ(Nasonovia ribis-nigri)、ニラパルバタ・ルゲンス(Nilaparvata lugens)、ペンフィグス・ブルサリウス(Pemphigus bursarius)、ペルキンシエラ・サッカリシダ(Perkinsiella saccharicida)、ホロドン・フムリ(Phorodon humuli)、プシラ・マリ(Psylla mali)、プシラ・ピリ(Psylla piri)、ロパロミズス・アスカロニクス(Rhopalomyzus ascalonicus)、ロパロシフム・マイジス(Rhopalosiphum maidis)、ロパロシフム・パジ(Rhopalosiphum padi)、ロパロシフム・インセルツム(Rhopalosiphum insertum)、サッパフィス・マラ(Sappaphis mala)、サッパフィス・マリ(Sappaphis mali)、スチザフィス・グラミヌム(Schizaphis graminum)、スチゾネウラ・ラヌギノサ(Schizoneura lanuginosa)、シトビオン・アベナエ(Sitobion avenae)、トリアロイロデス・バポラリオルム(Trialeurodes vaporariorum)、トキソプテラ・オーランチイアンド(Toxoptera aurantiiand)、ビテウス・ビチホリイ(Viteus vitifolii)、シメックス・レクツラリウス(Cimex lectularius)、シメックス・ヘミプテルス(Cimex hemipterus)、レデュビウス・セニリス(Reduvius senilis)、トリアトーマ種(Triatoma spp.)、及びアリルス・クリタツス(Arilus critatus)；

アリ、ミツバチ、スズメバチ、ハバチ類(膜翅目(Hymenoptera))、例えばアタリア・ロサエ(Athalia rosae)、アッタ・セファロテス(Atta cephalotes)、アッタ・カピグアラ(Atta capiguara)、アッタ・セファロテス(Atta cephalotes)、アッタ・ラエビガタ(Atta laevigata)、アッタ・ロブスタ(Atta robusta)、アッタ・セキスデンス(Atta sexdens)、アッタ・テキサナ(Atta texana)、クレマトガステル種(Crematogaster spp.)、ホプロカンパ・ミヌタ(Hoplocampa minuta)、ホプロカンパ・テスツジネア(Hoplocampa testudinea)、ラウシウス・ニガー(Lasius niger)、モノモリウム・ファラオニス(Monomorium pharaonis)、ソレノプシス・ゲミナタ(Solenopsis geminata)、ソレノプシス・インビクタ(Solenopsis invicta)、ソレノプシス・リクテリ(Solenopsis richteri)、ソレノプシス・キシロニ(Solenopsis xyloni)、ポゴノミルメックス・バルバツス(Pogonomyrmex barbatus)、ポゴノミルメックス・カリホルニクス(Pogonomyrmex californicus)、フェイドール・メガセファーラ(Pheidole megacephala)、ダシムチラ・オッシデンタリス(Dasymutilla occidentalis)、ボンブス種(Bombus spp.)、ベスプラ・スクアモサ(Vespula squamosa)、

パラベスプラ・ブルガリス(Paravespula vulgaris)、パラベスプラ・ペンシルバニカ(Paravespula pennsylvanica)、パラベスプラ・ゲルマニカ(Paravespula germanica)、ドリコベスプラ・マクラタ(Dolichovespula maculata)、ベスパ・クラブロ(Vespa crabro)、ポリステス・ルビギノサ(Polistes rubiginosa)、カンポノツス・フロリダヌス(Camponotus floridanus)、及びリネピテマ・フミル(Linepithema humile)；

コオロギ、バッタ、ワタリバッタ類(直翅目(Orthoptera))、例えばアケタ・ドメスチカ(Acheta domestica)、グリロタルパ・グリロタルパ(Gryllotalpa gryllotalpa)、ロクスタ・ミグラトリア(Locusta migratoria) 、メラノプルス・ビビッタツス(Melanoplus bivittatus)、メラノプルス・フェムルブルム(Melanoplus femurrubrum)、メラノプルス・メキシカヌス(Melanoplus mexicanus)、メラノプルス・サングイニペス(Melanoplus sanguinipes)、メラノプルス・スプレツス(Melanoplus spretus)、ノマダクリス・セプテンファシアタ(Nomadacris septemfasciata)、スキストセルカ・アメリカナ(Schistocerca americana)、スキストセルカ・グレガリア(Schistocerca gregaria)、ドシオスタウルス・マロッカヌス(Dociostaurus maroccanus)、タキシネス・アシナモルス(Tachycines asynamorus)、オエダロイス・セネガレンシス(Oedaleus senegalensis)、ゾノゼルス・バリエガツス(Zonozerus variegatus)、ヒエログリフス・ダガネンシス(Hieroglyphus daganensis)、クラウッサリア・アングリフェラ(Kraussaria angulifera)、カリプタムス・イタリクス(Calliptamus italicus)、コルトイセテス・テルミニフェラ(Chortoicetes terminifera)、及びロクスタナ・パルダリナ(Locustana pardalina)；

アラクノイデア(arachnoidea)、例えばクモ類(アカリナ(Acarina))、例えばヒメダニ科(Argasidae)、マダニ科(Ixodidae)及びヒゼンダニ科(Sarcoptidae)の、例えばアンブリオンマ・アメリカヌム(Amblyomma americanum)、アンブリオンマ・バリエガツム(Amblyomma variegatum)、アンブリオンマ・マクラツム(Ambryomma maculatum)、アルガス・ペルシクス(Argas persicus)、ボオフィルス・アンヌラツス(Boophilus annulatus)、ボオフィルス・デコロラツス(Boophilus decoloratus)、ボオフィルス・ミクロプルス(Boophilus microplus)、デルマセントル・シルバルム(Dermacentor silvarum)、デルマセントル・アンデルソニ(Dermacentor andersoni)、デルマセントル・バリアビリス(Dermacentor variabilis)、ヒアロンマ・トルンカツム(Hyalomma truncatum)、イキソデス・リシヌス(Ixodes ricinus)、イキソデス・ルビクンデュス(Ixodes rubicundus)、イキソデス・スカプラリス(Ixodes scapularis)、イキソデス・ホロシクルス(Ixodes holocyclus)、イキソデス・パシフィクス(Ixodes pacificus)、オルニトドルス・モウバタ(Ornithodorus moubata)、オルニトドルス・ヘルムシ(Ornithodorus hermsi)、オルニトドルス・ツリカタ(Ornithodorus turicata)、オルニトニッスス・バコチ(Ornithonyssus bacoti)、オトビウス・メグニニ(Otobius megnini)、デルマニッスス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、プソロプテス・オビス(Psoroptes ovis)、ライピセファルス・サングイネウス(Rhipicephalus sanguineus)、ライピセファルス・アッペンジクラツス(Rhipicephalus appendiculatus)、ライピセファルス・エベルトシ(Rhipicephalus evertsi)、サルコプテス・スカビエイ(Sarcoptes scabiei)、及びフシダニ科の種(Eriophyidae spp.)、例えばアクルス・スクレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、フィロコプトラタ・オレイボラ(Phyllocoptrata oleivora)及びエリオフィエス・シェルドニ(Eriophyes sheldoni)；ホコリダニ科の種(Tarsonemidae spp.)、例えばフィトネムス・パリズス(Phytonemus pallidus)及びポリファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus latus)；ヒメハダニ科の種(Tenuipalpidae spp.)、例えばブレビパルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)；ハダニ科の種(Tetranychidae spp.)、例えばテトラニクス・シンナバリヌス(Tetranychus cinnabarinus)、テトラニクス・カンザワイ(Tetranychus kanzawai)、テトラニクス・パシフィクス(Tetranychus pacificus)、テトラニクス・テラリウス(Tetranychus telarius)及びテトラニクス・ウルチカエ(Tetranychus urticae)、パノニクス・ウルミ(Panonychus ulmi)、パノニクス・シトリ(Panonychus citri)、及びオリゴニクス・プラテンシス(Oligonychus pratensis)；真正クモ類(Araneida)、例えばラトロデクツス・マクタンス(Latrodectus mactans)、及びロキソセレス・レクルサ(Loxosceles reclusa)；

ノミ類(ノミ目(Siphonaptera))、例えばクテノセファリデス・フェリス(Ctenocephalides felis)、クテノセファリデス・カニス(Ctenocephalides canis)、キセノプシラ・ケオプシス(Xenopsylla cheopis)、プレックス・イリタンス(Pulex irritans)、ツンガ・ペネトランス(Tunga penetrans)、及びノソプシルルス・ファシアツス(Nosopsyllus fasciatus)、

シミ(silverfish)、マダラシミ(firebrat)(総尾類(Thysanura))、例えば(レピスマ・サッカリナ(Lepisma saccharina)及びテルモビア・ドメスチカ(Thermobia domestica)、

ムカデ(唇脚綱(Chilopoda))、例えばスクチゲラ・コレオプトラタ(Scutigera coleoptrata)、

ヤスデ(倍脚綱(Diplopoda))、例えばナルセウス種(Narceus spp.)、

ハサミムシ類(Earwigs)(革翅目(Dermaptera))、例えばホルフィクラ・アウリクラリア(forficula auricularia)、

シラミ(シラミ目(Phthiraptera))、例えば(ペジクルス・ヒューマヌス・カピチス(Pediculus humanus capitis)、ペジクルス・ヒューマヌス・コルポリス(Pediculus humanus corporis)、プチルス・プビス(Pthirus pubis)、ヘマトピヌス・ユーリステルヌス(Haematopinus eurysternus)、ヘマトピヌス・スイス(Haematopinus suis)、リノグナツス・ビツリ(Linognathus vituli)、ボビコラ・ボビス(Bovicola bovis)、メノポン・ガリナエ(Menopon gallinae)、メナカンツス・ストラミネウス(Menacanthus stramineus)及びソレノポテス・カピラツス(Solenopotes capillatus)。

粘管目(トビムシ(springtails))、例えばオニキウルス種(Onychiurus ssp.)。

【００４８】

それらは、以下の線虫類の防除にも適している：植物寄生線虫類、例えばネコブセンチュウ、メロイドギネ・ハプラ(Meloidogyne hapla)、メロイドギネ・インコグニタ(Meloidogyne incognita)、メロイドギネ・ジャバニカ(Meloidogyne javanica)、及び他のメロイドギネ種；シスト形成線虫類、グロボデラ・ロストキエンシス(Globodera rostochiensis)及び他のグロボデラ(Globodera)種；ヘテロデラ・アベナエ(Heterodera avenae)、ヘテロデラ・グリシネス(Heterodera glycines)、ヘテロデラ・スカクチイ(Heterodera schachtii)、ヘテロデラ・トリホリイ(Heterodera trifolii)、及び他のヘテロデラ種；タネコブセンチュウ類(Seed gall nematodes)、アングイナ(Anguina)種；茎及び葉の線虫類、アフェレンコイデス種(Aphelenchoides species)；刺毛センチュウ類(Sting nematodes)、ベロノライムス・ロンギカウダツス(Belonolaimus longicaudatus)及び他のベロノライムス種；マツセンチュウ類(Pine nematodes)、ブルサフェレンクス・キシロフィルス(Bursaphelenchus xylophilus)及び他のブルサフェレンクス種；ワセンチュウ類(Ring nematodes)、クリコネマ(Criconema)種、クリコネメラ(Criconemella)種、クリコネモイデス(Criconemoides)種、メソクリコネマ(Mesocriconema)種；幹及び鱗茎センチュウ類、ジチレンクス・デストルクター(Ditylenchus destructor)、ジチレンクス・ジプサシ(Ditylenchus dipsaci)及び他のジチレンクス(Ditylenchus)種；キリセンチュウ類(Awl nematodes)、ドリコドルス(Dolichodorus)種；ラセンセンチュウ類(Spiral nematodes)、ヘリコチレンクス・ムルチシンクツス(Heliocotylenchus multicinctus)及び他のヘリコチレンクス(Helicotylenchus)種；葉鞘及び鞘様センチュウ類(sheath and sheathoid nematodes)、ヘミシクリオホラ(Hemicycliophora)種及びヘミクリコネモイデス(Hemicriconemoides)種；ヒルスマンニエラ(Hirshmanniella)種；ヤリセンチュウ類(Lance nematodes)、ホプロライムス(Hoploaimus)種；ニセネコブセンチュウ類(false rootknot nematodes)、ナコブス(Nacobbus)種；ハリセンチュウ類(Needle nematodes)、ロンギドルス・エロンガテス(Longidorus elongatus)及び他のロンギドルス(Longidorus)種；ネグサレセンチュウ類(Lesion nematodes)、プラチレンクス・ネグレクツス(Pratylenchus neglectus)、プラチレンクス・ペネトランス(Pratylenchus penetrans)、プラチレンクス・クルビタツス(Pratylenchus curvitatus)、プラチレンクス・ゴーデイ(Pratylenchus goodeyi)及び他のプラチレンクス(Pratylenchus)種；ネモグリセンチュウ類(Burrowing nematodes)、ラドホルス・シミリス(Radopholus similis)及び他のラドホルス(Radopholus)種；ニセフクロセンチュウ

類(Reniform nematodes)、ロチレンクルス・レニホルミス(Rotylenchus robustus)及び他のロチレンクルス(Rotylenchus)種；スクテロネマ(Scutellonema)種；ユミハリセンチュウ類(Stubby root nematodes)、トリコドルス・プリミチブス(Trichodorus primitivus)及び他のand other トリコドルス(Trichodorus)種、パラトリコドルス(Paratrichodorus)種；イシュクセンチュウ類(Stunt nematodes)、チレンコリンクス・クライトニ(Tylenchorhynchus claytoni)、チレンコリンクス・デュビウス(Tylenchorhynchus dubius)及び他のチレンコリンクス(Tylenchorhynchus)種；ミカンセンチュウ類(Citrus nematodes)、チレンクルス(Tylenchulus)種；オオハリセンチュウ類(Dagger nematodes)、キシフィネマ(Xiphinema)種；及び他の植物寄生線虫種。

【００４９】

式Iの化合物及びそれらの塩は、クモ類(アラクノイデア(Arachnoidea))、例えばクモ類(アカリナ(Acarina))、例えばヒメダニ科(Argasidae)、マダニ科(Ixodidae)及びヒゼンダニ科(Sarcoptidae)、例えばアンブリオンマ・アメリカヌム(Amblyomma americanum)、アンブリオンマ・バリエガツム(Amblyomma variegatum)、アルガス・ペルシクス(Argas persicus)、ボオフィルス・アンヌラツス(Boophilus annulatus)、ボオフィルス・デコロラツス(Boophilus decoloratus)、ボオフィルス・ミクロプルス(Boophilus microplus)、デルマセントル・シルバルム(Dermacentor silvarum)、ヒアロンマ・トルンカツム(Hyalomma truncatum)、イキソデス・リシヌス(Ixodes ricinus)、イキソデス・ルビクンデュス(Ixodes rubicundus)、オルニトドルス・モウバタ(Ornithodorus moubata)、オトビウス・メグニニ(Otobius megnini)、デルマニッスス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、プソロプテス・オビス(Psoroptes ovis)、ライピセファルス・サングイネウス(Rhipicephalus sanguineus)、ライピセファルス・アッペンジクラツス(Rhipicephalus appendiculatus)、ライピセファルス・エベルトシ(Rhipicephalus evertsi)、サルコプテス・スカビエイ(Sarcoptes scabiei)、及びフシダニ科の種(Eriophyidae spp.)、例えばアクルス・スクレクテンダリ(Aculus schlechtendali)、フィロコプトラタ・オレイボラ(Phyllocoptrata oleivora)及びエリオフィエス・シェルドニ(Eriophyes sheldoni)；ホコリダニ科の種(Tarsonemidae spp.)、例えばフィトネムス・パリズス(Phytonemus pallidus)及びポリファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus latus)；ヒメハダニ科の種(Tenuipalpidae spp.)、例えばブレビパルプス・ホエニシス(Brevipalpus phoenicis)；ハダニ科の種(Tetranychidae spp.)、例えばテトラニクス・シンナバリヌス(Tetranychus cinnabarinus)、テトラニクス・カンザワイ(Tetranychus kanzawai)、テトラニクス・パシフィクス(Tetranychus pacificus)、テトラニクス・テラリウス(Tetranychus telarius)及びテトラニクス・ウルチカエ(Tetranychus urticae)、パノニクス・ウルミ(Panonychus ulmi)、パノニクス・シトリ(Panonychus citri)、及びオリゴニクス・プラテンシス(Oligonychus pratensis)の防除にも有用である。

【００５０】

式Iの化合物は、昆虫、好ましくは吸うか又は刺す昆虫、例えば総翅目(Thysanoptera)、双翅目(Diptera)及び半翅目(Hemiptera)の属由来、特に以下の種の昆虫の防除にも有用である：アザミウマ類(Thysanoptera)：フランクリニエラ・フスカ(Frankliniella fusca)、フランクリニエラ・オシデンタリス(Frankliniella occidentalis)、フランクリニエラ・トリチシ(Frankliniella tritici)、シルトトリプス・シトリ(Scirtothrips citri)、トリプス・オリザエ(Thrips oryzae)、トリプス・パルミ(Thrips palmi)及びトリプス・タバシ(Thrips tabaci)、双翅目(Diptera)、例えばアエデス・アエギプチ(Aedes aegypti)、アエデス・アルボピクツス(Aedes albopictus)、アエデス・ベキサンス(Aedes vexans)、アナストレファ・ルデンス(Anastrepha ludens)、アノフェレス・マクリペンニス(Anopheles maculipennis)、アノフェレス・クルシアンス(Anopheles crucians)、アノフェレス・アルビマヌス(Anopheles albimanus)、アノフェレス・ガンビエ(Anopheles gambiae)、アノフェレス・フレエボルニ(Anopheles freeborni)、アノフェレス・ロイコスフィルス(Anopheles leucosphyrus)、アノフェレス・ミニムス(Anopheles minimus)、アノフェレス・クアドリマクラツス(Anopheles quadrimaculatus)、カリホラ・ビシナ(Callipho

ra vicina)、セラチチス・カピタタ(Ceratitis capitata)、クリソミア・ベッジアナ(Chrysomya bezziana)、クリソミア・ホミニボラキス(Chrysomya hominivorax)、クリソミア・マセラリア(Chrysomya macellaria)、クリソプス・ジスカリス(Chrysops discalis)、クリソプス・シラセア(Chrysops silacea)、クリソプス・アトランチクス(Chrysops atlanticus)、コクリオミイア・ホミニボラキス(Cochliomyia hominivorax)、コンタリニア・ソルギコラ(Contarinia sorghicola)、コルジルオビア・アントロポファガ(Cordylobia anthropophaga)、クリコイデス・フレンス(Culicoides furens)、クレックス・ピピエンス(Culex pipiens)、クレックス・ニグリパルプス(Culex nigripalpus)、クレックス・キンクファシアツス(Culex quinquefasciatus)、クレックス・タルサリス(Culex tarsalis)、クリセタ・イノルナタ(Culiseta inornata)、クリセタ・メラヌラ(Culiseta melanura)、ダクス・ククルビタ(Dacus cucurbitae)、ダクス・オレア(Dacus oleae)、ダシネウラ・ブラッシカ(Dasineura brassicae)、デリア・アンティーク(Delia antique)、デリア・コアルクタタ(Delia coarctata)、デリア・プラツラ(Delia platura)、デリア・ラジクム(Delia radicum)、デルマトビア・ホミニス(Dermatobia hominis)、ファンニア・カニクラリス(Fannia canicularis)、ゲオミザ・トリプンクタタ(Geomyza Tripunctata)、ガステロフィルス・インテスチナリス(Gasterophilus intestinalis)、グロッシナ・モルシタンス(Glossina morsitans)、グロッシナ・パルパリス(Glossina palpalis)、グロッシナ・フスシペス(Glossina fuscipes)、グロッシナ・タキノイデス(Glossina tachinoides)、ハエマトビア・イリタンス(Haematobia irritans)、ハプロジプロシス・エクエストリス(Haplodiplosis equestris)、ヒッペラテス種(Hippelates spp.)、ヒルエミイア・プラツラ(Hylemyia platura)、ヒポデルマ・リネアタ(Hypoderma lineata)、レプトコノプス・トレンス(Leptoconops torrens)、リリオマイザ・サチベ(Liriomyza sativae)、リリオマイザ・トリホリイ(Liriomyza trifolii)、ルシリア・カプリナ(Lucilia caprina)、ルシリア・クプリナ(Lucilia cuprina)、ルシリア・セリカタ(Lucilia sericata)、リコリア・ペクトラリス(Lycoria pectoralis)、マンソニア・チチラヌス(Mansonia titillanus)、マイエチオラ・デストルクトル(Mayetiola destructor)、ムスカ・オータムナリス(Musca autumnalis)、ムスカ・ドメスチカ(Musca domestica)、ムシナ・スタブランス(Muscina stabulans)、オエストルス・オビス(Oestrus ovis)、オポミザ・フロルム(Opomyza florum)、オシネラ・フリット(Oscinella frit)、ペゴミア・ヒソシアミ(Pegomya hysocyami)、ホルビア・アンチクア(Phorbia antiqua)、ホルビア・ブラッシカ(Phorbia brassicae)、ホルビア・コアルクタタ(Phorbia coarctata)、フレボトムス・アルゲンチペス(Phlebotomus argentipes)、プソロホラ・コルンビエ(Psorophora columbiae)、プシラ・ロゼ(Psila rosae)、プソロホラ・ジスコロール(Psorophora discolor)、プロシムリウム・ミクスツム(Prosimulium mixtum)、ラゴレチス・セラシ(Rhagoletis cerasi)、ラゴレチス・ポモネラ(Rhagoletis pomonella)、サルコファガ・ヘモロイダリス(Sarcophaga haemorrhoidalis)、サルコファガ種(Sarcophaga spp.)、シムリウム・ビッタツム(Simulium vittatum)、ストモキス・カルシトランス(Stomoxys calcitrans)、タバヌス・ボビヌス(Tabanus bovinus)、タバヌス・アトラツス(Tabanus atratus)、タバヌス・リネオラ(Tabanus lineola)、及びタバヌス・シミリス(Tabanus similis)、チプラ・オレラセア(Tipula oleracea)、及びチプラ・パルドサ(Tipula paludosa)；

半翅目(Hemiptera)、特にアブラムシ類：アシルトシホン・オノブリキス(Acyrthosiphon onobrychis)、アデルゲス・ラリシス(Adelges laricis)、アフィデュラ・ナスツルチイ(Aphidula nasturtii)、アフィス・ファバエ(Aphis fabae)、アフィス・ホルベシ(Aphis forbesi)、アフィス・ポミ(Aphis pomi)、アフィス・ゴシピイ(Aphis gossypii)、アフィス・グロスラリア(Aphis grossulariae)、アフィス・スクネイデリ(Aphis schneideri)、アフィス・スピラエコラ(Aphis spiraecola)、アフィス・サンブシ(Aphis sambuci)、アシルトシホン・ピスム(Acyrthosiphon pisum)、オーラコルツム・ソラニ(Aulacorthum solani)、ブラキカウデュス・カルデュイ(Brachycaudus cardui)、ブラキカウデュス・ヘリクリシ(Brachycaudus helichrysi)、ブラキカウデュス・ペルシカ(Brachycaudus persicae)、ブラキカウデュス・プルニコラ(Brachycaudus prunicola)、ブレビコリン・ブラッシ

カ(Brevicoryne brassicae)、カピトホルス・ホルニ(Capitophorus horni)、セロシファ・ゴシピイ(Cerosipha gossypii)、カエトシホン・フラガエホリイ(Chaetosiphon fragaefolii)、クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、ドレイフシア・ノルドマンニアナ(Dreyfusia nordmannianae)、ドレイフシア・ピセア(Dreyfusia piceae)、ジサフィス・ラジコラ(Dysaphis radicola)、ジサウラコルツム・プソイドソラニ(Dysaulacorthum pseudosolani)、ジサフィス・プランタギネア(Dysaphis plantaginea)、ジサフィス・ピリ(Dysaphis pyri)、エンポアスカ・ファバエ(Empoasca fabae)、ヒアロプテルス・プルニ(Hyalopterus pruni)、ヒペロミズス・ラクツカエ(Hyperomyzus lactucae)、マクロシフム・アベナエ(Macrosiphum avenae)、マクロシフム・ユーホルビエ(Macrosiphum euphorbiae)、マクロシホン・ロサエ(Macrosiphon rosae)、メゴウラ・ビシエ(Megoura viciae)、メラナフィス・ピラリウス(Melanaphis pyrarius)、メトポロフィウム・ジロデュム(Metopolophium dirhodum)、ミゾデス・ペルシカエ(Myzodes persicae)、ミズス・アスカロニクス(Myzus ascalonicus)、ミズス・セラシ(Myzus cerasi)、ミズス・バリアンス(Myzus varians)、ナソノビア・リビスニグリ(Nasonovia ribis-nigri)、ニラパルバタ・ルゲンス(Nilaparvata lugens)、ペンフィグス・ブルサリウス(Pemphigus bursarius)、ペルキンシエラ・サッカリシダ(Perkinsiella saccharicida)、ホロドン・フムリ(Phorodon humuli)、プシラ・マリ(Psylla mali)、プシラ・ピリ(Psylla piri)、ロパロミズス・アスカロニクス(Rhopalomyzus ascalonicus)、ロパロシフム・マイジス(Rhopalosiphum maidis)、ロパロシフム・パジ(Rhopalosiphum padi)、ロパロシフム・インセルツム(Rhopalosiphum insertum)、サッパフィス・マラ(Sappaphis mala)、サッパフィス・マリ(Sappaphis mali)、スチザフィス・グラミヌム(Schizaphis graminum)、スチゾネウラ・ラヌギノサ(Schizoneura lanuginosa)、シトビオン・アベナエ(Sitobion avenae)、トリアロイロデス・バポラリオルム(Trialeurodes vaporariorum)、トキソプテラ・オーランチイアンド(Toxoptera aurantiiand)、及びビテウス・ビチホリイ(Viteus vitifolii)。

【００５１】

式Iの化合物は、半翅目(Hemiptera)及び総翅目(Thysanoptera)の昆虫の防除に特に有用である。

（製剤）

本発明の方法で使用するため、式Iの化合物を通例の製剤、例えば溶液、エマルション、懸濁液、細粉(dusts)、散剤、ペースト、顆粒及び直接散布可能な溶液に変換することができる。使用形態は、特定の目的及び適用方法によって決まる。いずれの場合も本発明の式Iの化合物の微細かつ均一の分布を確保するように製剤及び適用方法を選択する。

製剤は、既知の方法(例えばレビューのためにはUS 3,060,084、EP-A 707 445(液状濃縮物について)、Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57及び以下を参照されたい。WO 91/13546、US 4,172,714、US 4,144,050、US 3,920,442、US 5,180,587、US 5,232,701、US 5,208,030、GB 2,095,558、US 3,299,566、Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 and Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Germany), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8))で、例えば、農薬製剤に好適な補助剤、例えば、溶媒及び／又は担体、所望により、乳化剤、界面活性剤及び分散剤、保存剤、消泡剤、不凍剤などを用いて、種子処理製剤の場合には、必要に応じて着色料及び／又は結合剤及び／又はゲル化剤をも用いて、本活性化合物を増量することにより調製される。

【００５２】

適切な溶媒／担体は、例えば以下の通りである。

－溶媒、例えば水、芳香族溶媒(例えばSolvesso製品、キシレン等)、パラフィン類(例えば鉱油画分)、アルコール類(例えばメタノール、ブタノール、ペンタノール、ベンジルア

ルコール)、ケトン類(例えば シクロヘキサノン、γ-ブチロラクトン)、ピロリドン類 (N-メチル-ピロリドン(NMP)、N-オクチルピロリドン(NOP)、アセタート類(二酢酸グリコール)、乳酸アルキル、ラクトン類、例えばg-ブチロラクトン、グリコール、脂肪酸ジメチルアミド、脂肪酸及び脂肪酸エステル、トリグリセリド、野菜又は動物起源の油及び変性油、例えばアルキル化植物油。原則として、溶媒混合物を使用してもよい。

－担体、例えば粉砕天然鉱物及び粉砕合成鉱物、例えばシリカゲル、微粉化ケイ酸、シリカート、タルク、カオリン、アタクレー(attaclay)、石灰石、石灰、チョーク、赤土(bole)、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム及び硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、粉砕合成材料、肥料、例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素及び植物起源の製品、例えばシリアルミール、樹皮ミール、ウッドミール及び堅果の殻(nutshell)ミール、セルロール粉末及び他の固形担体。

適切な乳化剤は、非イオン性及びアニオン性乳化剤(例えばポリエチレン脂肪アルコールエーテル、アルキルスルホナート及びアリールスルホナート)である。

分散剤の例は、リグニン-亜硫酸パルプ廃液及びメチルセルロースである。

適切な海面活性剤としては、リグノスルホン酸、ナフタレンスルホン酸、フェノールスルホン酸、ジブチルナフタレンスルホン酸、アルキルアリールスルホナート、アルキルスルファート、アルキルスルホナート、脂肪アルコールスルファート、脂肪酸及び硫酸化脂肪アルコールエーテルのアルカリ金属、アルカリ土類金属及びアンモニウム塩、さらにスルホン化ナフタレン及びナフタレン誘導体とホルムアルデヒドの濃縮物、ナフタレン又はナフタレンスルホン酸とフェノール及びホルムアルデヒドの濃縮物、ポリオキシエチレン オクチルフェニルエーテル、エトキシル化イソオクチルフェノール、オクチルフェノール、 ノニルフェノール、アルキルフェニルポリグリコールエーテル、トリフチルフェニルポリグリコールエーテル、トリステアリルフェニルポリグリコールエーテル、アルキルアリールポリエーテルアルコール、アルコールと脂肪アルコール／エチレンオキシド濃縮物、エトキシル化ヒマシ油、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、エトキシ化ポリオキシプロピレン、ラウリルアルコールポリグリコールエーテルアセタール、及びソルビトールエステルが挙げられる。

【００５３】

不凍剤、例えばグリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコール及び殺菌剤なども製剤に添加することができる。

適切な消泡剤は、例えばケイ素又はステアリン酸マグネシウムに基づいた消泡剤である。

適切な保存剤としては、例えば、ジクロロフェン及びベンジルアルコールヘミホルマールが挙げられる。

適切な増粘剤として、擬塑性流れ、すなわち静止状態では高粘性で、撹拌段階では低粘性の挙動を製剤に与える化合物が挙げられる。この文脈では、例えば、多糖類に基づいた市販の増粘剤、例えばXanthan Gum(登録商標)(Kelzan(登録商標)、Kelcoから)、Rhodopol(登録商標)23(Rhone Poulenc)又はVeegum(登録商標)(R.T. Vanderbiltから)、又は有機フィロケイ酸塩、例えばAttaclay(登録商標)(Engelhardtから)に言及し得る。本発明の分散系に適した消泡剤は、例えば、シリコーンエマルション(例えば、Silikon(登録商標)SRE、Wacker又はRhodorsil(登録商標)、Rhodiaから)、長鎖アルコール、脂肪酸、有機フッ素化合物及びその混合物である。殺生物剤を添加して、微生物による攻撃に対して本発明の組成物を安定化することができる。適切な殺生物剤は、例えば、イソチアゾロンに基づいた殺生物剤、例えばAvecia(又はArch)から登録商標Proxel(登録商標)又はThor ChemieからActicide(登録商標)RS及びRohm & HaasからKathon(登録商標)MKで市販されている化合物である。適切な不凍剤は、有機ポリオール類、例えばエチレングリコール、プロピレングリコール又はグリセロールである。これらは通常、活性化合物組成物の総質量に基づいて、10質量%以下の量で利用される。適切な場合、本発明の活性化合物組成物は、調製される製剤の総質量に基づいて、1～5質量%の緩衝液を含んで、活性化合物（複数可）の化学的性質に応じて使用する緩衝液のpH、量及びタイプを調節することができる。緩衝液の

例は、例えば、リン酸、ボロン酸、酢酸、プロピオン酸、クエン酸、フマル酸、酒石酸、シュウ酸及びコハク酸などの無機又は有機弱酸のアルカリ金属塩である。

【００５４】

直接散布可能な溶液、エマルション、ペースト又は油分散液の調製に適した物質として、中程度～高い沸点の鉱油画分、例えば灯油又は軽油、さらにコールタール油及び野菜又は動物起源の油、脂肪族、環式及び芳香族炭化水素、例えばトルエン、キシレン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレン又はそれらの誘導体、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、シクロヘキサノール、シクロヘキサノン、イソホロン、極性の高い溶媒、例えばジメチルスヅホキシド、N-メチルピロリドン及び水が挙げられる。

活性物質を固形担体と混合するか又は同時に粉砕することによって、散剤、拡散用材料及び細粉を調製することができる。

固形担体に活性成分を結合させることにようって、顆粒、例えばコーティング顆粒、含浸顆粒及び均質顆粒を調製することができる。固形担体の例は、鉱物土、例えばシリカゲル、シリカート、タルク、カオリン、アタクレー、石灰石、石灰、チョーク、赤土、黄土、粘土、ドロマイト、珪藻土、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウム、粉砕合成材料、肥料、例えば、硫酸アンモニウム、リン酸アンモニウム、硝酸アンモニウム、尿素及び野菜起源の製品、例えばシリアルミール、樹皮ミール、ウッドミール及び堅果の殻ミール、セルロール粉末及び他の固形担体である。

一般に、製剤は0.01～95質量%、好ましくは0.1～90質量%の活性成分を含む。活性成分は、90%～100%、好ましくは95%～100%の純度(NMRスペクトルにより)で利用される。

種子処理目的では、それぞれの製剤を2～10倍に希釈して、質量で0.01～60質量%、好ましくは0.1～40質量%の活性化合物という使用準備済み調合液の濃度をもたらし得る。

式Iの化合物をそのまま、又はそれらの製剤の形態又はそれらから調製される使用形態で、例えば直接散布可能な溶液、粉末、懸濁液又は分散液、エマルション、油分散系、ペースト、粉製品(dustable product)、拡散用材料、又は顆粒の形態で、散布(spraying)、噴霧(atomizing)、散粉(dusting)、拡散(spreading)又は注入(pouring)によって使用することができる。使用形態は、全体的には意図した目的によって決まるが、いずれの場合も本発明の活性化合物の可能な最も微細な分布を確保することを目的とする。

【００５５】

以下に製剤の非限定例を示す。

1. 水で希釈する製品。種子処理目的では、該製品は、希釈して種子に適用してもよく、希釈せずに適用してもよい。

A)水溶性濃縮物(Water-soluble concentrates)(SL、LS)

10質量部の活性化合物を90質量部の水又は水溶性溶媒に溶解させる。代替法として、湿潤剤又は他の補助剤を添加する。本活性化合物は水で希釈すると溶解し、これによって10%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

B)分散性濃縮物(Dispersible concentrates)(DC)

20質量部の活性化合物を70質量部のシクロヘキサノンに10質量部の分散剤、例えばポリビニルピロリドンを加えて溶解させる。水で希釈すると分散液が得られ、これによって20%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

C)乳化性濃縮物(Emulsifiable concentrates)(EC)

15質量部の活性化合物を7質量部のキシレンにドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシラート(各場合5質量部)を加えて溶解させる。水で希釈するとエマルションが得られ、これによって15%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。

D)エマルション(Emulsions)(EW、EO、ES)

25質量部の活性化合物を35質量部のキシレンにドデシルベンゼンスルホン酸カルシウムとヒマシ油エトキシラート(各場合5質量部)を加えて溶解させる。この混合物を、乳化機(例えばUltraturrax)を用いて30質量部の水中に導入し、均質エマルションにする。水で希釈するとエマルションが得られ、これによって25%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られ

る。
E)懸濁液(Suspensions)(SC、OD、FS)
　撹拌ボールミル内で、20質量部の活性化合物に10質量部の分散剤、湿潤剤及び70質量部の水又は有機溶媒を加えて粉砕して微細な活性化合物懸濁液を得る。水で希釈すると活性化合物の安定した懸濁液が得られ、これによって20%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。
F)水分散性顆粒及び水溶性顆粒(Water-dispersible granules and water-soluble granules)(WG、SG)
　50質量部の活性化合物に50質量部の分散剤及び湿潤剤を加えて微細に粉砕し、専用装置(例えば押出装置、噴霧塔、流動床)を用いて水分散性又は水溶性顆粒にする。水で希釈すると活性化合物の安定した分散液又は溶液が得られ、これによって50%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。
G)水分散性散剤及び水溶性散剤(Water-dispersible powders and water-soluble powders)(WP、SP、SS、WS)
　75質量部の活性化合物をローター・ステーターミル(rotor-stator mill)内で25質量部の分散剤、湿潤剤及びシリカゲルを加えて粉砕する。水で希釈すると活性化合物の安定した分散液又は溶液が得られ、これによって75%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。
H)ゲル製剤(Gel-Formulation)(GF)
　撹拌ボールミル内で、20質量部の活性化合物に10質量部の分散剤、1質量部のゲル化剤、湿潤剤及び70質量部の水又は有機溶媒を加えて微細な活性化合物懸濁液を得る。水で希釈すると活性化合物の安定した懸濁液が得られ、これによって20%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。
【００５６】
　2.　葉適用のための希釈せずに適用する製品。種子処理目的では、該製品を希釈して種子に適用しても希釈せずに適用してもよい。
I)粉散剤(Dustable powders)(DP、DS)
　5質量部の活性化合物を微細に粉砕し、95質量部の微粉化カオリンと密に混合する。これが5%(w/w)の活性化合物を有する粉散剤を与える。
J)顆粒(Granules)(GR、FG、GG、MG)
　0.5質量部の活性化合物を微細に粉砕し、95.5質量部の担体と結びつけ、これによって0.5%(w/w)の活性化合物を含む製剤が得られる。現在の方法は、押出、噴霧乾燥又は流動床法である。これが葉用途のため希釈せずに適用する顆粒を与える。
K)ULV溶液(UL)
　10質量部の活性化合物を90質量部の有機溶媒、例えばキシレンに溶解させる。これが10%(w/w)の活性化合物を有し、葉用途のため希釈せずに適用される製品を与える。
　エマルション濃縮物、ペースト又は湿潤性散剤(散布可能散剤、油分散系)から、水を添加することによって水性使用形態を調製することができる。エマルション、ペースト又は油分散系を調製するためには、物質をそのまま又は油若しくは溶媒に溶かした物質を、湿潤剤、粘着付与剤(tackifier)、分散剤又は乳化剤を利用して水中で均質化することができる。或いは、活性物質、湿潤剤、粘着付与剤、分散剤又は乳化剤と、適切な場合は溶媒又は油とで構成された濃縮物を調製することができ、該濃縮物は、水で希釈するのに適している。
　すぐに使える製品中の活性成分濃度は、かなり広い範囲で異なり得る。一般に、当該濃度は0.0001～10%、好ましくは0.01～1%である。
　活性成分を超微量プロセス(ultra-low-volume process)(ULV)でうまく使用することもでき、95質量%超えの活性化合物を含む製剤を適用することができ、或いは添加剤を含まない活性成分を適用することさえも可能である。
【００５７】
（混合物）
　この発明の方法では、式Iの化合物を他の活性成分、例えば他の殺虫剤，殺昆虫剤、除

草剤、肥料（例えば硝酸アンモニウム、尿素、カリ、及び過リン酸塩）、植物毒性剤及び植物成長調節剤、毒性緩和剤及び殺線虫剤と共に適用してよい。これらの追加成分は、上記組成物と遂次的に又は組み合わせて使用し得るが、適切な場合には、使用直前にのみ添加してもよい（タンク混合）。例えば、他の活性成分で処理する前又は後に、この発明の組成物を植物に散布してよい。

【００５８】

本発明の化合物と共に使用することができ、かつ相乗効果を生じる可能性のある殺虫剤の下記リストMは、可能な組合せを例示することを意図するが、如何なる限定をも強いるものではない。

M.1. 有機(チオ)リン酸化合物：アセフェート、アザメチホス、アジンホス-エチル、アジンホス-メチル、クロルエトキシホス、クロルフェンビンホス、クロルメホス、クロルピリホス、クロルピリホス-メチル、クマホス、シアノホス、デメトン-S-メチル、ジアイノン、ジクロルボス/DDVP、ジクロトホス、ジメトエート、ジメチルビンホス、ジスルホトン、EPN、エチオン、エトプロホス、ファムフール(famphur)、フェナミホス、フェニトロチオン、フェンチオン、フルピラゾホス、ホスチアゼート、ヘプテノホス、イソキサチオン、マラチオン、メカルバム、メテミドホス、メチダチオン、メビンホス、モノクロトホス、ナレッド、オメトエート、オキシデメトン-メチル、パラチオン、パラチオン-メチル、フェントエート、ホレート、ホサロン、ホスメット、ホスファミドン、ホキシム、ピリミホス-メチル、プロフェノホス、プロペタモホス、プロチオホス、ピラクロホス、ピリデフェンチオン、キナルホス、スルホテプ、テブピリミホス、テメホス、テルブホス、テトラクロルビンホス、チオメトン、トリアゾホス、トリクロルホン、バミドチオン；

M.2. カルバミン酸化合物：アルジカルブ、アラニカルブ、ベンジオカルブ、ベンフラカルブ、ブトカルボキシム、ブトキシカルボキシム、カルバリル、カルボフラン、カルボスルファン、チオフェンカルブ、フェノブカルブ、ホルメタナート、フラチオカルブ、イソプロカルブ、メチオカルブ、メトミル、メトールカルブ、オキサミル、ピリミカルブ、プロポキスル、チオジカルブ、チオファノキス、トリメタカルブ、XMC、キシリルカルブ、トリアザメート；

M.3. ピレスロイド化合物：アクリナトリン、アレトリン、d-cis-transアレトリン、d-transアレトリン、ビフェトリン、ビオアレトリン、ビオアレトリン S-シルクロペンテニル、ビオレスメトリン、シクロプロトリン、シフルトリン、β-シフルトリン、シハロトリン、λ-シハロトリン、γ-シハロトリン、シペルメトリン、α-シペルメトリン、β-シペルメトリン、θ-シペルメトリン、ζ-シペルメトリン、シフェノトリン、デルタメトリン、エンペントリン、エスフェンバレレート、エトフェンプロックス、フェンプロパトリン、フェンバレレート、フルシトリネート、フルメトリン、τ-フルバリネート、ハルフェンプロキス、イミプロトリン、メトフルトリン、ペルメトリン、フェノトリン、プラレトリン、プロフルトリン、ピレトリン(ピレトルム)、レスメトリン、シラフルオフェン、テフルトリン、テトラメトリン、トラロメトリン、トランスフルトリン；

M.4. 幼若ホルモン模倣薬：ヒドロプレン、キノプレン、メトプレン、フェノキシカルブ、ピリプロキシフェン；

M.5. ニコチン受容体アゴニスト／アンタゴニスト化合物：アセタミプリド、ベンスルタップ、カルタップ塩酸塩、クロチアニジン、ジノテフラン、イミダクロプリド、チアメトキサム、ニテンピラム、ニコチン、スピノサド(アロステリックアゴニスト)、スピネトラム(アロステリックアゴニスト)、チアクロプリド、チオシクラム、チオスルタップ-ナトリウム及びAKD1022。

M.6. GABA作動性(GABA gated)塩素イオンチャネルアンタゴニスト化合物：クロルデン、エンドスルファン、γ-HCH(リンデン)、エチプロール、フィプロニル、ピラフルプロール、ピリプロール；

M.7. 塩素イオンチャネル活性化薬：アバメクチン、エマメクチン ベンゾアート、ミルベメクチン、レピメクチン；

M.8. METI I化合物：フェナザキン、フェンピロキシメート、ピリミジフェン、ピリダ

ベン、テブフェンピラド、トルフェンピラド、フルフェネリム、ロテノン；
M.9. METI II及びIII化合物：アセキノシル、フルアシプリム、ヒドラメチルノン；
M.10. 酸化的リン酸化の脱共役剤：クロルフェナピル、DNOC；
M.11. 酸化的リン酸化の抑制薬：アゾシクロチン、シヘキサチン、ジアフェンチウロン、酸化フェンブタスズ、プロパルギット、テトラジホン；
M.12. 脱皮撹乱物質：シロマジン、クロマフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、テブフェノジド；
M.13. 共力剤：ピペロニルブトキシド、トリブホス；
M.14. ナトリウムチャネル遮断化合物：インドキサカルブ、メタフルミゾン；
M.15. 燻蒸剤；臭化メチル、クロロピクリンスルフリルフルオリド；
M.16. 選択的摂食遮断薬：クリロチエ(crylotie)、;ピメトロジン、フロニカミド；
M.17. ダニ成長抑制薬：クロフェンテジン、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール；
M.18. キチン合成抑制薬：ブプロフェジン、ビストリフルロン、クロルフルアズロン、ジフルベンズロン、フルシクロクスロン、フルフェノクスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、ノバルロン、ノビフルムロン、テフルベンズロン、トリフルムロン；
M.19. 脂質生合成抑制薬：スピロジクロフェン、スピロメシフェン、スピロテトラマト；
M.20. オクトパミン作動性(Octapaminergic)アゴニスト：アミトラズ；
M.21. リアノジン受容体修飾薬：フルベンジアミド及びフタラミド(phtalamid)化合物
(R)-,(S)-3-クロル-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオル-1-(トリフルオルメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタラミド(M21.1)
M.22. イソキサゾリン化合物：4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-ピリジン-2-イルメチル-ベンズアミド(M22.1)、
4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(2,2,2-トリフルオロ-エチル)-ベンズアミド(M22.2)、
4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-ベンズアミド(M22.3)、
4-[5-(3,5-ジクロロ-フェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-ナフタレン-1-カルボン酸[(2,2,2-トリフルオロ-エチルカルバモイル)-メチル]-アミド(M22.4)及び
4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロ-イソキサゾール-3-イル]-N-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルベンズアミド(M22.5)；
M.23. アントラニルアミド化合物：クロラントラニリプロール、シアントラニリプロール、
5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[4-シアノ-2-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-6-メチル-フェニル]-アミド(M23.1)、
5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-クロロ-4-シアノ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.2)、
5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-ブロモ-4-シアノ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.3)、
5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2-ブロモ-4-クロロ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.4)、
5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[2,4-ジクロロ-6-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-フェニル]-アミド(M23.5)、
5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボン酸[4-クロロ-2-(1-シクロプロピル-エチルカルバモイル)-6-メチル-フェニル]-アミド(M23.6)、
N'-(2-{[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.7)、

N'-(2-{[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-N'-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.8)、
N'-(2-{[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-5-クロロ-3-メチル-ベンゾイル)-N,N'-ジメチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.9)、
N'-(3,5-ジブロモ-2-{[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.10)、
N'-(3,5-ジブロモ-2-{[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-N'-メチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.11)及び
N'-(3,5-ジブロモ-2-{[5-ブロモ-2-(3-クロロ-ピリジン-2-イル)-2H-ピラゾール-3-カルボニル]-アミノ}-ベンゾイル)-N,N'-ジメチル-ヒドラジンカルボン酸メチルエステル(M23.12)；

M.24. マロノニトリル化合物：2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,3-トリフルオロ-プロピル)マロノニトリル (CF_2H-CF_2-CF_2-CH_2-$C(CN)_2$-CH_2-CH_2-CF_3)(M24.1)及び2-(2,2,3,3,4,4,5,5-オクタフルオロペンチル)-2-(3,3,4,4,4-ペンタフルオロブチル)-マロノジニトリル(CF_2H-CF_2-CF_2-CH_2-$C(CN)_2$-CH_2-CH_2-CF_2-CF_3)(M24.2)；

M.25. 微生物撹乱物質：バチルス・チューリンゲンシス(Bacillus thuringiensis)亜種イスラエレンシス(Israelensi)、バチルス・スファエリクス(Bacillus sphaericus)、バチルス・チューリンゲンシス亜種、アイザワイ(Aizawai)、バチルス・チューリンゲンシス亜種クルスタキ(Kurstaki)、バチルス・チューリンゲンシス亜種テネブリオニス(Tenebrionis)；

M.26. アミノフラノン化合物：
4-{[(6-ブロモピリド-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.1)、
4-{[(6-フルオロピリド-3-イル)メチル](2,2-ジフルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.2)、
4-{[(2-クロロ1,3-チアゾロ-5-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.3)、
4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.4)、
4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](2,2-ジフルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.5)、
4-{[(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル)メチル](メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.6)、
4-{[(5,6-ジクロロピリド-3-イル)メチル](2-フルオロエチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.7)、
4-{[(6-クロロ-5-フルオロピリド-3-イル)メチル](シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.8)、
4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](シクロプロピル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.9)及び
4-{[(6-クロロピリド-3-イル)メチル](メチル)アミノ}フラン-2(5H)-オン(M26.10)；

M.27. 種々の化合物：リン化アルミニウム、アミドフルメト、ベンクロチアズ、ベンゾキシメート、ビフェナゼート、ホウ砂、ブロモプロピレート、シアン化物、シエノピラフェン、シフルメトフェン、キノメチオネート、ジコホル、フルオロ酢酸塩、ホスフィン、ピリダリル、ピリフルキナゾン、イオウ、有機イオウ化合物、吐酒石、スルホクサフロール(sulfoxaflor)、N-R'-2,2-ジハロ-1-R''シクロ-プロパンカルボキサミド-2-(2,6-ジクロロ-α,α,α-トリフルオロ-p-トリル)ヒドラゾン又はN-R'-2,2-ジ(R''')プロピオンアミド-2-(2,6-ジクロロ-α,α,α-トリフルオロ-p-トリル)-ヒドラゾン（R'はメチル又

はエチルであり、ハロはクロロ又はブロモであり、R''は水素又はメチルであり、R'''はメチル又はエチルである）、4-ブタ-2-イニルオキシ-6-(3,5-ジメチル-ピペリジン-1-イル)-2-フルオロ-ピリミジン(M27.1)、
シクロプロパン酢酸、1,1'-[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-4-[[(2-シクロプロピルアセチル)オキシ]メチル]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-デカヒドロ-12-ヒドロキシ-4,6a,12b-トリメチル-11-オキソ-9-(3-ピリジニル)-2H,11H-ナフト[2,1-b]ピラノ[3,4-e]ピラン-3,6-ジイル]エステル(M27.2)及び
8-(2-シクロプロピルメトキシ-4-トリフルオロメチル-フェノキシ)-3-(6-トリフルオロメチル-ピリダジン-3-イル)-3-アザ-ビシクロ[3.2.1]オクタン(M27.3)。

【００５９】

群Mの市販化合物は、The Pesticide Manual, 13th Edition, British Crop Protection Council (2003)、その他の出版物で見つけられる。

レピメクチン(Lepimectin)はAgro Project, PJB Publications Ltd, November 2004から知られている。ベンクロチアズ(Benclothiaz)及びその製法は、EP-A1 454621に記載されている。メチダチオン(Methidathion)及びパラオキソン(Paraoxon)並びにそれらの製法は、Farm Chemicals Handbook, Volume 88, Meister Publishing Company, 2001に記載されている。メテフルミゾン(Metaflumizone)及びその製法は、EP-A1 462456に記載されている。フルピラゾホス(Flupyrazofos)は、Pesticide Science 54, 1988, p.237-243及びUS 4822779に記載されている。ピラフルプロール(Pyrafluprole)及びその製法は、JP 2002 193709及びWO 01/00614に記載されている。ピリプロール(Pyriprole)及びその製法は、WO 98/45274及びUS 6335357に記載されている。アミドフルメト(Amidoflumet)及びその製法は、US 6221890及び JP 21010907に記載されている。フルフェネリム(Flufenerim)及びその製法は、WO 03/007717及びWO 03/007718に記載されている。AKD 1022及びその製法は、US 6300348に記載されている。クロルアントラニリポール(Chloranthraniliprole)は、WO 01/70671、WO 03/015519及びWO 05/118552に記載されている。シアントラニリポール(Cyantraniliprole)は、WO 01/70671、WO 04/067528及びWO 05/118552に記載されている。アントラニルアミドM23.1～M23.6は、WO 2008/72743及びWO 200872783に記載され、当該M23.7～M23.12はWO2007/043677に記載されている。フタラミドM21.1は、WO 2007/101540から知られている。シフルメトフェン(Cyflumetofen)及びその製法は、WO 04/080180に記載されている。アミノキナゾリン化合物ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)は、EPA 109 7932に記載されている。スルホキシミンスルホキサフロール(sulfoxaflor)は、WO 2006/060029及びWO 2007/149134に記載されている。アルキニルエーテル化合物M27.1は、例えばJP 2006131529に記載されている。有機イオウ化合物は、WO 2007060839に記載されている。イソキサゾリン化合物M22.1～M22.5は、例えばWO2005/085216、WO 2007/079162及びWO 2007/026965に記載されている。アミノフラノン化合物M26.1～M26.10は、例えばWO 2007/115644に記載されている。ピリピロン誘導体M27.2は、WO 2008/66153及びWO 2008/108491に記載されている。ピリダジン化合物M27.3は、JP 2008/115155に記載されている。(M24.1)及び(M24.2)のようなマロノニトリル化合物は、WO 02/089579、WO 02/090320、WO 02/090321、WO 04/006677、WO 05/068423、WO 05/068432及びWO 05/063694に記載されている。

【００６０】

殺真菌用混合相手は、アシルアラニン、例えばベナラキシル、メタラキシル、オフラセ(ofurace)、オキサジキシル、
アミン誘導体、例えばアルジモルフ、ドジン、ドデモルフ、フェンプロピモルフ、フェンプロピジン、グアザチン、イミノクタジン、スピロキサミン、トリデモルフ、
アニリノピリミジン、例えばピリメタニル、メパニピリム又はシロジニル、
抗生物質、例えばシクロヘキシミド、グリセオフルビン、カスガマイシン、ナタマイシン、ポリオキシン又はストレプトマイシン、
アゾール類、例えばビテルタノール、ブロモコナゾール、シプロコナゾール、ジフェノコナゾール、ジニコナゾール、エポキシコナゾール、フェンブコナゾール、フルキコナゾール、フルシラゾール、ヘキサコナゾール、イマザリル、メトコナゾール、ミクロブタニル

、ペンコナゾール、プロピコナゾール、プロクロラズ、プロチオコナゾール、テブコナゾール、トリアジメホン、トリアジメノール、トリフルミゾール、トリチコナゾール、フルトリアホール、
ジカルボキサミド、例えばイプロジオン、ミクロゾリン、プロシミドン、ビンクロゾリン、
ジチオカルバマート、例えばフェルバム、ナバム、マネブ、マンコゼブ、メタム、メチラム、プロピネブ、ポリカルバマート、チラム、ジラム、ジネブ、
ヘテロ環式化合物、例えばアニラジン、ベノミル、ボスカリド、カルベンダジム、カルボキシン、オキシカルボキシン、シアゾファミド、ダゾメト、ジチアノン、ファモキサドン、フェンアミドン、フェナリモール、フベリダゾール、フルトラニル、フラメトピル、イソプロチオラン、メプロニル、ヌアリモール、プロベナゾール、プロキンアジド、ピリフェノキス、ピロキロン、キノキシフェン、シルチオファム、チアベンダゾール、チフルザアミド、チオファナート-メチル、チアジニル、トリシクラゾール、トリホリン、
銅殺真菌剤、例えばボルドー液(Bordeaux mixture)、酢酸銅、オキシ塩化銅、塩基性硫酸銅、
ニトロフェニル誘導体、例えばビナプアクリル、ジノカプ、ジノブトン、ニトロフタルイソプロピル、
フェニルピロール類、例えばフェンピクロニル又はフルジオキソニル、
イオウ、
他の殺真菌剤、例えばアシベンゾラル-S-メチル、ベンチアバリカルブ、カルプロプアミド、クロロタロニル、シフルフェンアミド、シモキサニル、ジクロメジン、ジクロシメト、ジエトフェンカルブ、エジフェンホース、エタボキサム、フェンヘキサアミド、フェンチン-アセタート、フェノキサニル、フェリムゾン、フルアジナム、ホセチル、ホセチル-アルミニウム、イプロバリカルブ、ヘキサクロロベンゼン、メトラフェノン、ペンシクロン、プロパモカルブ、フタリド、トロクロホース-メチル、キントゼン、ゾキサミド、
ストロビルリン類、例えばaゾキシストロビン、ジモキシストロビン、フルオキサストロビン、クレソキシム-メチル、メトミノストロビン、オリサストロビン、ピコキシストロビン又はトリフロキシストロビン、
スルフェン酸誘導体、例えばカプタホール、キャプタン、ジクロフルアニド、ホルペト、トリルフルアニド、
シンナムアミド及び類似体、例えばジメトモルフ、フルメトベル又はフルモルフ
から成る群より選択される当該相手である。

【００６１】

（適用）

式Iの化合物の優れた活性のため、動物害虫を防除するために式Iの化合物を使用することができる。従って、本発明は、動物害虫の防除方法であって、害虫、害虫が成長しているか若しくは成長し得るそれらの餌供給源、それらの生息地若しくは繁殖地又は栽培植物、植物繁殖材料(例えば種子)、土壌、区域、材料若しくは環境、又は害虫による攻撃若しくは侵襲から保護すべき材料、栽培植物、植物繁殖材料(例えば種子)、土壌、表面若しくは空間を、殺虫有効量(pesticidally effective amount)の前記定義通りの式Iの化合物若しくはその塩又は組成物で処理する工程を含む方法をも提供する。

好ましくは、本発明の方法は、植物繁殖材料(例えば種子)及びそれから生育する植物を動物害虫の攻撃又は侵襲から保護するのに役立ち、かつ植物繁殖材料(例えば種子)を、殺虫有効量の式Iの化合物若しくは前記定義通りの農業上許容できるその塩又は殺虫有効量の農業用組成物で処理する工程を含む。本発明の方法は、本発明に従って処理された「基質」(植物、植物繁殖材料、土壌材料など)の保護のみならず、例えば、処理された植物繁殖材料(例えば種子)から生育する植物の保護により、処理されなかった植物自体に対する保護効果をも有する。

【００６２】

本発明の意味では、「動物害虫」は、好ましくは節足動物及び線虫、さらに好ましくは

有害な昆虫、クモ類及び線虫、なおさらに好ましくは昆虫、コナダニ類及び線虫から選択される。

本発明は、該量の式Iの少なくとも1種の化合物又は農業上有用な少なくとも1種のその塩と、殺虫作用を有する少なくとも1種の不活性な液体及び／又は固体の農業上許容できる担体と、所望により、少なくとも1種の界面活性剤とを含む、該動物害虫を駆除するための農業用組成物をさらに提供する。

該組成物は、本発明の式Iの単一の活性化合物若しくはその塩又は式Iの数種の活性化合物若しくはそれらの塩の混合物を含有し得る。本発明の組成物は、個々の異性体又は異性体の混合物のみならず、個々の互変異性体又は互変異性体の混合物を含んでよい。

技術上周知のいずれの適用方法によっても、動物害虫、すなわち昆虫、クモ類及び線虫、植物、植物がその中で生育している土壌又は水を、式Iの本化合物又は本化合物を含む組成物と接触させることができる。「接触させる」という表現は、直接接触(化合物／組成物を動物害虫又は植物－典型的には植物の葉、幹又は根に直接適用すること)及び間接接触(化合物／組成物を動物害虫又は植物の生息場所(locus)に適用すること)の両方を包含する。

植物／作物を、殺虫有効量の式Iの化合物と接触させることによって、式Iの化合物又はそれらを含む殺虫性組成物を用いて、動物害虫、特に昆虫、コナダニ又はクモ類による攻撃又は侵襲から、生育している植物及び作物を保護することができる。用語「作物」は、生育している作物と収穫された作物の両方を指す。

【００６３】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、穀類、根菜類、油料作物、野菜、香辛料、鑑賞植物などの種々の栽培植物、例えばデュラムその他のコムギ、オオムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシ及び糖トウモロコシ／スイートコーン及びフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、カブ(turnip rape)、テンサイ、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、牧草、芝生(lawn)、芝地(turf)、飼料草、トマト、ニラ、パンプキン／カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種、メロン、マメ、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物（例えばジャガイモ）、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム／ペラルゴニウム、パンジー及びインパチェンスの種子上の多数の昆虫の防除で特に重要である。

本発明の化合物をそのまま又は組成物の形で、昆虫又は昆虫の攻撃から保護すべき植物、植物繁殖材料(例えば種子)、土壌、表面、材料又は場所を、殺昆虫有効量の活性化合物で処理することによって利用する。適用は、植物、植物繁殖材料(例えば種子)、土壌、表面、材料又は場所の昆虫による感染の前と後の両方で行ってよい。

本発明は、動物害虫、動物害虫が成長しているか又は成長し得るそれらの生息地、繁殖地、餌供給源、栽培植物、種子、土壌、区域、材料若しくは環境、又は動物の攻撃若しくは侵襲から保護すべき材料、植物、種子、土壌、表面若しくは空間を、殺虫有効量の、式Iの少なくとも1種の活性化合物の混合物と接触させる工程を含む、動物害虫を駆除する方法をも包含する。

さらに、標的害虫、その餌供給源、生息地、繁殖地又はその生息場所を、殺虫有効量の式Iの化合物と接触させることによって、動物害虫を防除することができる。適用自体は、生息場所、生育作物、又は収穫作物の害虫による感染の前又は後に行ってよい。

害虫の発生が予測される場所に予防的に本発明の化合物を適用することもできる。

【００６４】

式Iの化合物を用いて、植物を、殺虫有効量の式Iの化合物と接触させることによって、害虫による攻撃又は侵襲から生育植物を保護することもできる。「接触させる」という表現は、直接接触(化合物／組成物を害虫及び／又は植物－典型的には植物の葉、幹又は根に直接適用すること)及び間接接触(化合物／組成物を害虫及び／又は植物の生息場所(locus)に適用すること)の両方を包含する。

「生息場所(locus)」は、害虫又は寄生虫が成長しているか又は成長し得る生育地、繁

殖地、植物、種子、土壌、区域、材料又は環境を意味する。

用語「植物繁殖材料」は、植物の増殖に利用できる種子などの植物の生殖部及び挿し木や塊茎(例えばジャガイモ)等の栄養植物材料を全て表すものと解釈すべきである。これには、種子、根、果実、塊茎、鱗茎、根茎、新芽、芽及び植物の他の部分が含まれる。発芽後又は土壌からの出芽後に移植される予定の実生及び幼植物も包含される。植え付け若しくは移植のとき又はその前にこれらの植物繁殖材料を植物保護化合物で予防的に処理してもよい。

【００６５】

用語「栽培植物」は、育種、突然変異誘発又は遺伝子操作によって修飾された植物を包含するものと解釈すべきである。遺伝子修飾植物は、組換えDNA技術を用いて、天然環境下では交雑育種、突然変異又は自然組換えによって容易には得られないように遺伝子材料が修飾されている植物である。典型的に、植物の特定の性質を改良するため、遺伝子修飾植物の遺伝子材料に1以上の遺伝子を組み込んでいる。このような遺伝子修飾には、限定するものではないが、例えばグリコシル化或いはポリマー付加、例えばプレニル化、アセチル化若しくはファルネシル化部分又はPEG部分によって標的とされた、タンパク質(オリゴペプチド又はポリペプチド)の翻訳後修飾も含まれる(例えばBiotechnol Prog. 2001 Jul-Aug;17(4):720-8., Protein Eng Des Sel. 2004 Jan;17(1):57-66, Nat Protoc. 2007;2(5):1225-35., Curr Opin Chem Biol. 2006 Oct;10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28., Biomaterials. 2001 Mar;22(5):405-17, Bioconjug Chem. 2005 Jan-Feb;16(1):113-21に開示されているように)。

用語「栽培植物」は、通常の育種又は遺伝子操作方法の結果として、特定分類の除草剤、例えばヒドロキシ-フェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ(HPPD)抑制剤；アセト乳酸シンターゼ(ALS)抑制剤、例えばスルホニル尿素(例えばUS 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073参照)又はイミダゾリノン(例えばUS 6,222,100、WO 01/82685、WO 00/26390、WO 97/41218、WO 98/02526、WO 98/02527、WO 04/106529、WO 05/20673、WO 03/14357、WO 03/13225、WO 03/14356、WO 04/16073参照)；エノールピルビルシキミ酸-3-リン酸合成酵(EPSPS)抑制剤、例えばグリフォセート(例えばWO 92/00377参照)；グルタミンシンターゼ(GS)抑制剤、例えばグルホシネート(例えばEP-A-0242236、EP-A-242246参照)又はオキシニル除草剤(例えばUS 5,559,024参照)の適用に対して耐性にされた植物をも含むものと解釈すべきである。数種の栽培植物は、通常の育種(突然変異誘発)方法によって除草剤に対して耐性にされている。例えばClearfield(登録商標)夏ナタネ(summer rape)(Canola)は、イミダゾリノン、例えばイマザモックスに耐性である。遺伝子操作方法を利用して、ダイズ、ワタ、コーン、テンサイ及びナタネ等の栽培植物をグリフォセート及びグルホシネート等の除草剤に対して耐性にしており、そのいくつかは、商標名RoundupReady(登録商標)(グリフォセート)及びLibertyLink(登録商標)(グルホシネート)で市販されている。

【００６６】

用語「栽培植物」は、組換えDNA技術の使用により、1種以上の殺虫性タンパク質を合成できる植物をも包含するものと解釈すべきである。このようなタンパク質は、特に細菌属バチルス、特にバチルス・チューリンゲンシスから知られる当該タンパク質、例えばa-エンドトキシン、例えばCryIA(b)、CryIA(c)、CryIF、CryIF(a2)、CryIIA(b)、CryIIIA、CryIIIB(b1)又はCry9c；栄養生長期殺虫性タンパク質(vegetative insecticidal protein)(VIP)、例えばVIP1、VIP2、VIP3又はVIP3A；細菌コロニー形成線虫(bacteria colonizing nematode)、例えばフォトラブダス種(Photorhabdus spp.)又はゼノラブダス種(Xenorhabdus spp.)の殺虫性タンパク質；動物によって産生される毒素、例えばサソリ毒、クモ毒、スズメバチ毒、又は他の昆虫特異性神経毒；真菌よって産生される毒素、例えばストレプトマイセス(Streptomycetes)毒、植物レシチン、例えばエンドウマメ又はオオムギのレシチン；アグルチニン；プロテイナーゼ抑制物質、例えばトリプシン抑制物質、セリンプロテアーゼ抑制物質、パタチン、シスタチン又はパパイン抑制物質；リボソーム不活性化タ

ンパク質(RIP)、例えばリシン、トウモロコシ-RIP、アブリン、ルフィン(luffin)、サポリン又はブリオジン(bryodin)；ステロイド代謝酵素、例えば3-ヒドロキシステロイドオキシダーゼ、エクジステロイド-IDP-グリコシル-トランスフェラーゼ、コレステロールオキシダーゼ、エクジソン抑制物質又はHMG-CoA-レダクターゼ；イオンチャネルブロッカー、例えばナトリウム又はカルシウムチャネルのブロッカー；幼若ホルモンエステラーゼ；利尿ホルモン受容体(ヘリコキニン受容体)；スチルベンシンターゼ、ビベンジルシンターゼ、キチナーゼ又はグルカナーゼである。本発明の文脈では、これらの殺虫性タンパク質又は毒素をプレトキシン(pre-toxins)、ハイブリッドタンパク質、切断型その他の修飾タンパク質としても明示的に解釈すべきである。ハイブリッドタンパク質は、タンパク質ドメインの新しい組合せを特徴とする(例えば、WO 02/015701参照)。このような毒素又は該毒素を合成できる遺伝子修飾植物のさらなる例は、例えば、EP-A 374 753、WO 93/007278、WO 95/34656、EP-A 427 529、EP-A 451 878、WO 03/018810及びWO 03/052073に開示されている。このような遺伝子修飾植物の生産方法は、当業者に一般的に知られており、例えば上記出版物に記載されている。遺伝子修飾植物に含まれるこれらの殺虫性タンパク質は、これらのタンパク質を産生する植物に、特定の分類学群の節足動物、特にカブトムシ(鞘翅目(Coleoptera))、ハエ(双翅目(Diptera))、及びチョウ及びガ(鱗翅目(Lepidoptera))並びに植物寄生線虫(線虫門(Nematoda))由来の害虫からの保護を与える。

【００６７】

用語「栽培植物」は、組換えDNA技術の使用により、当該植物の細菌、ウイルス又は真菌病原に対する抵抗性又は耐性を高めるための1種以上のタンパク質を合成できる植物をも包含するものと解釈すべきである。該タンパク質の例は、いわゆる「病原性関連タンパク質(pathogenesis-related protein)」(PRタンパク質、例えばEP-A 0392225参照)、植物病害抵抗性遺伝子(plant disease resistance gene)(例えばメキシコの野生ジャガイモソラヌム・バルボカスタヌム(Solanum bulbocastanum)由来のフィトフトラ・インフェスタンス(Phytophthora infestans)に対して作用する抵抗性遺伝子を発現しているジャガイモ品種)又はT4-リゾチーム(例えばエルウィニア・アミロボーラ(Erwinia amylvora)等の細菌に対する抵抗性が増加したこれらのタンパク質を合成できるジャガイモ品種)である。このような遺伝子修飾植物の生産方法は、当業者に一般的に知られており、例えば上記出版物に記載されている。

用語「栽培植物」は、組換えDNA技術の使用により、生産性(例えばバイオマス生産量、穀粒収量、デンプン含量、油含量又はタンパク質含量)、乾燥耐性、塩分その他の生育制限環境因子又は当該植物の害虫及び真菌、細菌若しくはウイルス病原に対する抵抗性を高めるための1種以上のタンパク質を合成できる植物をも包含するものと解釈すべきである。

用語「栽培植物」は、組換えDNA技術の使用により、特にヒト又は動物の栄養を改善するため、含有物の量を改変するか又は新たな含有物を含む植物、例えば、健康を促進する長鎖ω-3脂肪酸又は不飽和ω-9脂肪酸を産生する油料作物(例えばNexera(登録商標)ナタネ)をも包含するものと解釈すべきである。

用語「栽培植物」は、組換えDNA技術の使用により、特に原材料生産を改善するため、含有物の量を改変するか又は新たな含有物を含む植物、例えば、増加量のアミロペクチンを産生するジャガイモ(例えばAmflora(登録商標)ジャガイモ)をも包含するものと解釈すべきである。

【００６８】

一般に、「殺虫有効量(pesticidally effective amount)」とは、標的生物の成長に観察可能な効果（壊死、死、遅延、阻止、及び除去、破壊、又はそれ以外に標的生物の発生及び活性を減じる効果を含め）を及ぼすために必要な活性成分の量を意味する。殺虫有効量は、本発明で使用する種々の化合物／組成物によって異なり得る。組成物の殺虫有効量は、所望の殺虫効果及び持続時間、気候、標的種、生息場所、適用様式などの一般的な条件によっても変わるであろう。

土壌処理又は害虫の居住場所若しくは巣への適用の場合、活性成分の量は0.0001～500g

/100m^2、好ましくは0.001～20g/100m^{2}の範囲である。
材料の保護に通例の適用率は、例えば、処理材料1m^{2}当たり0.01g～1000gの活性化合物、望ましくは0.1g～50g/m^{2}である。
材料の含浸用の殺虫剤組成物は、典型的に0.001～95質量%、好ましくは0.1～45質量%、さらに好ましくは1～25質量%の少なくとも1種の忌避物質及び／又は殺虫剤を含む。
作物の処理に使う場合、この発明の活性成分の適用率は、1ヘクタール(ha)当たり0.1g～4000g、望ましくは25g～600g/ha、さらに望ましくは50g～500g/haの範囲であってよい。
式Iの化合物は、接触(土壌、草、壁、蚊帳(bed net)、カーペット、植物部位又は動物部位を介して)、及び摂取(餌、又は植物部位)の両方を通じて効果がある。
本発明の化合物を、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギ、又はゴキブリ等の非作物性害虫に対して適用してもよい。前記非作物性害虫に対して使用する場合、餌組成物で式Iの化合物を使用するのが好ましい。
餌は、液体、固体又は半固体調製品(例えばゲル)であり得る。それぞれの適用に適した種々の形状及び形態、例えば顆粒、ブロック、スティック、ディスク等に固体餌を形成することができる。液体餌を種々のデバイス、例えば開放容器、散布装置、液滴供給源、又は蒸発供給源に満たして正確な適用を確保することができる。ゲルは水性又は油性マトリックスを基礎としてよく、粘着性、保湿又は経時特性の面から特定の必要性に合わせて処方することができる。
組成物で利用する餌は、それを食べるアリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、蚊、コオロギ又はゴキブリ等の昆虫を刺激するのに十分魅力的な製品である。摂食刺激物質又は性フェロモンを使用することによって誘引性を操作することができる。食物刺激物は、例えば、排他的ではないが、動物及び／又は植物のタンパク質(肉タンパク質、魚タンパク質又は血粉、昆虫部位、卵黄)、動物及び／又は植物起源の油脂、或いは単糖、オリゴ糖、多糖、特にラクトース、フルクトース、ブドウ糖、グルコース、デンプン、ペクチンから又はモラセス若しくはハチミツからさえ選択される。果実、作物、植物、動物、昆虫の新鮮又は腐敗部位或いはそれらの特定部位も摂食刺激物として役立つことがある。性フェロモンはさらに昆虫特異性であることが知られている。特異性フェロモンは文献に記載されており、当業者には周知である。
餌組成物で使う場合、活性成分の典型的含量は0.001質量%～15質量%、望ましくは0.001質量%～5質量%の活性化合物である。

【００６９】

素人ユーザーがハエ、ノミ、マダニ、蚊又はゴキブリ等の害虫を防除するためには、エアロゾル(例えばスプレー缶中)、オイルスプレー又はポンプスプレーとしての式Iの化合物の製剤が非常に適している。エアロゾル処方は、好ましくは活性化合物、溶媒、例えば低級アルコール(例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール)、ケトン(例えばアセトン、メチルエチルケトン)、約50～250℃の沸点範囲を有するパラフィン炭化水素(例えば灯油)、ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、芳香族炭化水素（例えばトルエン、キシレン）、水、さらなる補助剤、例えば乳化剤（ソルビトールモノオレアート、3～7モルのエチレンオキシドを有するオレイルエトキシラート、脂肪アルコールエトキシラート等）、香油（エーテル油、中鎖脂肪酸と低級アルコールのエステル、芳香族カルボニル化合物など）、適切な場合、安定剤（安息香酸ナトリウム、両性界面活性剤、低級エポキシド、オルトギ酸トリエチル等）、及び必要な場合、噴霧剤（プロパン、ブタン、窒素、圧縮空気、ジメチルエーテル、二酸化炭素、亜酸化窒素、又はこれらのガスの混合物など）を含む。
オイルスプレー製剤は、噴霧剤を使用しないという点でエアロゾル処方と異なる。
スプレー組成物用の場合、活性成分の含量は、0.001～80質量%、好ましくは0.01～50質量%、最も好ましくは0.01～15質量%である。
式Iの化合物及びそれらのそれぞれの組成物は、蚊及び燻蒸コイル、スモークカートリッジ、気化プレート又は長期気化器に使用でき、ガペーパー、ガパッド又は他の熱に依存

しない気化システムでも使用することができる。

【００７０】

昆虫によって伝播される感染病(例えばマラリア、デング熱及び黄熱病、リンパ管フィラリア、及びリーシュマニア症)を式Iの化合物及びそのそれぞれの組成物で防除する方法は、小屋及び家の表面の処理並びにカーテン、テント、衣類、蚊帳、ツェツェバエトラップ(tseyse-fly trap)等のエアスプレー及び含浸をも含む。繊維、布、ニット製品、不織布、網材又は箔及び防水シートに適用するための殺虫剤組成物は好ましくは、殺虫剤、必要に応じて忌避物質及び少なくとも1種の結合剤を包含する混合物を含む。適切な忌避物質は、例えばN,N-ジエチル-メタ-トルアミド(DEET)、N,N-ジエチルフェニルアセトアミド(DEPA)、1-(3-シクロヘキサン-1-イル-カルボニル)-2-メチルピペリジン、(2-ヒドロキシメチルシクロヘキシル)酢酸ラクトン、2-エチル-1,3-ヘキサンジオール、インダロン、メチルネオデカンアミド(MNDA)、昆虫防除には使われないピレスロイド（例えば{(+/-)-3-アリル-2-メチル-4-オキソシクロペンタ-2-(+)-エニル-(+)-trans-クリセンテマート(chrysantemate)(Esbiothrin)）、リモネン、オイゲノール、(+)-ユーカマロール(Eucamalol)(1)、(-)-1-エピ-ユーカマロール等の植物エキス由来若しくは同等の忌避物質又はユーカリプツス・マクラタ(Eucalyptus maculata)、ハマゴウ(ヴィテックス・ロツンディフォリア(Vitex rotundifolia))、パルマローザ(シンボポゴン・マルチニイ(Cymbopogan martinii))、シンボポゴン・シトラツス(Cymbopogan citratus)(レモングラス)、シンボポゴン・ナルドゥス(Cymopogan nartdus)(シトロネラ)等の植物由来の粗製植物エキスである。適切な結合剤は、例えば脂肪酸のビニルエステル(例えば酢酸ビニルとビニルベルサート(vinyl versatate))、アルコールのアクリル酸及びメタクリル酸エステル（例えばアクリル酸ブチル、アクリル酸2-エチルヘキシル、及びアクリル酸メチル）、モノエチレン性及びジエチレン性不飽和炭化水素（例えばスチレン）、及び脂肪族ジエン（例えばブタジエン）のポリマー及びコポリマーから選択される。

カーテン及び蚊帳の含浸は、織物材料を殺虫剤のエマルション又は分散液に浸漬させるか又は網上にエマルション又は分散液を散布することによって行われる。

式Iの化合物及びそれらの組成物を木、板塀、枕木などの木製材料、及び家、納屋、工場などの建築物のみならず、構成材料、家具、皮、繊維、ビニール製品、電線及びケーブル等をアリ及び／又はシロアリから保護するため、並びにアリ及びシロアリが作物又は人間に害を及ぼす(例えば害虫が家又は公共施設に侵入する場合)のを制御するために使用することができる。木製材料を保護するため、式Iの化合物を周囲の土壌表面又は床下土壌中に適用するのみならず、床下コンクリート、床柱、梁、ベニヤ板、家具などの製材品(lumbered article)、パーティクル・ボード(particle board)、ハーフ・ボード等の木製品、及び被覆電線、ビニールシート、絶縁材料、例えばスチレンフォーム等のビニール製品の表面に適用することもできる。作物又は人間に害を及ぼすアリに対して適用する場合、本発明のアリ防除剤を作物又は周囲の土壌に適用するか、或いはアリ等の巣に直接適用する。

【００７１】

（種子処理）

式Iの化合物は、害虫から、特に土壌中に生息する害虫から種子を保護するため及び得られる植物の根及び新芽を土壌害虫及び葉昆虫に対して保護するための種子処理にも適している。

式Iの化合物は、土壌害虫からの種子の保護並びに得られる植物の根及び新芽の土壌害虫及び葉昆虫に対しての保護に特に有用である。得られる植物の根及び新芽の保護が好ましい。得られる植物の根及び新芽を刺す昆虫及び吸汁性昆虫から保護するのがさらに好ましく、アブラムシからの保護が最も好ましい。

従って、本発明は、実生の根及び新芽の、昆虫、特に土壌昆虫及び葉昆虫からの保護方法を含み、前記方法は、播種前及び／又は発芽前処理(pregermination)後に種子を一般式Iの化合物又はその塩と接触させる工程を含む。植物の根及び新芽を保護する方法が好ましく、植物の新芽を刺す昆虫及び吸汁性昆虫から保護する方法がさらに好ましく、植物の

新芽をアブラムシから保護する方法が最も好ましい。

種子という用語は、全ての種類の種子及び植物栄養繁殖体(propagule)を包含し、限定するものであないが、真の種子、種子断片、吸枝(sucker)、球茎、鱗茎、果実、塊茎、穀粒(grain)、挿し木(cutting)、刈り桑(cut shoot)等が挙げられ、好ましい実施形態では真の種子を意味する。

種子処理という用語は、当技術分野で周知の全ての適切な種子処理法、例えば種子粉衣法(seed dressing)、種子コーティング法(seed coating)、種子散粉法(seed dusting)、種子浸漬法(seed soaking)及び種子ペレット化法(seed pelleting)を含む。

本発明は活性化合物でコーティングされたか又は活性化合物を含有する種子をも含む。

「～でコーティングされた、及び／又は～を含有する」という表現は、一般に適用時に活性成分が繁殖物(propagation product)の表面上にその大部分があることを意味するが、適用方法によっては、多かれ少なかれ活性成分の一部が繁殖物に入り込んでいてもよい。前記繁殖物が(再び)植えられると、活性成分を吸収し得る。

【００７２】

適切な種子は、穀類、根菜類、油料作物、野菜、香辛料、観賞植物の種子、例えば、デュラムコムギその他のコムギ、オオムギ、オートムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシ及び糖トウモロコシ／スイートコーン及びフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、カブ(turnip rape)、テンサイ、飼料ビート、ナス、ジャガイモ、牧草、芝生、芝地、飼料草、トマト、ニラ、パンプキン／カボチャ、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ種、メロン、マメ、エンドウ、ニンニク、タマネギ、ニンジン、塊茎植物（例えばジャガイモ）、サトウキビ、タバコ、ブドウ、ペチュニア、ゼラニウム／ペラルゴニウム、パンジー及びインパチェンスの種子である。

さらに、遺伝子操作法を含め、育種のおかげで除草剤又は殺真菌剤又は殺虫剤の作用に耐える植物由来の種子の処理に本活性化合物を使用することももできる。

例えば、スルホニル尿素、イミダゾリノン、グルホシネート-アンモニウム又はグリホセート-イソプロピルアンモニウム及び類似活性物質から成る群より選択される除草剤に耐性の植物由来の種子の処理において(例えば、EP-A-0242236、EP-A-242246)(WO 92/00377)(EP-A-0257993、米国特許第5,013,659号参照)、或いは植物を特定害虫に対して耐性にするバチルス・チューリンゲンシス(Bacillus thuringiensis)毒(Bt毒)を産生する能力を有するトランスジェニック作物、例えばワタにおいて(EP-A-0142924、EP-A-0193259)本活性化合物を利用することができる。

さらに、例えば、従来の育種法及び／又は突然変異体の生成、或いは組換え手順によって生成され得る現存する植物と比較して特徴が変化している植物由来の種子の処理に本活性化合物を使用することもできる。例えば、植物中で合成されるデンプンの修飾を目的とした作物の組換え修飾のいくつかの事例(例えばWO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806)又は脂肪酸組成が修飾されているトランスジェニック作物の事例(WO 91/13972)が記載されている。

【００７３】

本活性化合物の種子処理適用は、植物の播種前及び植物の出芽前に、種子に噴霧又は散粉することによって行なわれる。

種子処理に特に有用な組成物は、例えば以下の通りである。

A　可溶性濃縮物(SL、LS)
D　エマルション(EW、EO、ES)
E　懸濁液(SC、OD、FS)
F　水分散性顆粒及び水溶性顆粒(WG、SG)
G　水分散性粉末及び水溶性粉末(WP、SP、WS)
H　ゲル製剤(GF)
I　散粉末(Dustable powder)(DP、DS)

通常の種子処理製剤としては、例えば、流動性濃縮物(flowable concentrate)(FS)、溶

液(LS)、乾燥処理用粉末(DS)、スラリー処理用水分散性粉末(WS)、水溶性粉末(SS)及びエマルション(ES及びEC)並びにゲル製剤(GF)が挙げられる。これらの製剤は、希釈して或いは希釈せずに種子に適用することができる。種子への適用は、播種前に種子に直接、又は種子を発芽前処理した後に行われる。

【００７４】

好ましい実施形態では、FS製剤を種子処理に使用する。典型的に、FS製剤は、1～800g/lの活性成分、1～200g/lの界面活性剤、0～200g/lの不凍剤、0～400g/lの結合剤、0～200g/lの顔料及び1リットルまでの溶媒、好ましくは水を含み得る。

種子処理用の式Iの化合物の特に好ましいFS製剤は、通常0.1～80質量%(1～800g/l)の活性成分、0.1～20質量%(1～200g/l)の少なくとも1種の界面活性剤、0.05～5質量%の湿潤剤及び0.5～15質量%の分散剤、20質量%まで、例えば5～20%の不凍剤、0～15質量%、例えば1～15質量%の顔料及び／又は色素、0～40質量%、例えば1～40質量%の結合剤(粘着／接着剤)、必要に応じて5質量%まで、例えば0.1～5質量%の増粘剤、必要に応じて0.1～2%の消泡剤、並びに必要に応じて殺生物剤、酸化防止剤などの保存剤（例えば0.01～1質量%の量で）及び充填剤／ビヒクルを100質量%まで含む。

種子処理製剤は、さらに結合剤及び必要に応じて着色料を含んでもよい。

結合剤を添加して、処理後の種子上の活性材料の接着を改善することができる。適切な結合剤は、エチレンオキシド又はプロピレンオキシドのようなアルキレンオキシド由来のホモポリマー及びコポリマー、ポリビニルアセタート、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、及びこれらのコポリマー、エチレン-酢酸ビニルコポリマー、アクリル酸ホモポリマー及びコポリマー、ポリエチレンアミン、ポリエチレンアミド及びポリエチレンイミン、多糖類、例えばセルロース、チロース(tylose)及びデンプン、ポリオレフィンホモポリマー及びコポリマー、例えばオレフィン／無水マレイン酸コポリマー、ポリウレタン、ポリエステル、ポリスチレンホモポリマー及びコポリマーである。

必要に応じて、製剤に着色料を含めることもできる。種子処理製剤に適した着色料は、ローダミンB、C.I.ピグメントレッド112、C.I.ソルベントレッド1、ピグメントブルー15:4、ピグメントブルー15:3、ピグメントブルー15:2、ピグメントブルー15:1、ピグメントブルー80、ピグメントイエロー1、ピグメントイエロー13、ピグメントレッド112、ピグメントレッド48:2、ピグメントレッド48:1、ピグメントレッド57:1、ピグメントレッド53:1、ピグメントオレンジ43、ピグメントオレンジ34、ピグメントオレンジ5、ピグメントグリーン36、ピグメントグリーン7、ピグメントホワイト6、ピグメントブラウン25、ベーシックバイオレット10、ベーシックバイオレット49、アシッドレッド51、アシッドレッド52、アシッドレッド14、アシッドブルー9、アシッドイエロー23、ベーシックレッド10、ベーシックレッド108である。

ゲル化剤の例は、カラギーナン(Satiagel(登録商標))である。

種子の処理では、化合物Iの適用率は、一般的に種子100kg当たり0.1g～10kg、好ましくは種子100kg当たり1g～5kg、さらに好ましくは種子100kg当たり1g～1000g、特に種子100kg当たり1g～200gである。

従って、本発明は、前記定義通りの式Iの化合物、又はその農業上有用な塩を含む種子にも関する。化合物I又はその農業上有用な塩の量は、一般に種子100kg当たり0.1g～10kg、好ましくは種子100kg当たり1g～5kg、特に種子100kg当たり1g～1000gであろう。レタス等の特殊な作物では率がより高くてよい。

【００７５】

（動物の健康適用）

式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩は、特に動物内及び動物上の寄生虫を駆除するためにも有効である。

従って、本発明の目的は、動物内及び動物上の寄生虫の新規な防除方法を提供することでもある。本発明の別の目的は、動物にとってより安全な殺虫剤を提供することである。本発明の別の目的は、さらに、現存の殺虫剤より低用量で使用し得る、動物に対する効力が改善された殺虫剤を提供することである。また、本発明の別の目的は、寄生虫の長い残

留防除をもたらす、獣医学的殺虫剤を提供することである。

本発明は、殺寄生虫有効量の式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩と、許容できる担体とを含有する、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するための組成物にも関する。

本発明は、寄生虫による侵襲及び感染に対して動物を処置、防除、予防及び保護する方法であって、殺寄生虫有効量の、式Iの1種以上の化合物、又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩、又は該化合物を含む組成物を動物に経口、局所若しくは非経口投与又は適用する工程を含む方法をも提供する。

本発明は、寄生虫による侵襲及び感染に対して動物を処置、防除、予防及び保護する非治療方法であって、殺寄生虫有効量の、式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩又は該化合物を含む組成物を生息場所に適用する工程を含む方法をも提供する。

別の実施形態では、本発明は、殺寄生虫有効量の、式Iの1種以上の化合物、又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩を、1種以上の他の活性薬及び許容できる担体と併用して含む、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するための組成物を提供する。寄生虫による侵襲及び感染に対して動物を処置、防除、予防及び保護する方法であって、有効量の式Iの化合物を他の活性薬と併用して投与する工程を含む方法をも提供する。

本発明は、寄生虫による侵襲及び感染に対して動物を処置、防除、予防及び保護するための組成物の調製方法をも提供する。殺寄生虫有効量の式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩を、該化合物を含む組成物に含める工程を含む方法をも提供する。

本発明は、さらに、寄生虫による侵襲及び感染に対して動物を処置、防除、予防及び保護するための式Iの化合物の使用に関する。

本発明は、寄生虫による侵襲及び感染に対する動物の治療処置用薬物の製造のための式Iの化合物、又はをれを含む組成物の使用にも関する。

【００７６】

農業害虫に対する化合物の活性は、例えば、経口適用の場合には低く、嘔吐を催さない投与量が必要であり、また動物との代謝適合性、低毒性、及び安全な取扱いを必要とする動物内及び動物上の内部寄生虫及び外部寄生虫の防除に対する化合物の適性を示唆していない。さらに、動物内及び動物上の寄生虫を駆除するために用いた場合、本発明の化合物の吸着、分布、代謝及び排除は農業適用における本化合物の有効性に基づいて予測できないことは当業者には明らかであろう。

驚くべきことに、今や式Iの化合物が動物内及び動物上の内部寄生虫及び外部寄生虫を駆除するために有効であることが分かった。

式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩及びそれらを含む組成物は、好ましくは温血動物(ヒトを含む)、鳥類及び魚類を含めた動物における侵襲及び感染を防除及び予防するために使用される。それらは例えば哺乳動物、例えば、ウシ、ヒツジ、ブタ等のイノシシ属の動物(swine)、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ(pig)、家禽類、ウサギ、ヤギ、イヌ及びネコ、水牛、ロバ、ダマジカ及びトナカイ、並びにミンク、チンチラ及びアライグマ等の毛皮動物、雌鶏、ガチョウ、七面鳥及びアヒル等の鳥類、マス、コイ及びウナギ等の淡水魚及び塩水魚等の魚類における侵襲及び感染を防除及び予防するのに適している。

式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩及びそれらを含む組成物は、好ましくは温血動物(ヒトを除く)、鳥類及び魚類を含めた動物における侵襲及び感染を防除及び予防するために使用される。それらは、例えばヒト以外の哺乳動物における侵襲及び感染を防除及び予防するのに適している。

式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩及びそれらを含む組成物は、好ましくはイヌ又はネコ等の飼育動物(domestic animal)における侵襲及び感染を防除及び予防するために利用される。

温血動物及び魚類における侵襲には、限定するものではないが、シラミ、ハジラミ、ダ

ニ、ハナウマバエ(nasal bots)、ヒツジシラミバエ、刺咬性ハエ(biting flies)、キンバエ、ハエ、ミアシティックハエ幼虫(myiasitic fly larvae)、ツツガムシ、ブヨ、蚊及びノミが挙げられる。

式Iの化合物又はそのエナンチオマー若しくは獣医学的に許容できる塩及びそれらを含む組成物は、外部寄生虫及び／又は内部寄生虫の全身性防除及び／又は非全身性防除に適している。それらは、発育の全て又は一部の段階に対して活性である。

【００７７】

式Iの化合物は、外部寄生虫を駆除するのに特に有用である。外部寄生虫に対する処置のための種々の実施形態では、外部寄生虫は1種以上の昆虫又はクモ類であり、以下の属、イヌノミ属(Ctenocephalides)、コイタマダニ属(Rhipicephalus)、カクマダニ属(Dermacentor)、マダニ属(Ixodes)、オウシマダニ属(Boophilus)、キララマダニ属(Ambylomma)、チマダニ(Haemaphysalis)、イボマダニ属(Hyalomma)、サルコプテス属(Sarcoptes)、キュウセンヒゼンダニ属(Psoroptes)、ミミヒゼンダニ属(Otodectes)、ショクヒヒゼンダニ属(Chorioptes)、ヒポデルマ(Hypoderma)、ダマリニア属(Damalinia)、ケモノホソジラミ属(Linognathus)、ブタジラミ属(Haematopinus)、ソレノポテス属(Solenoptes)、ケモノハジラミ属(Trichodectes)及びフェリコラ属(Felicola)のものが含まれる。処置される外部寄生虫としては、限定するものではないが、ノミ、マダニ、コダニ、蚊、ハエ、シラミ、ホホアカクロバエ及びその組合せが挙げられる。

式Iの化合物は、内部寄生虫を駆除するために特に有用である。式Iの化合物が活性な内部寄生虫には、例えば裸頭条虫属(Anaplocephala)、鉤虫属(Ancylostoma)、アメリカ鉤虫属(Anecator)、回虫属(Ascaris)、毛細線虫属(Capillaria)、クーペリア属(Cooperia)、ディピリジウム属(Dipylidium)、イヌ糸状虫属(Dirofilaria)、エキノコックス属(Echinococcus)、エンテロビウス属(Enterobius)、ファシオラ属(Fasciola)、ヘモンクス属(Haemonchus)、腸結節虫属(Oesophagostumum)、オステルタギア属(Ostertagia)、トキソカラ属(Toxocara)、ストロンギロイデス属(Strongyloides)、トキサスカリス属(Toxascaris)、トリキネラ属(Trichinella)、トリチュリス属(Trichuris)及びトリコストロンギルス属(Trichostrongylus)等の当該蠕虫類が含まれる。

【００７８】

式Iの化合物は、それぞれ以下の目及び種の寄生虫を駆除するのに特に有用である。

イソポダ(Isopoda)目のもの、オニスカス・アセラス(Oniscus asellus)、アルマジリジウム・ブルガーレ(Armadillidium vulgare)及びポルセリオ・スカベル(Porcellio scaber)；

チロポダ(Chilopoda)目のもの、例えば、ゲオフィラス・カルポファガス(Geophilus carpophagus)及びスクティゲラ種(Scutigera spp.)；

シンフィラ(Symphyla)目のもの、例えば、スクチゲレラ・イマクラータ(Scutigerella immaculata)；

コレムボラ(Collembola)目のもの、例えば、オニキウルス・アルマツス(Onychiurus armatus)；

ヒメノプテラ(Hymenoptera)目のもの、例えば、ジプリオン種(Diprion spp.)、ホプロカンパ種(Hoplocampa spp.)、ラシウス種(Lasius spp.)、モノモリウム・ファラオニス(Monomorium pharaonis)及びベスパ種(Vespa spp.)；

ビヴァルヴァ(Bivalva)綱のもの、例えば、ドレイセナ種(Dreissena spp.)；

鞘翅目(コレポテラ(Coleoptera)目)のもの、例えば、アカントスセリデス・オブテクツス(Acanthoscelides obtectus)、アドレツス種(Adoretus spp.)、アゲラスチカ・アルニ(Agelastica alni)、アグリオテス種(Agriotes spp.)、アンフィマロン・ソルスチチアリス(Amphimallon solstitialis)、アノビウム・パンクタツム(Anobium punctatum)、アノプロフォラ種(Anoplophora spp.)、アントノムス種(Anthonomus spp.)、アンスレヌス種(Anthrenus spp.)、アポゴニア種(Apogonia spp.)、アトマリア種(Atomaria spp.)、アタゲヌス種(Attagenus spp.)、ブルキジウス・オブレクツス(Bruchidius obtectus)、ブルクス種(Bruchus spp.)、セウトリンクス種(Ceuthorhynchus spp.)、クレオヌス・メンジ

クス(Cleonus mendicus)、コノデルス種(Conoderus spp.)、コスモポリテス種(Cosmopolites spp.)、コステリトラ・ゼアランジカ(Costelytra zealandica)、クルクリオ種(Curculio spp.)、クリプトリンクス・ラパチ(Cryptorhynchus lapathi)、デルメステス種(Dermestes spp.)、ジアブロチカ種(Diabrotica spp.)、エピラチナ種(Epilachna spp.)、ファウスチヌス・クバエ(Faustinus cubae)、ギビウム・プシロイデス(Gibbium psylloides)、ヘテロニクス・アラトル(Heteronychus arator)、ヒラモルファ・エレガンス(Hylamorpha elegans)、ヒロトルペス・バジュルス(Hylotrupes bajulus)、ヒペラ・ポスチカ(Hypera postica)、ヒポテネムス種(Hypothenemus spp.)、ラクノステルナ・コンサンギネア(Lachnosterna consanguinea)、レプチノタルサ・デセムリネアータ(Leptinotarsa decemlineata)、リソルホプトルス・オリゾフィルス(Lissorhoptrus oryzophilus)、リクス種(Lixus spp.)、リクツス種(Lyctus spp.)、メリゲテス・アエネウス(Meligethes aeneus)、メロロンタ・メロロンタ(Melolontha melolontha)、ミグドルス種(Migdolus spp.)、モンカムス種(Monochamus spp.)、ナウパクツス・キサントグラフス(Naupactus xanthographus)、ニプツス・ホロレウクス(Niptus hololeucus)、オリクテス・リノセロス(Oryctes rhinoceros)、オリザエフィルス・スリナメンシス(Oryzaephilus surinamensis)、オチオリンクス・スルカツス(Otiorrhynchus sulcatus)、オキシセトニア・ジュクンダ(Oxycetonia jucunda)、ファエドン・コクレアリエ(Phaedon cochleariae)、フィロファガ種(Phyllophaga spp.)、ポピリア・ジャポニカ(Popillia japonica)、プレムノトリペス種(Premnotrypes spp.)、プシリオデス・クリソセファラ(Psylliodes chrysocephala)、プチヌス種(Ptinus spp.)、リゾビウス・ベントラリス(Rhizobius ventralis)、リゾペルタ・ドミニカ(Rhizopertha dominica)、シトフィルス種(Sitophilus spp.)、スフェノフォルス種(Sphenophorus spp.)、ステルネクス種(Sternechus spp.)、シンフィレテス種(Symphyletes spp.)、テネブリオ・モリトル(Tenebrio molitor)、トリボリウム種(Tribolium spp.)、トロゴデルマ(Trogoderma spp.)、チキウス種(Tychius spp.)、キシロトレクス種(Xylotrechus spp.)、ザブルス種(Zabrus spp.)；

ノミ(シフォナプテラ(Siphonaptera))、例えば、ネコノミ(クテノセファリデス・フェリス(Ctenocephalides felisイヌノミ(クテノセファリデス・カニス(Ctenocephalides canis))、キセノプシラ・ケオピス(Xenopsylla cheopis)及びセラトフィラス(Ceratophyllus)、ヒトノミ(プレックス・イリタンス(Pulex irritans))、スナノミ(ツンガ・ペネトランス(Tunga penetrans))、及びヨーロッパネズミノミ(ノソプシルルス・ファシアツス(Nosopsyllus fasciatus))；

ゴキブリ類(ゴキブリ目(Blattaria)-ブラットダエ(Blattodea))、例えばブラッテラ・ゲルマニカ(Blattella germanica)、ブラッテラ・アサヒネ(Blattella asahinae)、ペリプラネタ・アメリカナ(Periplaneta americana)、ペリプラネタ・ジャポニカ(Periplaneta japonica)、ペリプラネタ・ブルンネア(Periplaneta brunnea)、ペリプラネタ・フリギノサ(Periplaneta fuligginosa)、ペリプラネタ・アウストララシエ(Periplaneta australasiae)、及びブラッタ・オリエンタリス(Blatta orientalis)；

ハエ、蚊(双翅目(Diptera))、例えばアエデス種、例えばアエデス・アエギプチ(Aedes aegypti)、アエデス・アルボピクツス(Aedes albopictus)、アエデス・ベキサンス(Aedes vexans)、アナストレファ・ルデンス(Anastrepha ludens)、アノフェレス種、例えばアノフェレス・マクリペンニス(Anopheles maculipennis)、ビビオ・ホルツラヌス(Bibio hortulanus)、アノフェレス・クルシアンス(Anopheles crucians)、アノフェレス・アルビマヌス(Anopheles albimanus)、アノフェレス・ガンビエ(Anopheles gambiae)、アノフェレス・フレエボルニ(Anopheles freeborni)、アノフェレス・ロイコスフィルス(Anopheles leucosphyrus)、アノフェレス・ミニムス(Anopheles minimus)、アノフェレス・クアドリマクラツス(Anopheles quadrimaculatus)、カリホラ・エリスロセファラ(Calliphora erythrocephala)、カリホラ・ビシナ(Calliphora vicina)、クリソミア・ベッジアナ(Chrysomya bezziana)、クリソミア・ホミニボラキス(Chrysomya hominivorax)、クリソミア・マセラリア(Chrysomya macellaria)、クリソプス・ジスカリス(Chrysops discalis)、クリソプス・シラセア(Chrysops silacea)、クリソプス・アトランチクス(Chrysops atlant

icus)、コクリオミイア種、例えばコクリオミイア・ホミニボラキス(Cochliomyia hominivorax)、コルジルオビア・アントロポファガ(Cordylobia anthropophaga)、クリコイデス・フレンス(Culicoides furens)、クレックス種、クレックス・ピピエンス(Culex pipiens)、クレックス・ニグリパルプス(Culex nigripalpus)、クレックス・キンクファシアツス(Culex quinquefasciatus)、クレックス・タルサリス(Culex tarsalis)、クリセタ・イノルナタ(Culiseta inornata)、クリセタ・メラヌラ(Culiseta melanura)、デルマトビア・ホミニス(Dermatobia hominis)、ファンニア種、例えばファンニア・カニクラリス(Fannia canicularis)、ガステロフィルス・インテスチナリス(Gasterophilus intestinalis)、グロッシナ・モルシタンス(Glossina morsitans)、グロッシナ・パルパリス(Glossina palpalis)、グロッシナ・フスシペス(Glossina fuscipes)、グロッシナ・タキノイデス(Glossina tachinoides)、ハエマトビア・イリタンス(Haematobia irritans)、ハプロジプロシス・エクエストリス(Haplodiplosis equestris)、ヒッペラテス種(Hippelates spp.)、ヒポデルマ種、ヒポデルマ・リネアタ(Hypoderma lineata)、レプトコノプス・トレンス(Leptoconops torrens)、ルシリア・カプリナ(Lucilia caprina)、ルシリア種、ルシリア・クプリナ(Lucilia cuprina)、ルシリア・セリカタ(Lucilia sericata)、リコリア・ペクトラリス(Lycoria pectoralis)、マンソニア種、ムスカ種、例えばムスカ・ドメスチカ(Musca domestica)、ムシナ・スタブランス(Muscina stabulans)、オエストルス種、オエストルス・オビス(Oestrus ovis)、フレボトムス・アルゲンチペス(Phlebotomus argentipes)、プソロホラ・コルンビエ(Psorophora columbiae)、プソロホラ・ジスコロール(Psorophora discolor)、プロシムリウム・ミクスツム(Prosimulium mixtum)、サルコファガ・ヘモロイダリス(Sarcophaga haemorrhoidalis)、サルコファガ種(Sarcophaga spp.)、シムリウム・ビッタツム(Simulium vittatum)、ストモキス種、例えばストモキス・カルシトランス(Stomoxys calcitrans)、タバヌス種、例えばタバヌス・ボビヌス(Tabanus bovinus)、タバヌス・アトラツス(Tabanus atratus)、タバヌス・リネオラ(Tabanus lineola)、及びタバヌス・シミリス(Tabanus similis)、セラチチス・カピタタ(Ceratitis capitata)、クリソミア種(Chrysomyia spp.)、クテレブラ種(Cuterebra spp.)、ダクス・オレア(Dacus oleae)、ドロソフィラ種(Drosophila spp.)、ガストロフィルス種(Gastrophilus spp.)、ヒレミア種(Hylemyia spp.)、ヒポボスカ種(Hyppobosca spp.)、リリオミザ種(Liriomyza spp.)、ネザラ種(Nezara spp.)、オスシネラ・フリト(Oscinella frit)、ペゴミア・ヒオスシアミ(Pegomyia hyoscyami)、フォルビア種(Phorbia spp.)、タンニア種(Tannia spp.)、チプラ・パルドサ(Tipula paludosa)、ウォールファルチア種(Wohlfahrtia spp.)；

腹足綱(Gastropoda)のもの、例えば、アリオン種(Arion spp.)、ビオムファラリア種(Biomphalaria spp.)、ブリヌス種(Bulinus spp.)、デロセラス種(Deroceras spp.)、ガルバ種(Galba spp.)、リムナエア種(Lymnaea spp.)、オンコメラニア種(Oncomelania spp.)、スクシネア種(Succinea spp.)；

カメムシ亜目(Heteroptera)のもの、例えば、アナサ・トリスチス(Anasa tristis)、アンテスチオプシス種(Antestiopsis spp.)、ブリスス種(Blissus spp.)、カロコリス種(Calocoris spp.)、カンピロムマ・リビダ(Campylomma livida)、カベレリウス種(Cavelerius spp.)、シメックス種(Cimex spp.)、クレオンチアデス・ジルツス(Creontiades dilutus)、ダシヌス・ピペリス(Dasynus piperis)、ジケロプス・フルカツス(Dichelops furcatus)、ジコノコリス・ヘウェチ(Diconocoris hewetti)、ダイスデルクス種(Dysdercus spp.)、エウシスツス種(Euschistus spp.)、エウリガステル種(Eurygaster spp.)、ヘリオペルチス種(Heliopeltis spp.)、ホルシアス・ノビレルス(Horcias nobilellus)、レプトコリサ種(Leptocorisa spp.)、レプトグロスス・フィロプス(Leptoglossus phyllopus)、リグス種(Lygus spp.)、マクロペス・エクスカバツス(Macropes excavatus)、ミリダエ(Miridae)、ネザラ種(Nezara spp.)、オエバルス種(Oebalus spp.)、ペントミダエ(Pentomidae)、ピエスマ・クアドラタ(Piesma quadrata)、ピエゾドルス種(Piezodorus spp.)、プサルス・セリアツス(Psallus seriatus)、シュードダシスタ・ペルセア(Pseudacysta persea)、ロドニウス種(Rhodnius spp.)、サールベルゲラ・シングラリス(Sahlbergella singu

laris)、スコチノフォラ種(Scotinophora spp.)、ステファニチス・ナシ(Stephanitis nashi)、チブラカ種(Tibraca spp.)、トリアトマ種(triatoma spp.)；

シラミ類(シラミ目(Phthiraptera)、例えばダマリニア種(Damalinia spp.)、ヘマトピヌス種(Haematopinus spp.)、リノグナサス種(Linognathus spp.)、ペジクルス種(Pediculus spp.)、トリコデクテス種(Trichodectes spp.)、ペジクルス・ヒューマヌス・カピチス(Pediculus humanus capitis)、ペジクルス・ヒューマヌス・コルポリス(Pediculus humanus corporis)、プチルス・プビス(Pthirus pubis)、ヘマトピヌス・ユーリステルヌス(Haematopinus eurysternus)、ヘマトピヌス・スイス(Haematopinus suis)、リノグナツス・ビツリ(Linognathus vituli)、ボビコラ・ボビス(Bovicola bovis)、メノポン・ガリナエ(Menopon gallinae)、メナカンツス・ストラミネウス(Menacanthus stramineus)及びソレノポテス・カピラツス(Solenopotes capillatus)；

マダニ及び寄生ダニ(パラシチフォルメス(Parasitiformes))；マダニ類(マダニ科(Ixodida)、例えばイキソデス・スカプラリス(Ixodes scapularis)、イキソデス・ホロシクルス(Ixodes holocyclus)、イキソデス・パシフィクス(Ixodes pacificus)、リフィセファルス・サングイノイス(Rhiphicephalus sanguineus)、デルマセントル・アンデルソニ(Dermacentor andersoni)、デルマセントル・バリアビリス(Dermacentor variabilis)、アンブリオンマ・アメリカヌム(Amblyomma americanum)、アンブリオンマ・マクラツム(Ambryomma maculatum)、オルニトドルス・ヘルムシ(Ornithodorus hermsi)、オルニトドルス・ツリカタ(Ornithodorus turicata)及び寄生ダニ(中気門亜目(Mesostigmata))、例えばオルニトニッスス・バコチ(Ornithonyssus bacoti)及びデルマニッスス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)；

ケダニ亜目(アクチネジダ(Actinedida(プロスチグマタ(Prostigmata)))及びコナダニ亜目(アカリジダ(Acaridida(アスチグマタ(Astigmata)))、例えばアカラピス種(Acarapis spp.)、ケイレチエラ種(Cheyletiella spp.)、オルニトケイレチア種(Ornithocheyletia spp.)、ミオビア種(Myobia spp.)、プソレルガテス種(Psorergates spp.)、デモデクス種(Demodex spp.)、トロムビクラ種(Trombicula spp.)、リストロホルス種(Listrophorus spp.)、アカルス種(Acarus spp.)、チロファグス種(Tyrophagus spp.)、カログリフス種(Caloglyphus spp.)、ヒポデクテス種(Hypodectes spp.)、プテロリクス種(Pterolichus spp.)、プソロプテス種(Psoroptes spp.)、クオリオプテス種(Chorioptes spp.)、オトデクテス種(Otodectes spp.)、サルコプテス種(Sarcoptes spp.)、ノトエドレス種(Notoedres spp.)、クネミドコプテス種(Knemidocoptes spp.)、シトジテス種(Cytodites spp.)、及びラミノシオプテス種(Laminosioptes spp.)；

クモ綱(Arachnida)のもの、例えば、アカルス・シロ(Acarus siro)、アセリア・シェルドニ(Aceria sheldoni)、アクロプス種(Aculops spp.)、アクルス種(Aculus spp.)、アンブリオマ種(Amblyomma spp.)、アルガス種(Argas spp.)、ボフィルス種(Boophilus spp.)、ブレビパルプス種(Brevipalpus spp.)、ブリオビア・プレチオサ(Bryobia praetiosa)、コリオプテス種(Chorioptes spp.)、デルマニサス・ガリナエ(Dermanyssus gallinae)、エオテトラニクス種(Eotetranychus spp.)、エピトリメルス・ピリ(Epitrimerus pyri)、ユーテトラニクス種(Eutetranychus spp.)、エリオフィエス種(Eriophyes spp.)、ヘミタルソネムス種(Hemitarsonemus spp.)、ヒアロマ種(Hyalomma spp.)、イクソデス種(Ixodes spp.)、ラトロデクツス・マクタンス(Latrodectus mactans)、メタテトラニクス種(Metatetranychus spp.)、オリゴニクス種(Oligonychus spp.)、オルニソドロス種(Ornithodoros spp.)、パノニクス種(Panonychus spp.)、フィロコプトルタ・オレイボラ(Phyllocoptruta oleivora)、ポリファゴタルソネムス・ラツス(Polyphagotarsonemus latus)、プソロプテス種(Psoroptes spp.)、リピセファルス種(Rhipicephalus spp.)、リゾグリフス種(Rhizoglyphus spp.)、サルコプテス種(Sarcoptes spp.)、スコルピオ・マウルス(Scorpio maurus)、ステノタルソネムス種(Stenotarsonemus spp.)、タルソネムス種(Tarsonemus spp.)、テトラニクス種(Tetranychus spp.)、バサテス・リコペルシシ(Vasates lycopersici)；

虫(Bugs)(ヘテロプテラ(Heteropterida))：シメックス・レクツラリウス(Cimex lectul

arius)、シメックス・ヘミプテルス(Cimex hemipterus)、レデュビウス・セニリス(Reduvius senilis)、トリアトーマ種(Triatoma spp.)、ロドニウス種(Rhodnius ssp.)、パンストロギルス種(Panstrongylus ssp.)及びアリルス・クリタツス(Arilus critatus)；

ハジラミ目(マロファギダ(Mallophagida))(アンブリセリナ(Amblycerina)亜目及びイスクノセリナ(Ischnocerina)亜目)、例えば、トリメノポン種(Trimenopon spp.)、メノポン種(Menopon spp.)、トリノトン種(Trinoton spp.)、ボビコラ種(Bovicola spp.)、ウェルネツキエラ種(Werneckiella spp.)、レピケントロン種(Lepikentron spp.)、トリコデクテス種(Trichodectes spp.)、及びフェリコラ種(Felicola spp.)；

回虫類線虫綱(Roundworms Nematoda)：

ワイプワーム(Wipeworm)及び旋毛虫(Trichinosis)トリコシリンギダ(Trichosyringida))、例えばトリキネリダエ(Trichinellidae)(トリキネラ種(Trichinella spp.))、例えばトリキネラ・スピラリス(Trichinella spiralis)、トリキネラ・ナチバ(Trichinella nativa)、トリキネラ・ブリトビ(Trichinella britovi)、トリキネラ・ネルソニ(Trichinella nelsone)、トリキネラ・シュードプシラリス(Trichinella pseudopsiralis)、トリクリダエ(Trichuridae)トリクリス種(Trichuris spp.)、例えばトリクリス・トリクリア(Trichuris trichuria,)、カピライア種(Capillaria spp)；

桿線虫類(Rhabditida)、例えばラブディチス(Rhabditis spp,)、ストロンギロイデス(Strongyloides spp.)、ヘリセファロブス種(Helicephalobus spp)；

円虫類(Strongylida)、例えばストロンギルス種(Strongylus spp.)、アンシロストマ種(Ancylostoma spp.)、メクトル・アマリカヌス(Necator americanus)、ブノストムム種(Bunostomum spp.)(鉤虫)、トリコストロンギルス種(Trichostrongylus spp.)、ハエモンクス種(Haemonchus spp.)、例えばハエモンクス・コントルツス(Haemonchus contortus)、オステルタギア種(Ostertagia spp.)、クーペリア種(Cooperia spp.)、ネマトジルス種(Nematodirus spp.)、ディクチオカウルス種(Dictyocaulus spp.)、シアトストーマ種(Cyathostoma spp.)、エソファゴストム種(Oesophagostomum spp.)、ステファヌルス・デンタツス(Stephanurus dentatus)、オルラヌス種(Ollulanus spp.)、チャベルティア種(Chabertia spp.)、ステファヌルス・デンタツス(Stephanurus dentatus)、シンガムス・トラケア(Syngamus trachea)、アンシロストマ種(Ancylostoma spp.)、ウンシナリア種(Uncinaria spp.)、グロボセファルス種(Globocephalus spp.)、ネカトル種(Necator spp.)、メタストロンギルス種(Metastrongylus spp.)、ムエレリウス・カピラリス(Muellerius capillaris)、プロトストロンギルス種(Protostrongylus spp.)、アンギオストロンギルス種(Angiostrongylus spp.)、パレラフォストロンギルス種(Parelaphostrongylus spp.)、アレウロストロンギルス・アブストルスス(Aleurostrongylus abstrusus)、及びジオクトフィーマ・レナーレ(Dioctophyma renale)；

蠕虫(helminths)の綱のもの、例えば、アンシロストマ・デュオデナレ(Ancylostoma duodenale)、アンシロストマ・セイラニクム(Ancylostoma ceylanicum)、アシロストマ・ブラジリエンシス(Acylostoma braziliensis)、ジクチオカウルス・フィラリア(Dictyocaulus filaria)、ジフィロボスリウム・ラツム(Diphyllobothrium latum)、エキノコッカス・グラヌロスス(Echinococcus granulosus)、エキノコッカス・マルチロクラリス(Echinococcus multilocularis)、ヘテラキス種(Heterakis spp.)、ハイメノレピス・ナナ(Hymenolepis nana)、ハイオストロングルス種(Hyostrongulus spp.)、ロア・ロア(Loa Loa)、オピストルキス種(Opisthorchis spp.)、オンコセルカ・ボルブルス(Onchocerca volvulus)、シストソメン種(Schistosomen spp.)、ストロンギロイデス・フエレボルニ(Strongyloides fuelleborni)、ストロンギロイデス・ステルコラリス(Strongyloides stercoralis)、ストロンギロイデス種(Stronyloides spp.)、タエニア・サギナタ(Taenia saginata)、タエニア・ソリウム(Taenia solium)、トリコストロンギルス種(Trichostrongylus spp.)；

ホモプテラ(Homoptera)綱のもの、例えば、アシルトシポン種(Acyrthosipon spp.)、アエネオラミア種(Aeneolamia spp.)、アゴノセナ種(Agonoscena spp.)、アレウロデス種(Aleurodes spp.)、アレウロブス・バロデンシス(Aleurolobus barodensis)、アレウロスリ

キサス種(Aleurothrixus spp.)、アムラスカ種(Amrasca spp.)、アヌラフィス・カルデュイ(Anuraphis cardui)、アオニジエラ種(Aonidiella spp.)、アファノスチグマ・ピリ(Aphanostigma piri)、アフィス種(Aphis spp.)、アルボリジア・アピカリス(Arboridia apicalis)、アスピジエラ種(Aspidiella spp.)、アスピジオツス種(Aspidiotus spp.)、アタヌス種(Atanus spp.)、アウラコルスム・ソラニ(Aulacorthum solani)、ベミシア種(Bemisia spp.)、ブラキカウダス・ヘリクリシイ(Brachycaudus helichrysii)、ブラキコルス種(Brachycolus spp.)、ブレビコリン・ブラシカエ(Brevicoryne brassicae)、カリギポナ・マルギナタ(Calligypona marginata)、カルネオセファラ・フルギダ(Carneocephala fulgida)、セラトバクナ・ラニゲラ(Ceratovacuna lanigera)、セルコピダエ(Cercopidae)、セロプラステス種(Ceroplastes spp.)、カエトシフォン・フラガエフォリイ(Chaetosiphon fragaefolii)、キオナスピス・テガレンシス(Chionaspis tegalensis)、クロリタ・オヌキイ(Chlorita onukii)、クロマフィス・ジュグランジコラ(Chromaphis juglandicola)、クリソムファルス・フィクス(Chrysomphalus ficus)、シカデュリナ・ムビラ(Cicadulina mbila)、ココミチルス・ハリ(Coccomytilus halli)、コッカス種(Coccus spp.)、クリプトミズス・リビス(Cryptomyzus ribis)、ダルブルス種(Dalbulus spp.)、ジアレウロデス種(Dialeurodes spp.)、ジアフォリナ種(Diaphorina spp.)、ジアスピス種(Diaspis spp.)、ドラリス種(Doralis spp.)、ドロシカ種(Drosicha spp.)、ジサフィス種(Dysaphis spp.)、ジスミコッカス種(Dysmicoccus spp.)、エムポアスカ種(Empoasca spp.)、エリオサマ種(Eriosoma spp.)、エリスロネウラ種(Erythroneura spp.)、エウスセリス・ビロバツス(Euscelis bilobatus)、ゲオコッカス・コフェアエ(Geococcus coffeae)、ホマロジスカ・コアグラタ(Homalodisca coagulata)、ハイアロプテルス・アルンジニス(Hyalopterus arundinis)、イセリャ種(Icerya spp.)、イジオセルス種(Idiocerus spp.)、イジオスコプス種(Idioscopus spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス(Laodelphax striatellus)、レカニウム種(Lecanium spp.)、レピドサフェス種(Lepidosaphes spp.)、リパフィス・エリシミ(Lipaphis erysimi)、マクロシフム種(Macrosiphum spp.)、マハナルバ・フィムブリオラタ(Mahanarva fimbriolata)、メラナフィス・サッカリ(Melanaphis sacchari)、メトカルフィエラ種(Metcalfiella spp.)、メトポロフィウム・ジロデュム(Metopolophium dirhodum)、モネリア・コスタリス(Monellia costalis)、モネリオプシス・ペカニス(Monelliopsis pecanis)、ミズス種(Myzus spp.)、ナソノビア・リビスニグリ(Nasonovia ribisnigri)、ネフォテチックス種(Nephotettix spp.)、ニラパルバタ・ルゲンス(Nilaparvata lugens)、オンコメトピア種(Oncometopia spp.)、オルセジア・プラエロンガ(Orthezia praelonga)、パラベミシア・ミリカエ(Parabemisia myricae)、パラトリオザ種(Paratrioza spp.)、パルラトリア種(Parlatoria spp.)、ペムフィグス種(Pemphigus spp.)、ペレグリヌス・マイジス(Peregrinus maidis)、フェナコッカス種(Phenacoccus spp.)、フロエオミズス・パッセリニ(Phloeomyzus passerinii)、フォロドン・ヒュムリ(Phorodon humuli)、フィロキセラ種(Phylloxera spp.)、ピナスピス・アスピジストラエ(Pinnaspis aspidistrae)、プラノコッカス種(Planococcus spp.)、プロトプルビナリア・ピリフォルミス(Protopulvinaria pyriformis)、シュードアウラカスピス・ペンタゴナ(Pseudaulacaspis pentagona)、シュードコッカス種(Pseudococcus spp.)、シラー種(Psylla spp.)、プテロマルス種(Pteromalus spp.)、ピリラ種(Pyrilla spp.)、クアドラスピジオツス種(Quadraspidiotus spp.)、ケサダ・ギガス(Quesada gigas)、ラストロコッカス種(Rastrococcus spp.)、ロパロシフム種(Rhopalosiphum spp.)、サイセチア種(Saissetia spp.)、スカフォイデス・チタヌス(Scaphoides titanus)、シザフィス・グラミヌム(Schizaphis graminum)、セレナスピヅス・アルチクラツス(Selenaspidus articulatus)、ソガタ種(Sogata spp.)、ソガテラ・フルシフェラ(Sogatella furcifera)、ソガトデス種(Sogatodes spp.)、スチクトセファラ・フェスチナ(Stictocephala festina)、テナラファラ・マライエンシス(Tenalaphara malayensis)、チノカリス・カリアエフォリアエ(Tinocallis caryaefoliae)、トマスピス種(Tomaspis spp.)、トキソプテラ種(Toxoptera spp.)、トリアレウロデス・バポラルジョルム(trialeurodes vaporarjorum)、トリオザ種(trioza spp.)、チフロシバ種(Typhlocyba spp.)、ウナスピス種(Unaspis spp.)、ビテウス・

ビチフォリイ(Viteus vitifolii)；
等翅目(イソプテラ(Isoptera))のもの、例えば、レチクリテルメス種(Reticulitermes spp.)、オドントテルメス種(Odontotermes spp.)；
鱗翅目(レピドプテラ(Lepidoptera))のもの、例えば、アクロニクタ・メジャー(Acronicta major)、アエジア・レウコメラス(Aedia leucomelas)、アグロチス種(Agrotis spp.)、アラバマ・アルギラセア(Alabama argillacea)、アンチカルシア種(Anticarsia spp.)、バラトラ・ブラッシカエ(Barathra brassicae)、ブックラトリックス・スルベリエラ(Bucculatrix thurberiella)、ブパルス・ピニアリウス(Bupalus piniarius)、カコエシア・ポダナ(Cacoecia podana)、カプア・レチクラナ(Capua reticulana)、カルポカプサ・ポモネラ(Carpocapsa pomonella)、ケイマトビア・ブルマタ(Cheimatobia brumata)、キロ種(Chilo spp.)、コリストネウラ・フミフェラナ(Choristoneura fumiferana)、クリシア・アンビゲラ(Clysia ambiguella)、クナファロセルス種(Cnaphalocerus spp.)、エアリアス・インスラナ(Earias insulana)、エフェスチア・クエニエラ(Ephestia kuehniella)、エウプロクチス・クリソロエア(Euproctis chrysorrhoea)、エウクソア種(Euxoa spp.)、フェルチア種(Feltia spp.)、ガレリア・メロネラ(Galleria mellonella)、ヘリコベルパ種(Helicoverpa spp.)、ヘリオチス種(Heliothis spp.)、ホフマンノフィラ・シュードスプレテラ(Hofmannophila pseudospretella)、ホモナ・マグナニマ(Homona magnanima)、ハイポノメウタ・パデラ(Hyponomeuta padella)、ラフィグマ種(Laphygma spp.)、リソコレチス・ブランカルデラ(Lithocolletis blancardella)、リソファン・アンテナタ(Lithophane antennata)、ロキサグロチス・アルビコスタ(Loxagrotis albicosta)、リマントリア種(Lymantria spp.)、マラコソマ・ネウストリア(Malacosoma neustria)、マメストラ・ブラッシカエ(Mamestra brassicae)、モシス・レパンダ(Mocis repanda)、ミチムナ・セパラタ(Mythimna separata)、オリア種(Oria spp.)、オウレマ・オリザエ(Oulema oryzae)、パノリス・フラメア(Panolis flammea)、ペクチノフォラ・ゴシピエラ(Pectinophora gossypiella)、フィロクニスチス・シトレラ(Phyllocnistis citrella)、ピエリス種(Pieris spp.)、プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella)、プロデニア種(Prodenia spp.)、シュダレチア種(Pseudaletia spp.)、シュードプルシア・インクルデンス(Pseudoplusia includens)、ピラウスタ・ヌビラリス(Pyrausta nubilalis)、スポドプテラ種(Spodoptera spp.)、セルメシア・ゲンマタリス(Thermesia gemmatalis)、チネア・ペリオネラ(Tinea pellionella)、チネオラ・ビッセリエラ(Tineola bisselliella)、トルトリックス・ビリダナ(Tortrix viridana)、トリコプルシア種(Trichoplusia spp.)；
直翅目(オルトプテラ(Orthoptera))のもの、例えば、アチェタ・ドメスチクス(Acheta domesticus)、ブラタ・オリエンタリス(Blatta orientalis)、ブラテラ・ゲルマニカ(Blattella germanica)、グリロタルパ種(Gryllotalpa spp.)、レウコファエア・マデラエ(Leucophaea maderae)、ロクスタ種(Locusta spp.)、メラノプルス種(Melanoplus spp.)、ペリプラネタ・アメリカナ(Periplaneta americana)、シストセルカ・グレガリア(Schistocerca gregaria)；
アザミウマ目(チサノプテラ(Thysanoptera))のもの、例えば、バリオトリプス・ビフォルミス(Baliothrips biformis)、エネオスリプス・フラベンス(Enneothrips flavens)、フランクリニエラ種(Frankliniella spp.)、ヘリオスリプス種(Heliothrips spp.)、ヘルシノスリプス・フェモラリス(Hercinothrips femoralis)、カコスリプス種(Kakothrips spp.)、リピフォロスリプス・クルエンタツス(Rhipiphorothrips cruentatus)、シルトスリプス種(Scirtothrips spp.)、タエニオスリプス・カルダモニ(Taeniothrips cardamoni)、スリプス種(Thrips spp.)；
プロトゾア(Protozoa)綱のもの、例えば、エイメリア種(Eimeria spp.)；
腸管内回虫類(アスカリジア(Ascaridida))、例えばアスカリス種(Ascaris spp.)、例えばアスカリス・ルンブリコイデス(Ascaris lumbricoides)、アスカリス・スウム(Ascaris suum)、アスカリジア・ガリ(Ascaridia galli)、パラスカリス・エクォルム(Parascaris equorum)、エンテロビウス・ベルミクラリス(Enterobius vermicularis)(線虫類)、トキソカラ・カニス(Toxocara canis)、トキサスカリス・レオニン(Toxascaris leonine)、ス

クルジャビネマ種(Skrjabinema spp.)、及びオキシウリス・エキ(Oxyuris equi)；
カマラヌス目(Camallanida)、例えばドラクンクルス・メジネンシス(Dracunculus medinensis)(ギニア虫)、
旋尾線虫目(Spirurida)、例えばテラジア種(Thelazia spp.)、ヴゥケレリア種(Wuchereria spp.)、例えばヴゥケレリア・バンクロフチ(Wuchereria bancrofti)、ブルギア種(Brugia spp.)、例えばブルギア・マライイ(Brugia malayi)、ブルギア・チモリ(Brugia timori)、オンコセルカ種(Onchocerca spp.)、ジロフィラリア種(Dirofilaria spp.)、ジペタロネーマ種(Dipetalonema spp.)、セタリ種(Setaria spp.)、エラエオホラ種(Elaeophora spp.)、スピロセルカ・ルピ(Spirocerca lupi)、及びハブロネマ種(Habronema spp.)；
鉤頭虫類(アカントセファラ(Acanthocephala))、例えばアカントセファルス種(Acanthocephalus spp.)、マクロアカントリンクス・ヒルジナセウス(Macracanthorhynchus hirudinaceus)及びオンシコラ属の種(Oncicola spp)；
プラナリア(Planarians(扁形動物(Plathelminthes))：
吸虫類(Flukes)(吸虫綱(Trematoda))、ファシオラ種(Faciola spp.)、ファシオロイデス・マグナ（Fascioloides magna)、パラゴニムス種(Paragonimus spp.)、ジクロコエリウム種(Dicrocoelium spp.)、ファシオロプシス・ブスキ(Fasciolopsis buski)、クロノルキス種(Clonorchis spp.)、例えばクロノルキス・シネンシス(Clonorchis sinensis)、スキストソマ種(Schistosoma spp.)、トリコビルハルジア種(Trichobilharzia spp.)、アラリア・アラタ(Alaria alata)、パラゴニムス種(Paragonimus spp.)、及びナノシエテス種(Nanocyetes spp.)；
セルコメロモルファ(Cercomeromorpha)、特に条虫目(Cestoda)(条虫(Tapeworms))、例えばジフィロボトリウム種(Diphyllobothrium spp.)、テニア種(Tenia spp.)、エキノコッカス種(Echinococcus spp.)、ジピルイジウム・カニヌム(Dipylidium caninum)、ムルチセプス種(Multiceps spp.)、ヒメノレピス種(Hymenolepis spp.)、メソセストイド種(Mesocestoides spp.)、バンピロレピス種(Vampirolepis spp.)、モニエジア種(Moniezia spp.)、アノプロセファラ種(Anoplocephala spp.)、シロメトラ種(Sirometra spp.)、アノプロセファラ種(Anoplocephala spp.)、及びヒメノレピス種(Hymenolepis spp.)。

【００７９】

式Iの化合物及びそれらを含む組成物は、双翅(Diptera)、ノミ目(Siphonaptera)及びマダニ目(Ixodida)の害虫の防除に特に有用である。
さらに、蚊を駆除するための式Iの化合物及びそれらを含む組成物の使用が特に好ましい。
ハエを駆除するための式Iの化合物及びそれらを含む組成物の使用は、本発明のさらに好ましい実施形態である。
さらに、ノミを駆除するための式Iの化合物及びそれらを含む組成物の使用が特に好ましい。
マダニを駆除するための式Iの化合物及びそれらを含む組成物の使用は、本発明のさらに好ましい実施形態である。
式Iの化合物及びそれらを含む組成物は、内部寄生虫(限定するものではないが、線虫類、条虫類、吸虫類、及び原虫類が挙げられる)を駆除するためにも特に有用である。
式Iの化合物は、接触(土壌、ガラス、壁、蚊帳、カーペット、ブランケット又は動物部位を介して)及び摂取(すなわち餌)の両方を通じて効果があり得る。
本発明は、動物内及び動物上の寄生虫を防除及び／又は駆除するための式Iの化合物の治療的及び非治療的使用に関する。
式Iの化合物を用いて、寄生虫を殺寄生虫有効量の式Iの化合物と接触させることによって、寄生虫による攻撃又は侵襲から動物を保護することができる。「接触させる」こと自体で、直接接触(化合物／組成物を例えばその生息場所で寄生虫に直接適用すること、及び場合によっては化合物／組成物を直接動物に投与すること)及び間接接触(寄生虫の生息場所に化合物／組成物を適用すること)の両方を包含する。その生息場所への適用による

寄生虫の接触は、式Iの化合物の非治療的使用の例である。
上で規定した「生息場所」は、動物の外側で寄生虫が成長しているか又は成長し得る生息地、餌供給源、繁殖地、区域、材料若しくは環境を意味する。本発明の化合物を害虫又は寄生虫の発生が予想される場所に予防的に適用することもできる。
【００８０】
動物への投与は、予防的に行うことも治療的に行うこともできる。活性化合物の投与は直接行うか、或いは適切な製剤の形態で経口、局所／経皮又は非経口で行う。
温血動物への経口投与のためには、式I化合物を動物用飼料、動物用飼料プレミックス、動物用飼料濃縮物、丸剤、溶液、ペースト、懸濁液、水薬、ゲル、錠剤（咀嚼錠を含め）、大丸剤及びカプセル剤として処方し得る。さらに、式I化合物を動物の飲料水で投与してもよい。経口投与では、選ばれた剤形は、1日0.01mg/kg～100mg/kg(動物の体重)の式I化合物、好ましくは1日0.5mg/kg～100mg/kg(動物の体重)の式I化合物を動物に与えるべきである。
或いは、式I化合物を動物に非経口的に、例えば、第一胃内、筋肉内、静脈内又は皮下注射によって投与してよい。式I化合物を皮下注射用の生理学的に許容できる担体に分散又は溶解させてよい。或いは、式I化合物を皮下投与用の移植片中に配合してよい。さらに式I化合物を動物に経皮投与してよい。非経口投与では、選ばれた剤形は、1日0.01mg/kg～100mg/kg(動物の体重)の式I化合物を動物に与えるべきである。
式I化合物をディップ、細粉、粉末、首輪(collars)、大型メダル(medallions)、スプレー、シャンプー、スポットオン、スプレーオン及びポアオン(pour-on)製剤の形態及び軟膏又は水中油若しくは油中水エマルションで動物に適用してもよい。局所適用では、ディップ及びスプレーは通常は0.5ppm～5,000ppm、好ましくは1ppm～3,000ppmの式I化合物を含む。さらに、動物、特にウシ及びヒツジ等の四肢動物用の耳標として式I化合物を処方してもよい。
【００８１】
ポアオン製剤は、参照によってここに援用する米国特許第6,010,710号に記載されている。ポアオン製剤は、有利には油性であり、一般的に希釈剤又はビヒクルを含み、活性成分が希釈剤に溶けない場合は、活性成分の溶媒(例えば有機溶媒)をも含む。
スポットオン製剤は、米国特許第6,395,765号；第6,867,229号；第6,096,329号；第6,426,333号、及び第6,685,954号に記載されており、これらの開示内容は参照によってその全体をここに援用する。
適切な製剤には、限定ではなく、以下のものが挙げられる。
－溶液、例えば経口溶液、希釈後経口投与用の濃縮液、皮膚上又は体腔内用の溶液、ポアリングオン(pouring-on)製剤、ゲル；
－経口又は経皮投与用エマルション及び懸濁液；半固体製剤；
－軟膏基剤又は水中油若しくは油中水エマルション基剤中で活性化合物を加工した製剤；
－固体製剤、例えば粉末、プレミックス又は濃縮物、顆粒、ペレット、錠剤、大丸剤、カプセル剤；エアロゾル及び吸入剤、並びに活性化合物含有造形品。
【００８２】
注射に適した組成物は、活性成分を適切な溶媒又は担体に溶解させ、必要に応じて酸、塩基、緩衝塩、保存剤、及び可溶化剤等のさらなる成分を添加することによって調製される。溶液をろ過及び無菌充填し得る。
適切な溶媒は、生理学的に容認できる溶媒、例えば水、及び有機溶媒、例えばアルカノール、例えばエタノール、ブタノール、イソプロパノール、ベンジルアルコール、グリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、N-メチル-ピロリドン、2-ピロリドン、及びこれらの混合物である。他の適切な溶媒としては、限定するものではないが、アセチルトリブチルシトラート、脂肪酸エステル、例えばジメチルエステル、アジピン酸ジイソブチル、アセトン、アセトニトリル、ブチルジグリコール、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド、ジプロピレングリコールn-ブチルエーテル、エチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコールモノメチルエーテル、モノメチルアセトア

ミド、ジプロピレングリコールモノメチルエーテル、液体ポリオキシエチレングリコール、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、エチレングリコール及びフタル酸ジエチル、又はこれらの溶媒の少なくとも2種の混合物が挙げられる。

活性化合物を必要に応じて注射に適した生理学的に容認できる植物油又は合成油に溶解させ得る。

ビヒクル又は希釈剤として、限定するものではないが、ダイズ油、ラッカセイ油、ヒマシ油、コーン油、綿実油、オリーブ油、ブドウ種子油、ヒマワリ油、ヤシ油等の植物油；限定するものではないが、石油、パラフィン、シリコーン等の鉱油；脂肪族又は環式炭化水素或いは、例えば、中鎖(例えばC_8-C_{12})トリグリセリドが挙げられる。

適切な可溶化剤は、主溶媒中での活性化合物の溶解を促進し、その沈殿を防止する溶媒である。例は、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチル化ヒマシ油、及びポリオキシエチル化ソルビタンエステルである。

適切な保存剤は、ベンジルアルコール、トリクロロブタノール、p-ヒドロキシ安息香酸エステル、及びn-ブタノールである。

【００８３】

局所組成物用の一部の実施形態では、例えば、参照によってここに援用する米国特許第6,395,765号に記載されているように、組成物がすぐに使える溶液形態であってよい。すぐに使える溶液は、活性剤化合物に加えて、結晶化抑制剤、有機溶媒及び有機共溶媒を含有し得る。

一部の実施形態では、結晶化抑制剤が約1～約30%(w/v)の比率で存在し得る。典型的に、結晶化抑制剤は、約1%～約20%(w/v)又は約5%～約15%(w/v)の比率で存在してよい。許容できる抑制剤は、製剤にそれを添加すると、製剤を適用するときに結晶の形成を抑制するものである。一部の実施形態では、製剤は、結晶化抑制剤として機能する本明細書で列挙するもの以外のものを含んでもよい。これらの実施形態では、結晶化抑制剤の適合性は、10%(w/v)の結晶化抑制剤を含む上記溶媒に10%(w/v)の式Iの化合物を含有するサンプルを20℃で24時間スライドガラス上に置いたときに20個未満、好ましくは10個未満の結晶しかもたらさないように、結晶化抑制剤が結晶の形成を十分に抑制できるかを試験することによって決定することができる。

【００８４】

本発明に有用な結晶化抑制剤としては、限定するものではないが、以下のものが挙げられる。

(a)ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、酢酸ビニルとビニルピロリドンのコポリマー、2-ピロリドン（例えばN-メチルピロリドン）、ジメチルスルホキシド、ポリエチレングリコール、ベンジルアルコール、マンニトール、グリセリン、ソルビトール又はソルビタンのポリオキシエチレン化エステル；レシチン又はナトリウムカルボキシメチルセルロール；アクリル酸誘導体、例えばアクリルモノマー由来のメタクリラート及びポリマー、活性剤その他の結晶化を抑制する本明細書に記載の溶媒；

(b)アニオン界面活性剤、例えばアルカリ性ステアリン酸塩(例えば、ステアリン酸ナトリウム、ステアリン酸カリウム又はステアリン酸アンモニウム)；ステアリン酸カルシウム又はステアリン酸トリエタノールアミン；アビエチン酸ナトリウム；アルキル硫酸塩、これには限定するものではないが、ラウリル硫酸ナトリウム及びセチル硫酸ナトリウムが挙げられる；ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム又はジオクチルスルホコハク酸ナトリウム；又は脂肪酸(例えば、ヤシ油)；

(c)カチオン界面活性剤、例えば式$N^+R'R''R'''R''''Y^-$（式中、R基は、同一又は異なり、任意にヒドロキシル化炭化水素基であってよく、Y^-は、強酸のアニオン、例えばハロゲン化物アニオン、硫酸アニオン、スルホン酸アニオンである）の水溶性四級アンモニウム塩；臭化セチルトリメチルアンモニウムは、使用可能なカチオン界面活性剤の1つである；

(d)式NR'R''R'''（式中、Rは、同一又は異なり、任意にヒドロキシル化炭化水素基であってよい）のアミン塩；オクタデシルアミン塩酸塩は、使用可能なカチオン界面活性剤の1つである；

(e)非イオン界面活性剤、例えば、ソルビタンの任意にポリオキシエチレン化されていてもよいエステル、例えば、ポリソルベート80、又はポリオキシエチレン化アルキルエーテル；ポリエチレングリコールステアレート、ヒマシ油のポリオキシエチレン化誘導体、ポリグリセロールエステル、ポリオキシエチレン化脂肪アルコール、ポリオキシエチレン化脂肪酸又はエチレンオキシドとプロピレンオキシドのコポリマー；
(f)両性界面活性剤、例えばベタインの置換ラウリル化合物；又は
(g)上記(a)～(f)に列挙した化合物の少なくとも2種の混合物。

【００８５】

経口溶液は直接投与される。濃縮液は使用濃度に事前希釈後に経口投与される。経口溶液及び濃縮液は、最新技術に従い、また注射液について上述したように、滅菌手順を必要とせずに調製される。

本発明の一実施形態では、組成物がペースト形態であってよい。ペースト形態の実施形態の例としては、限定するものではないが、米国特許第6,787,342号及び第7,001,889号(それぞれ参照によってここに援用する)に記載されているものが挙げられる。

皮膚用の溶液は、皮膚上に滴下し、皮膚上に撒き散らし、皮膚中に擦り込み、皮膚上に振りかけ、又は皮膚上に噴霧される。

皮膚用の溶液は、最新技術に従い、また注射液について上述したことに従って、滅菌手順を必要とせずに調製される。

さらに好適な溶媒として、ポリプロピレングリコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、エステル、例えば酢酸エチル又は酢酸ブチル、安息香酸ベンジル、エーテル、例えばアルキレングリコールアルキルエーテル、例えばジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、芳香族炭化水素、植物油及び合成油、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、トランスクトール(transcutol)、ソルケタール(solketal)、プロピレンカルボナート、及びこれらの混合物が挙げられる。

【００８６】

調製中に増粘剤を添加すると有利なことがある。適切な増粘剤として、無機増粘剤、例えばベントナイト、コロイド性シリカゲル、モノステアリン酸アルミニウム、有機増粘剤、例えばセルロール誘導体、ポリビニルアルコール及びそれらのコポリマー、アクリラート及びメタクリラートが挙げられる。

ゲルは、皮膚に適用又は皮膚の上に撒き散らし、或いは体腔内に導入される。ゲルは、注射液の場合に上述した通りに調製された溶液を、軟膏様粘稠度を有するクリアな材料が生じるのに十分な増粘剤で処理することによって調製される。利用する増粘剤としては、上記増粘剤が挙げられる。

ポアオン製剤は、皮膚の限定領域上に注がれるか又は噴霧され、活性化合物が皮膚に浸透して全身に作用する。

ポアオン製剤は、活性化合物を皮膚適合性の溶媒又は溶媒混合物に溶解、懸濁又は乳化させることによって調製される。適切な場合には、例えば着色料、生体吸収促進物質、酸化防止剤、光安定剤、接着剤などの他の補助剤を添加する。

適切な溶媒としては、水、アルカノール、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセロール、芳香族アルコール、例えばベンジルアルコール、フェニルエタノール、フェノキシエタノール、エステル、例えば酢酸エチル、酢酸ブチル、安息香酸ベンジル、エーテル、例えばアルキレングリコールアルキルエーテル、例えばジプロピレングリコールモノメチルエーテル、ジエチレングリコールモノブチルエーテル、ケトン、例えばアセトン、メチルエチルケトン、環式カルボナート、例えばプロピレンカルボナート、エチレンカルボナート、芳香族及び／又は脂肪族炭化水素、植物油又は合成油、DMF、ジメチルアセトアミド、n-アルキルピロリドン、例えばメチルピロリドン、n-ブチルピロリドン又はn-オクチルピロリドン、N-メチルピロリドン、2-ピロリドン、2,2-ジメチル-4-オキシ-メチレン-1,3-ジオキソラン及びグリセロールホルマールが挙げられる。

適切な着色料には、動物に使うのに許容され、かつ溶解又は懸濁可能な全ての着色料が含まれる。

適切な吸収促進物質としては、例えば、DMSO、拡散油、例えばミリスチン酸イソプロピル、ジプロピレングリコールグリコールジペラルゴナート、シリコーン油及びそのポリエーテル、脂肪酸エステル、トリグリセリド、脂肪アルコールとのコポリマーが挙げられる。

適切な酸化防止剤として、亜硫酸塩又はメタ重亜硫酸塩、例えばメタ重亜硫酸カリウム、アスコルビン酸、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、及びトコフェロールが挙げられる。

適切な光安定剤には、例えば、ノバンチソール酸(novantisolic acid)がある。

適切な接着剤には、例えば、セルロール誘導体、デンプン誘導体、ポリアクリラート、天然ポリマー、例えばアルギナート、ゼラチン等がある。

【００８７】

エマルションは、経口、経皮投与又は注射として投与可能である。エマルションは、油中水型又は水中油型のどちらかである。活性化合物を疎水性相又は親水性相のどちらかに溶解させ、これを適切な乳化剤の助けを借りて他相の溶媒、また適切な場合には、着色料、吸収促進物質、保存剤、酸化防止剤、光安定剤、粘性増強物質などの他の補助剤を用いて均質化することによってエマルションを調製し得る。

適切な疎水性相(油)として、液体パラフィン、シリコーン油、天然植物油（例えばゴマ油、アーモンド油、ヒマシ油）、合成トリグリセリド、例えばカプリル酸／カプリン酸ビグリセリド、鎖長C_8-C_{12}の植物脂肪酸又は他の特別に選択した天然脂肪酸とのトリグリセリド混合物、おそらくヒドロキシル基をも含有する飽和若しくは不飽和脂肪酸とのグリセリド混合物、C_8-C_{10}脂肪酸のモノグリセリド及びジグリセリド、脂肪酸エステル、例えばステアリン酸エチル、アジピン酸ジ-n-ブチル、ラウリン酸ヘキシル、ジプロピレングリコールペルラルゴナート(perlargonate)、中鎖長の分岐脂肪酸と鎖長C_{16}-C_{18}の飽和脂肪アルコールのエステル、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、鎖長C_{12}-C_{18}の飽和脂肪アルコールのカプリル酸／カプリン酸エステル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸オレイル、オレイン酸デシル、オレイン酸エチル、乳酸エチル、ろう様脂肪酸エステル、例えば合成アヒル尾腺脂(duck coccygeal gland fat)、フタル酸ジブチル、アジピン酸ジイソプロピル、及び後者に関連するエステル混合物、脂肪アルコール、例えばイソトリデシルアルコール、2-オクチルドデカノール、セチルステアリルアルコール、オレイルアルコール、及び脂肪酸、例えばオレイン酸並びにこれらの混合物が挙げられる。

適切な親水性相は、水、アルコール、例えばプロピレングリコール、グリセロール、ソルビトール及びその混合物である。

適切な乳化剤として、非イオン界面活性剤、例えばポリエトキシル化ヒマシ油、ポリエトキシル化ソルビタンモノオレアート、モノステアリン酸ソルビタン、グリセロールモノステアラート、ポリオキシエチルステアラート、アルキルフェノールポリグリコールエーテル；両性界面活性剤、例えばジ-ナトリウムN-ラウリル-p-イミノジプロピオナート又はレシチン；アニオン界面活性剤、例えばラウリル硫酸ナトリウム、脂肪アルコールエーテルスルファート、モノ／ジアルキルポリグリコールエーテルオルトリン酸エステルエタノールアミン塩；及びカチオン活性界面活性剤、例えばセチルトリメチルアンモニウムクロリドが挙げられる。

適切なさらなる補助剤は、粘度を高め、エマルションを安定化する物質、例えばカルボキシメチルセルロール、メチルセルロールその他のセルロール及びデンプン誘導体、ポリアクリラート、アルギナート、ゼラチン、アラビアゴム、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、メチルビニルエーテルと無水マレイン酸のコポリマー、ポリエチレングリコール、ろう、コロイド性ケイ酸又は上記物質の混合物である。

【００８８】

懸濁液は、経口又は局所／経皮投与が可能である。懸濁剤に、適切な場合には湿潤剤、

着色料、生体吸収促進物質、保存剤、酸化防止剤、光安定剤などの他の補助剤を添加して、活性化合物を懸濁させることによって、懸濁液を調製し得る。

液体懸濁剤として、全ての均一溶媒及び溶媒混合物が挙げられる。

適切な湿潤剤(分散剤)には上記乳化剤がある。

言及し得る他の補助剤には上述したものがある。

半固体製剤は経口又は局所／経皮投与が可能である。半固体製剤は、それらの粘度がより高いことのみが上記懸濁液及びエマルションと異なる。

固体製剤の製造のためには、活性化合物を適切な賦形剤と、適切な場合には補助剤を添加して、混合し、所望形態にする。

適切な賦形剤としては、全ての生理学的に容認できる固形の不活性物質が挙げられる。使用する当該賦形剤は無機及び有機物質である。無機物質は、例えば、塩化ナトリウム、炭酸塩、例えば炭酸カルシウム、炭酸水素塩、酸化アルミニウム、酸化チタン、ケイ酸、粘土質の土、沈殿性又はコロイド性シリカ、又はリン酸塩である。有機物質は、例えば、糖、セルロール、食糧及び餌、例えば粉乳、動物ミール、穀粒ミール及び断片、デンプンである。

適切な補助剤には、上述した保存剤、酸化防止剤、及び／又は着色料がある。

他の適切な補助剤として、潤沢剤及び流動促進剤、例えばステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸、タルク、ベントナイト、崩壊促進物質、例えばデンプン及び架橋ポリビニルピロリドン、結合剤、例えばデンプン、ゼラチン又は線形ポリビニルピロリドン、及び乾燥結合剤、例えば微結晶性セルロールが挙げられる。

【００８９】

一般に、「殺寄生虫有効量」とは、標的生物の成長に観察可能な効果（壊死、死、遅延、阻止、及び除去、破壊、又はそれ以外に標的生物の発生及び活性を減じる効果を含め）を及ぼすために必要な活性成分の量を意味する。殺寄生虫有効量は、本発明で使用する種々の化合物／組成物によって異なり得る。組成物の殺寄生虫有効量は、所望の殺寄生虫効果及び持続時間、標的種、適用様式などの一般的な条件によっても異なるであろう。

本発明で使用できる組成物は、一般的に約0.001～95%の式Iの化合物を含み得る。

一部の実施形態では、総量1日0.5mg/kg～100mg/kg、好ましくは1日1mg/kg～50mg/kgの式Iの化合物を適用するのが好ましい。

すぐに使える製剤は、寄生虫、好ましくは外部寄生虫に対して作用する化合物を10ppm～80質量%、好ましくは0.1～65質量%、さらに好ましくは1～50質量%、最も好ましくは5～40質量%の濃度で含む。

使用前に希釈する製剤は典型的に、外部寄生虫に対して作用する化合物を0.5～90質量%、好ましくは1～50質量%の濃度で含む。

さらに、製剤は典型的に、内部寄生虫に対する式Iの化合物を10ppm～2質量%、好ましくは0.05～0.9質量%、非常に特に好ましくは0.05～0.25質量%の濃度で含む。

用量中の内部・外部寄生虫に効く殺寄生虫剤(endectocide)の有効量は、約0.1mg/kg～約200mg/kg又は約1～約200mg/kg(動物の体重)の範囲から選択し得る。

【００９０】

本発明の化合物を含む獣医学的組成物は、任意に少なくとも1種の他の関連殺寄生虫成分、例えば殺虫剤、殺ダニ剤、殺寄生虫剤などを含んでもよい。

他の殺寄生虫剤は、大環状ラクトン型の、内部寄生虫と外部寄生虫に効く殺寄生虫剤(endectocidal parasiticide)であってよい。この大環状ラクトン型殺寄生虫剤としては、限定するものではないが、アバメクチン、ジマデクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、イベルメクチン、ラチデクチン、レピメクチン、セラメクチン、及びミルベマイシン並びにそれらの誘導体（限定するものではないが、ミルベメクチン、モキシデクチン、ネマデクチン及びミルベマイシンDが挙げられる）が挙げられる。

アベルメクチン及びミルベマイシン系列の化合物は、広範な内部及び外部寄生虫に対して強力な駆虫剤及び抗寄生虫剤である。この系列に属する化合物は、天然物又はその半合成誘導体のどちらかである。これらの二系列の化合物の構造は密接に関係があり、両方と

も複雑な16員大環状ラクトン環を共有するが、ミルベマイシンは、ラクトン環の13位にアグリコン置換基を含まない。天然物アベルメクチンは、米国特許第4,310,519号（Albers-Schonbergら）に開示され、22,23-ジヒドロアベルメクチン化合物は、Chabalaらの米国特許第4,199,569号に開示されている。ヒト及び動物におけるアベルメクチンの使用の考察を含めたアベルメクチンの一般的考察のためには、“Ivermectin and Abamectin,” W.C. Campbell, ed., Springer-Verlag, New York (1989)を参照されたい。天然に存在するミルベマイシンは、Aokiらの米国特許第3,950,360号並びに“The Merck Index” 12th ed., S. Budavari, Ed., Merck & Co., Inc. Whitehouse Station, New Jersey (1996)で引用されている種々の参考文献に記載されている。これらの分類の化合物の半合成誘導体は、例えば、米国特許第5,077,308号、米国特許第4,859,657号、米国特許第4,963,582号、米国特許第4,855,317号、米国特許第4,871,719号、米国特許第4,874,749号、米国特許第4,427,663号、米国特許第4,310,519号、米国特許第4,199,569号、米国特許第5,055,596号、米国特許第4,973,711号、米国特許第4,978,677号、及び米国特許第4,920,148号に記載されている。これらの特許は全て参照によってその内容全体をここに援用する。特に好ましい化合物として、イベルメクチン、エマメクチン、アバメクチン、ドラメクチン、エマメクチン、エプリノメクチン、モキシデクチン及びセラメクチンが挙げられる。

【００９１】

本発明の製剤又は方法に含め得る別分類の化合物は、昆虫成長調節剤(IGR)である。この群に属する化合物は専門家には周知であり、広範な様々の化学分類に相当する。これらの化合物は全て、害虫の発生又は成長を妨害することによって作用する。種々の内部寄生虫の未成熟段階に及ぼす殺卵及び／又は殺幼虫効果を有する化合物は、例えば、米国特許第5,439,924号から既知である。これらの化合物のうち、未成熟期(卵及び幼虫)の成虫期への発育を遮断するか又はキチンの合成を阻害することによって作用する当該IGR化合物が記載されている。昆虫成長調節剤は、例えば、米国特許第3,748,356号；米国特許第3,818,047号；米国特許第4,225,598号；米国特許第4,798,837号及び米国特許第4,751,225号、並びに欧州特許第179,022号又は英国特許第2,140,010号に記載されている。これらの特許の開示内容全体を参照によってここに援用する。仏国特許第A-2,713,889号（参照によってその内容をここに援用する）は、非常に多様な目に属する多くの有害昆虫を防除するための、幼若ホルモン活性を有する少なくとも1種の化合物及びチキン合成阻害剤を、3種のN-アリールジアゾール化合物の少なくとも1種、特にフィプロニルと共に含むをIGRの組合せについて一般的に記載している。

本発明の獣医学的製剤で使用し得るIGRの例には、幼若ホルモンを模倣する化合物、特にアザジラクチン(Azadirchtin)-アグリジン(Agridyne)、ジオフェノラン(Diofenolan)、フェノキシカルブ(Fenoxycarb)、ヒドロプレン(Hydroprene)、キノプレン(Kinoprene)、メトプレン(Methoprene)、ピリポキシフェン(Pyriproxyfen)、テトラヒドロアザジラクチン(Tetrahydroazadiracthin)、4-クロロ-2-(2-クロロ-2-メチルプロピル)-5-(6-ヨード-3-ピリジルメトキシ)ピリジジン-3(2H)-オン、及びキチン合成阻害剤、特にクロルフルアズロン、シロマジン、ジフルベンズロン、フルアズロン、フルシクロキスロン、フルフェノキスロン、ヘキサフルムロン、ルフェヌロン、テブフェノジド、テフルベンズロン、トリフルムロンが挙げられ、これらの化合物は、その国際的一般名で定義されている(The Pesticide Manual, 10th edition, 1994, Ed. Clive Tomlin, Great Britain)。キチン合成阻害剤としては、1-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-3-(2-フルオロ-4-((トリフルオロメチル)フェニル尿素、1-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-3-(2-フルオロ-4-(1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ)フェニル尿素及び1-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-3-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチル)フェニル尿素などの化合物も挙げられる。ノバルロンもIGRの例である。特に好ましいIGRとして、メトプレン、ピリプロキシフェン、ヒドロプレン、シロマジン、ルフェヌロン、1-(2,6-ジフルオロベンゾイル)-3-(2-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル尿素及びノバルロンが挙げられる。

【００９２】

別分類の化合物の一部であるが、他の殺寄生虫剤は殺内部寄生虫剤である。好ましくは

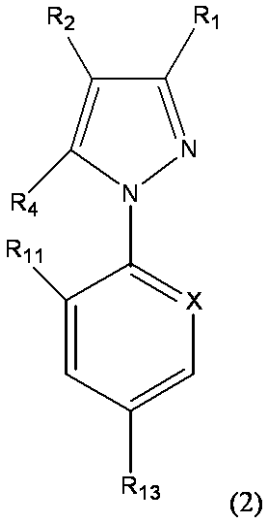
殺内部寄生虫剤はアリールピラゾールである。適切なアリールピラゾールは、欧州特許第295117号(米国特許第5232940号、第5547974号、第5608077号、第5714191号、第5916618号及び第6372774号)に記載されているものであり、これらの全ての特許は参照によってその全体をここに援用する。さらにN-アリールピラゾール化合物は、米国特許第4,963,575号；第5,885,607号；第6,083,519号；第6,010,710号；第6,096,329号(第6,685,954)号；欧州特許第0234119号、及び欧州特許第0352944号；米国特許第5,817,688号；第5,922,885号；第5,994,386号；第6,124,339号；第6,180,798号及び第6,395,906号並びに欧州特許第0780378号；米国特許第6,069,157号及び欧州特許第0846686号；米国特許第6,350,771号及び欧州特許第0948485号に記載されており、これらの全ての特許は参照によってその全体をここに援用する。N-アリール-ピラゾールは、ノミ及びマダニ等の昆虫に対する優れた活性を有することが知られている。フィプロニルは、特にノミ及びマダニ対して有効な特異型のN-アリール-ピラゾールであり、Frontline(登録商標)及びFrontline Plus(登録商標)の活性成分である。

例えば、アリールピラゾール分子では、アリール基がピラゾールの1位のピラゾール基に結合し、アリール基は置換フェニル基である。好ましくは、置換フェニル基中、その置換基は、フェニル環の2位、4位、及び／又は6位にあり、置換基は、C_1-C_4アルキル、ハロゲン、及びC_1-C_4-ハロアルキルから成る群より選択される。さらに好ましくはピラゾールは、任意に3位にて、シアノ、ニトロ、ハロゲン、アセチル又はホルミルから成る群より選択される成分で置換されていてもよく；任意に4位にてZ-$S(O)_q$-（式中、ZはC_1-C_4アルキル又はC_1-C_4-ハロアルキルであり、qは0、1又は2である）で置換されていてもよく；かつ任意に5位にてアミノ基又はC_1-C_4アルキル若しくはC_1-C_4アルカノイル基で置換されたアミノで置換されていてもよい。最も好ましくはアリールピラゾール化合物は5-アミノ-1-[2,6-ジクロロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル]-4-[(トリフルオロメチル)スルフィニル]-1H-ピラゾール-3-カルボニトリル(「フィプロニル」)、ピリロール及びピラフルプロールである。

一実施形態では、式Iの発明化合物を下記式2の化合物と併用投与してよい。

【００９３】

【化１５】



(2)

【００９４】

式中：

R_1は、アルキル、CN又はハロゲンであり；

R_2は、$S(O)_nR_3$又は4,5-ジシアノイミダゾール-2-イル又はハロアルキルであり；

R_3は、アルキル又はハロアルキルであり；

R_4は、水素、ハロゲン、$-NR_5R_6$、$-S(O)_mR_7$、$-C(O)R_7$、$-C(O)OR_7$、アルキル、ハロアルキル、$-OR_8$又は$-N=C(R_9)(R_{10})$であり；

R_5及びR_6は、独立に水素、アルキル、ハロアルキル、-C(O)アルキル、$-S(O)_rCF_3$又はアル

コキシカルボニルを表し；或いは
R_5とR_6が結合して、任意に1又は2個の二価ヘテロ原子で中断されていてもよい二価アルキレン基を形成することがあり；
R_7は、アルキル又はハロアルキルであり；
R_8は、水素、アルキル又はハロアルキルであり；
R_9は、水素又はアルキル基であり；
R_{10}は、任意に置換されていてもよいアリール又は任意に置換されていてもよいヘテロアリール基であり；
R_{11}及びR_{12}は、相互独立に、水素、ハロゲン、CN又はNO_2を表し；
R_{13}は、ハロゲン、ハロアルキル、ハロアルコキシ、$S(O)_qCF_3$又はSF_5基をであり；
m、n、q及びrは、相互独立に、0、1又は2に等しい整数であり；かつ
Xは、三価の窒素原子又はC-R_{12}基（該炭素原子の他の3つの原子価が芳香環部分を形成している）を表す。

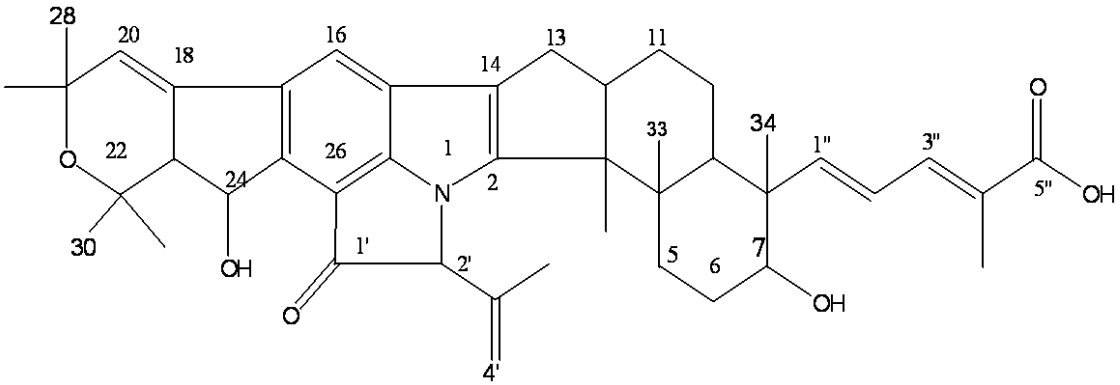
【００９５】

例えば、ノズリスポリン酸又はノズリスポリン酸誘導体も考慮される。ノズリスポリン酸又はノズリスポリン酸誘導体は、殺内部寄生虫剤及び殺外部寄生虫剤である分類の化合物として技術上周知である。これらの化合物は、以下の構造を有する3つの構造、A、B又はCに基づいている。

ノズリスポリン酸(化合物A)：

【００９６】

【化１６】

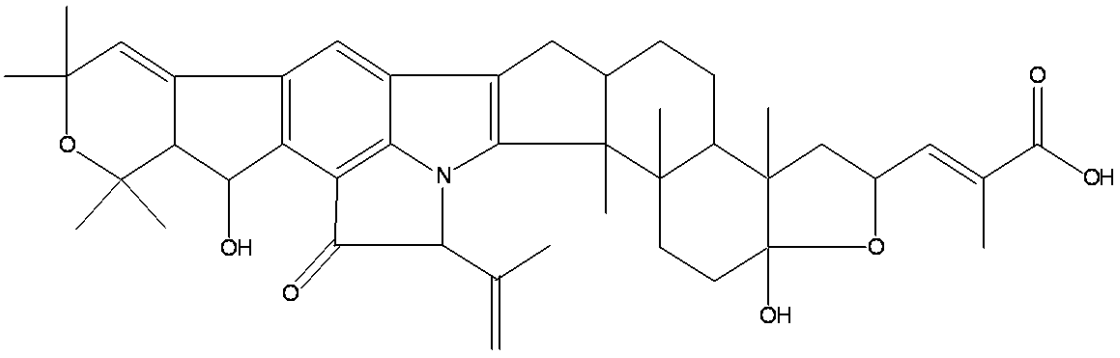


【００９７】

29,30-ジヒドロ-20,30-オキサ-ノズリスポリン酸(化合物B)：

【００９８】

【化１７】

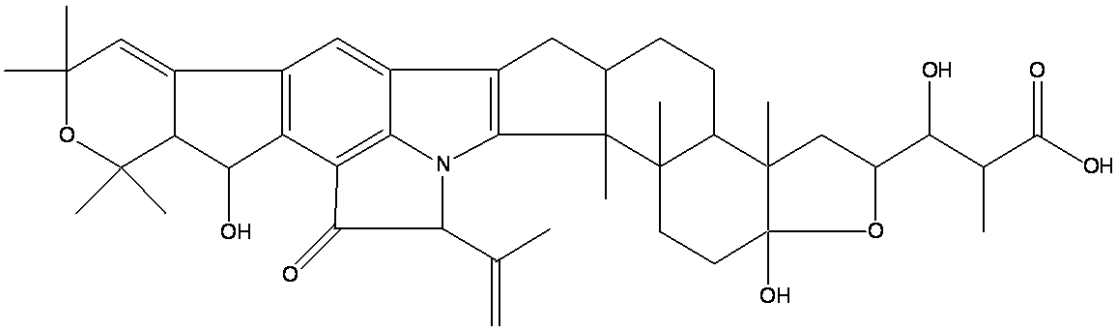


【００９９】

及び31-ヒドロキシ-20,30-オキサ-29,30,31,32-テトラヒドロ-ノズリスポリン酸(化合物C)

【０１００】

【化１８】



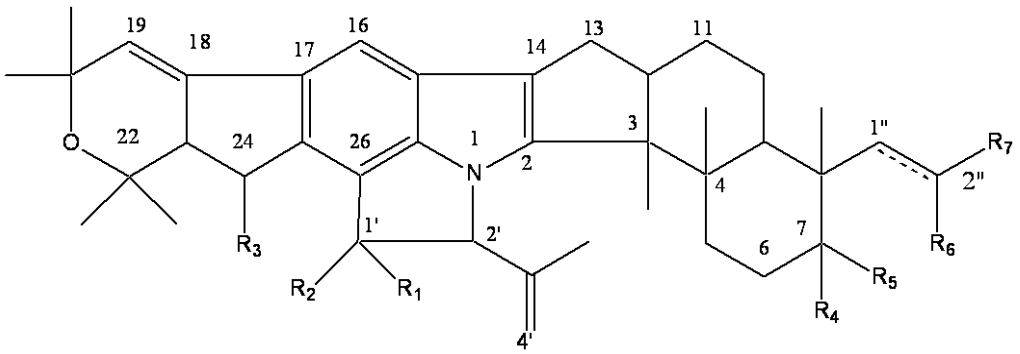
【０１０１】

ノデュリオスポリウム種(Nodulisporium sp.)MF-5954 (ATCC 74245)の発酵培養からこれらのノズリスポリン酸化合物A、B及びCを得た。3種のノズリスポリン酸の単離及び精製は、米国特許第5,399,582号に開示されている。これらの化合物の誘導体は、WO 96/29073及び米国特許第5,945,317号；第5,962,499号；第5,834,260号；第6,399,796号；第6,221,894号；第6,136,838号；第5,595,991号；第5,299,582号；及び第5,614,546号に記載されている。

本発明の組成物は、技術上周知の全てのノズリスポリン酸誘導体をも、全ての立体異性体、例えば、参照によって明示的に援用し、かつ下記式において本明細書で述べる上記先行公報に記載されているものを含めて包含する。当該式の置換基は、以降に直接定義され、それらの命名及び定義は、本発明の化合物及び他の上記化合物とは独立に行われる。下記式のノズリスポリン酸誘導体；又はその薬学的に許容できる塩を含むスポットオン製剤が特に好ましい。

【０１０２】

【化１９】



I'

【０１０３】

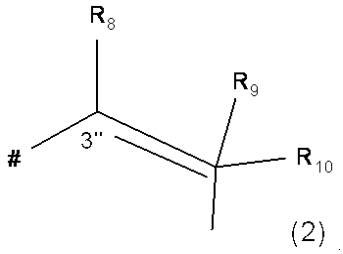
式中、

R_1は、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいアルキル、(3)任意に置換されていてもよいアルケニル、(4)任意に置換されていてもよいアルキニル、(5)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(6)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルの置換基は、(i)アルキル、(ii)X-C_1-C_6-アルキル（式中、Xは0又は$S(0)_m$である）、(iii)シクロアルキル、(iv)ヒドロキシ、(v)ハロゲン、(vi)シアノ、(vii)カルボキシ、(viii)NY^1Y^2（式中、Y^1及びY^2は独立にH又はアルキルである）、(ix)アルカノイルアミノ、及び(x)アロイルアミノ（前記アロイルは、任意に、R^fから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）から独立に選択される1～3個の基である）、(7)アリール又はアリールアルキル（前記アリールは、任意に、R^fから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(8)ペルフルオロアルキル、(9)酸素、イオウ及び窒素原子から独立に選択される1～4

個のヘテロ原子を含有する5員又は6員ヘテロ環（任意に、ヒドロキシ、オキソ、アルキル及びハロゲンから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよく、かつ飽和されているか又は部分的に不飽和であってよい）であり、R_2、R_3、及びR_4は、独立にOR^a、OCO_2R^b、$OC(O)NR^cR^d$であり；或いはR_1とR_2が=O、$=NOR^a$又は$=N\text{-}NR^cR^d$を表し；R_5及びR_6はHであり；或いはR_5とR_6が一緒に-O-を表し；R_7は、(1)CHO又は下記フラグメント(2)
である。

【０１０４】

【化２０】



(2)

【０１０５】

式中、

#は、式I'の分子への結合を示し、R_8は、(1)H、(2)OR^a又は(3)NR^cR^dであり、R_9は、(1)H又は(2)OR^aであり、R_{10}は、(1)CN、(2)$C(O)OR^b$、(3)$C(O)N(OR^b)R^c$、(4)$C(O)NR^cR^d$、(5)$NHC(O)OR^b$、(6)$NHC(O)NRCR^d$、(7)CH_2OR^a、(8)$CH_2OCO_2R^b$、(9)$CH_2OC(O)NR^cR^d$、(10)$C(O)NR^cNR^cR^d$又は(11)$C(O)NR^cSO_2R^b$であり；式中、下記記号

【０１０６】

【化２１】

【０１０７】

は、単結合又は二重結合を表し、ここで、

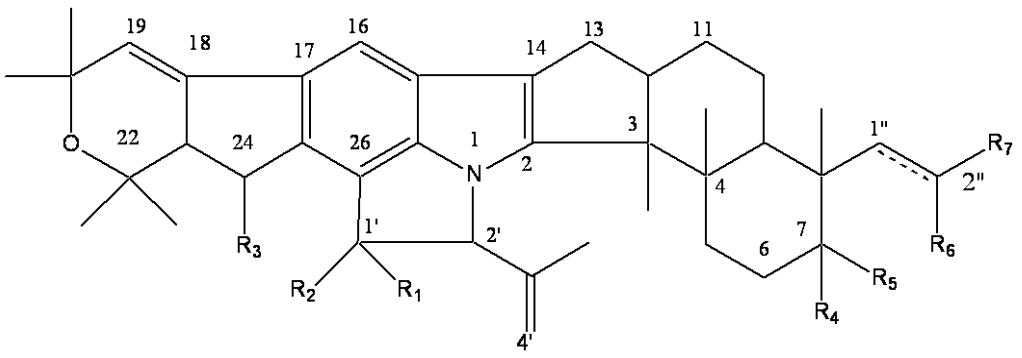
R^aは、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいアルキル、(3)任意に置換されていてもよいアルケニル、(4)任意に置換されていてもよいアルキニル、(5)任意に置換されていてもよいアルカノイル、(6)任意に置換されていてもよいアルケノイル、(7)任意に置換されていてもよいアルキノイル、(8)任意に置換されていてもよいアロイル、(9)任意に置換されていてもよいアリール、(10)任意に置換されていてもよいシクロアルカノイル、(11)任意に置換されていてもよいシクロアルケノイル、(12)任意に置換されていてもよいアルキルスルホニル、(13)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(14)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル、アルケノイル、アルキノイル、アロイル、アリール、シクロアルカノイル、シクロアルケノイル、アルキルスルホニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルの置換基は、ヒドロキシ、アルコキシ、シクロアルキル、アリールアルコキシ、NR^gR^h、CO_2R_b、$CONR^cR^d$及びハロゲン独立に選択される1～10個の基である）、(15)ペルフルオロアルキル、(16)任意に、アルキル、ペルフルオロアルキル、ニトロ、ハロゲン及びシアノから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよいアリールスルホニル、又は(17)酸素、イオウ及び窒素原子から選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5員又は6員ヘテロ環（任意に、アルキル、アルケニル、ペルフルオロアルキル、アミノ、$C(O)NR^cR^d$、シアノ、CO_2R^b及びハロゲンから独立に選択される1～4個の基で置換されていてもよく、かつ飽和されているか又は部分的に不飽和であってよい）であり；R^bは、(1)H、(2)任意に置換されていてもよいアリール、(3)任意に置換されていてもよいアルキル、(4)任意に置換されていてもよいアルケニル、(5)任意に置換されていてもよいアルキニル、(6)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(7)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、又は(8)酸素、イオウ及び窒素原子から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有する任意に置換されていてもよいヘテロ環（ここで、アリール、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロ環、又はアルキニルの置換基は、(i)ヒドロキシ、(ii)アルキル

、(iii)オキソ、(iv)$SO_2NR^gR^h$、(v)アリールアルコキシ、(vi)ヒドロキシアルキル、(vii)アルコキシ、(viii)ヒドロキシアルコキシ、(ix)アミノアルコキシ、(x)シアノ、(xi)メルカプト、(xii)アルキル-$S(O)_m$、(xiii)シクロアルキル（任意に、R^eから独立に選択される1～4個の基で置換されていてもよい）、(xiv)シクロアルケニル、(xv)ハロゲン、(xvi)アルカノイルオキシ、(xvii)$C(O)NR^gR^h$、(xviii)CO_2R^i、(xix)ホルミル、(xx)-NR^gR^h、(xxi)酸素、イオウ及び窒素原子から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有し、かつ任意に、R^eから独立に選択される1～5個の基で置換されていてもよい5員～9員ヘテロ環（飽和されているか又は部分的に不飽和であってよい）、(xxii)任意に置換されていてもよいアリール（ここで、アリール置換基は、1,2-メチレンジオキシであるか又はR^eから独立に選択される1～5個の基である）、(xxiii)任意に置換されていてもよいアリールアルコキシ（ここでアリール置換基は、1,2-メチレンジオキシであるか又はR^eから独立に選択される1～5個の基である）、及び(xxiv)ペルフルオロアルキルから独立に選択される1～10個の基である）であり；R^c及びR^dは、R^bから独立に選択され；或いはR^cとR^dが、それらが結合しているNと一緒に3員～10員環（O、$S(O)_m$、及びNから選択される0～2個のさらなるヘテロ原子を含有し、任意に、R^g、ヒドロキシ、チオキソ及びオキソから独立に選択される1～3個の置換基で置換されていてもよい）を形成し；R^eは、(1)ハロゲン、(2)アルキル、(3)ペルフルオロアルキル、(4)-$S(O)_mR^i$、(5) シアノ、(6)ニトロ、(7)$R_{10}(CH_2)v$-、(8)$R^iCO_2(CH_2)v$-、(9)$R^iOCO(CH_2)v$-、(10)任意に置換されていてもよいアリール（該置換基は、1～3個のハロゲン、アルキル、アルコキシ、又はヒドロキシである）、(11)$SO_2NR^gR^h$、又は(12)アミノであり；R^fは、(1)アルキル、(2)X-C_1-C_4アルキル（式中、Xな0又はS$(O)_m$である）、(3)アルケニル、(4)アルキニル、(5)ペルフルオロアルキル、(6)NY^1Y^2（式中、Y^1及びY^2は、独立にH又はアルキルである）、(7)ヒドロキシ、(8)ハロゲン、及び(9)アルカノイルアミノであり、R^g及びR^hは、独立に(1)水素、(2)任意にヒドロキシ、アミノ、又はCO_2R^iで置換されていてもよいアルキル(3)任意にハロゲン、1,2-メチレンジオキシ、アルコキシ、アルキル又はペルフルオロアルキルで置換されていてもよいアリール、(4)アリールアルキル（ここで、該アリールは、任意にペルフルオロアルキル又は1,2-メチレンジオキシで置換されていてもよい）；(5)アルコキシカルボニル、(6)アルカノイル、(7)アルカノイルアルキル、(9)アリールはアルコキシカルボニル、(10)アミノカルボニル、(11)モノアルキルアミノカルボニル、(12)ジアルキルアミノカルボニルであり；或いはR^gとR^hが、それらが結合しているNと一緒に3員～7員環（O、$S(O)_m$、及びNから選択される0～2個のさらなるヘテロ原子を含有し、任意に、R^e及びオキソから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）を形成し；R^iは、(1)水素、(2)ペルフルオロアルキル、(3)アルキル、(4)任意に置換されていてもよいアリール又はアリールアルキル（ここで、アリール置換基は、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、及びヒドロキシから独立に選択される1～3個の基である）であり；mは0～2であり；かつvは0～3である。

好ましい実施形態では、本発明は、下記式I'の化合物を含む製剤を提供する。

【０１０８】

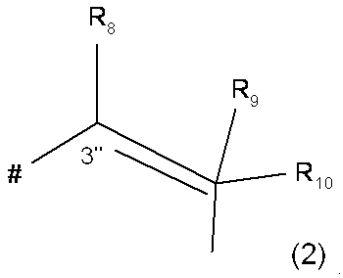
【化２２】



I'

【０１０９】
式中、
R_1は、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいアルキル、(3)任意に置換されていてもよいアルケニル、(4)任意に置換されていてもよいアルキニル、(5)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(6)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルの置換基は、(i)アルキル、(ii)X-C_1-C_6-アルキル（式中、Xは0又は$S(0)_m$である）、(iii)シクロアルキル、(iv)ヒドロキシ、(v)ハロゲン、(vi)シアノ、(vii)カルボキシ、及び(viii)NY^1Y^2（式中、Y^1及びY^2は、独立にH又はアルキルである）から独立に選択される1～3個の基である）、(7)アリール又はアリールアルキル（ここで、前記アリールは、任意に、R^fから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(8)ペルフルオロアルキル、(9)酸素、イオウ及び窒素原子から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5員又は6員ヘテロ環（任意に、ヒドロキシ、オキソ、アルキル及びハロゲンから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよく、かつ飽和しているか又は部分的に不飽和であってよい）であり、R_2、R_3、及びR_4は、独立にOR^a、OCO_2R^b、$OC(O)NR^cR^d$であり；或いはR_1とR_2が、=O、$=NOR^a$又は$=N-NR^cR^d$を表し；R_5及びR_6はHであり；或いはR_5とR_6が一緒に-O-を表し；R_7は、(1)CHO又は下記フラグメント(2)である。

【０１１０】
【化２３】



(2)

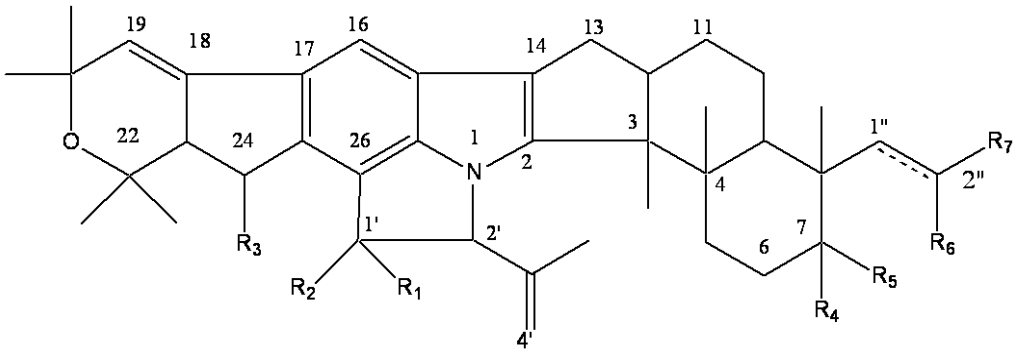
【０１１１】
式中、
#は、式I'の分子への結合を示し、R_8は、(1)H、(2)OH、又は(3)NH_2であり；R_9は、(1)H又は(2)OHであり；R_{10}は、(1)$C(O)OR^b$、(2)$C(O)N(OR^b)R^c$、(3)$C(O)NR^cR^d$、(4)$NHC(O)OR^b$、(5)$NHC(O)NR^cR^d$、(6)CH_2OR^a、(7)$CH_2OCO_2R^b$、(8)$CH_2OC(O)NR^cR^d$、(9)$C(O)NR^cNR^cR^d$、又は(10)$C(O)NR^cSO_2R^b$であり；R^aは、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいアルキル、(3)任意に置換されていてもよいアルケニル、(4)任意に置換されていてもよいアルキニル、(5)任意に置換されていてもよいアルカノイル、(6)任意に置換されていてもよいアルケノイル、(7)任意に置換されていてもよいアルキノイル、(8)任意に置換されていてもよいアロイル、(9)任意に置換されていてもよいアリール、(10)任意に置換されていてもよいシクロアルカノイル、(11)任意に置換されていてもよいシクロアルケノイル、(12)任意に置換されていてもよいアルキルスルホニル、(13)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(14)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル、アルケノイル、アルキノイル、アロイル、アリール、シクロアルカノイル、シクロアルケノイル、アルキルスルホニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルの置換基は、ヒドロキシ、アルコキシ、シクロアルキル、アリールアルコキシ、NR^gR^h、CO_2R^b、$CONR^cR^d$及びハロゲンから独立に選択される1～10個の基である）、(15)ペルフルオロアルキル、(16)アリールスルホニル（任意に、アルキル、ペルフルオロアルキル、ハロゲン及びシアノから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(17)酸素、イオウ及び窒素から選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5員又は6員ヘテロ環（任意に、アルキル、アルケニル、ペルフルオロアルキル、アミノ、$C(O)NR^cR^d$、シアノ、CO_2R^b及びハロゲンから独立に選択される1～4個の基置換されていてもよく、かつ飽和されているか又は部分的に不飽和であってよい）であり；R^bは、(1)H、(2)任意に置

換されていてもよいアリール、(3)任意に置換されていてもよいアルキル、(4)任意に置換されていてもよいアルケニル、(5)任意に置換されていてもよいアルキニル、(6)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(7)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、又は(8)酸素、イオウ及び窒素から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有する任意に置換されていてもよい5員～10員ヘテロ環（ここで、アリール、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロ環、又はアルキニルの置換基は、1～10個の基である (i)ヒドロキシ、(ii)C_1-C_3アルキル、(iii)オキソ、(iv)$SO_2NR^gR^h$、(v)アリールアルコキシ、(vi)ヒドロキシアルキル、(vii)アルコキシ、(viii)ヒドロキシアルコキシ、(ix)アミノアルコキシ、(x)シアノ、(xi)ペルフルオロアルキル、(xii)アルキル-$S(O)_m$、(xiii)シクロアルキル（任意に、R^eから独立に選択される1～4個の基で置換されていてもよい）、(xiv)シクロアルケニル、(xv)ハロゲン、(xvi)アルカノイルオキシ、(xvii)$C(O)NR^gR^h$、(xviii)CO_2R^i、(xix)任意に置換されていてもよいアリールアルコキシ（ここで、該アリール置換基は、1,2-メチレンジオキシであるか又はR^eから独立に選択される1～5個の基である）、(xx)-NR^gR^h、(xxi)酸素、イオウ及び窒素から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5員～6員ヘテロ環（飽和されているか又は部分的に不飽和であってよく、かつ任意に、R^eから独立に選択される1～5個の基で置換されていてもよい）、及び(xxii)任意に置換されていてもよいアリール（ここで、アリール置換基は、1,2-メチレンジオキシであるか又はR^eから独立に選択される1～5個の基である）であり；R^eは、(1)ハロゲン、(2)アルキル、(3)ペルフルオロアルキル、(4)-$S(O)_mR^i$、(5)シアノ、(6)アミノ、(7)$R^iO(CH_2)_v$-、(8)$R^iCO_2(CH_2)_v$-、(9)$R^iOCO(CH_2)_v$-、(10)任意に置換されていてもよいアリール（ここで、置換基は、1～3個のハロゲン、アルキル、アルコキシ、又はヒドロキシである）、又は(11)$SO_2NR^gR^h$であり；R^fは、(1)メチル、(2)X-C_1-C_2アルキル（式中、Xは0又は$S(O)_m$である）、(3)ハロゲン、(4)アセチルアミノ、(5)トリフルオロメチル、(6)NY^1Y^2（式中、Y^1及びY^2は、独立にH又はメチルである）、及び(7)ヒドロキシであり；R^g及びR^hは、独立に(1)水素、(2)アルキル（任意にヒドロキシ、アミノ、又はCO_2R^iで置換されていてもよい）、(3)アリール（任意にハロゲン、1,2-メチレンジオキシ、アルコキシ、アルキル又はペルフルオロアルキルで置換されていてもよい）、(4)アリールアルキル（ここで、アリールは、任意にペルフルオロアルキル又は1,2-メチレンジオキシで置換されていてもよい）；(5)アルコキシカルボニル、(6)アルカノイル、(7)ルカノイルアルキル、(9)アリールアルコキシカルボニル、(10)アミノカルボニル、(11)モノアルキルアミノカルボニル、(12)ジアルキルアミノカルボニルであり；或いはR^gとR^hが、それらが結合しているNと一緒に5員～6員環（0、$S(O)_m$、及びNから選択される0～2個のさらなるヘテロ原子を含有し、任意に、R^e及びオキソから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）を形成し；R^iは、(1)水素、(2)ペルフルオロアルキル、(3)アルキル、(4)任意に置換されていてもよいアリールアルキル（ここで、アリール置換基は、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、及びヒドロキシルから独立に選択される1～3個の基である）である。

別の好ましい実施形態では、本発明は、下記式I'の化合物を含む組成物を提供する。

【０１１２】

【化２４】



I'

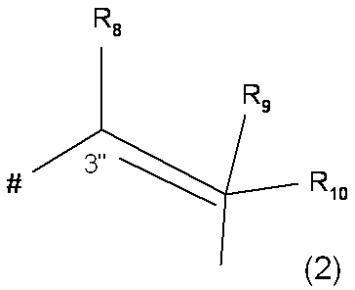
【０１１３】

式中、

R^1は、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいアルキル、(3)任意に置換されていてもよいアルケニル、(4)任意に置換されていてもよいアルキニル（ここで、アルキル、アルケニル、及びアルキニルの置換基は、(i)メチル、(ii)X-メチル（式中、Xは0又は$S(0)_m$である）及び(iii)ハロゲンから独立に選択される1～3個の基である）、(5) アリール又はアリールアルキル（ここで、前記アリールは、任意にR^fから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(6)トリフルオロメチルであり；R_2、R_3、及びR_4は独立にOR^a、OCO_2R^b、$OC(O)NR^cR^d$であり；或いはR_1とR_2が=O、$=NOR^a$又は$=N-NR^cR^d$を表し；R_5及びR_6はHであり；或いはR_5とR_6が一緒に-O-を表し；R_7は、(1)CHO又は下記フラグメント(2)である。

【０１１４】

【化２５】



(2)

【０１１５】

式中、

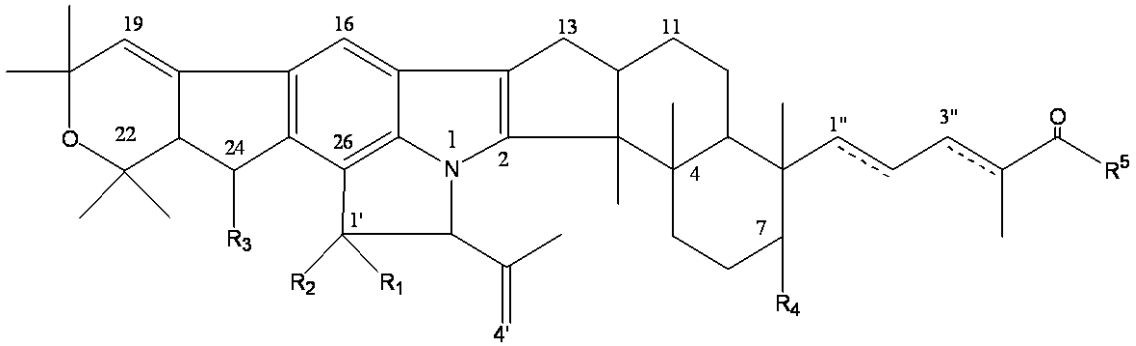
#は、式I'の分子への結合を示し；R_8は、(1)H、(2)OH、又は(3)NH_2であり；R_9は、(1)H、又は(2)OHであり；R_{10}は、(1)$C(O)OR^b$、(2)$C(O)N(OR^b)R^c$、(3)$C(O)NR^cR^d$、(4)$NHC(O)OR^b$、(5)$NHC(O)NR^cR^d$、(6)CH_2OR^a、(7)$CH_2OCO_2R^b$、(8)$CH_2OC(O)NR^cR^d$、(9)$C(O)NR^cNR^cR^d$、又は(10)$C(O)NR^cSO_2R^b$であり；R^aは、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいアルキル、(3)任意に置換されていてもよいアルケニル、(4)任意に置換されていてもよいアルキニル、(5)任意に置換されていてもよいアルカノイル、(6)任意に置換されていてもよいアロイル、(7)任意に置換されていてもよいシクロアルカノイル、(8)任意に置換されていてもよいシクロアルケノイル、(9)任意に置換されていてもよいアルキルスルホニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル、アロイル、シクロアルカノイル、シクロアルケノイル、及びアルキルスルホニルの置換基は、ヒドロキシ、アルコキシ、アリールアルコキシ、NR^gR^h、CO_2R^b、$CONR^cR^d$及びハロゲンから独立に選択される1～5個の基である）、(10)トリフルオロメチル、(11)アリールスルホニル（任意に、メチル、トリフルオロメチル及びハロゲンから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(12)酸素、イオウ及び窒素から選択される1～4個のヘテロ原子5員又は6員ヘテロ環（任意

に、メチル、トリフルオロメチル、C(O)NR^cR^d、CO_2R^b及びハロゲンから選択される1～4個の基で置換されていてもよく、かつ飽和されているか又は部分的に不飽和であってよい）であり；R_bは、(1)H、(2)任意に置換されていてもよいアリール、(3)任意に置換されていてもよいアルキル、(4)任意に置換されていてもよいアルケニル、(5)任意に置換されていてもよいアルキニル、(6)任意に置換されていてもよいシクロアルキル、(7)任意に置換されていてもよいシクロアルケニル、又は(8)酸素、イオウ及び窒素から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有する任意に置換されていてもよい5員又は6員ヘテロ環（ここで、アリール、アルキル、アルケニル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロ環、又はアルキニルの置換基は、(i)ヒドロキシ、(ii)アルキル、(iii)オキソ、(iv)$SO_2NR^gR^h$、(v)アリールアルコキシ、(vi)ヒドロキシアルキル、(vii)アルコキシ、(viii)ヒドロキシアルコキシ、(ix)アミノアルコキシ、(x)シアノ、(xi)アルキル-$S(O)_m$、(xii)任意にR^eから独立に選択される1～4個の基の置換されていてもよいシクロアルキル、(xiii)シクロアルケニル、(xiv)ハロゲン、(xv)アルカノイルオキシ、(xvi)C(O)NR^gR^h、(xvii)CO_2R^i、(xvii)-NR^gR^h、(xix)酸素、イオウ及び窒素から独立に選択される1～4個のヘテロ原子を含有する5員～6員ヘテロ環（飽和されているか又は部分的に不飽和であってよく、かつ任意に、R^eから独立に選択される1～5個の基で置換されていてもよい）、(xx)任意に置換されていてもよいアリール（ここで、アリール置換基は、1,2-メチレンジオキシであるか又はR^eから独立に選択される1～5個の基である）、(xxi)任意に置換されていてもよいアリールアルコキシ（ここで、アリール置換基は、1,2-メチレンジオキシであるか又はR^eから独立に選択される1～5個の基である）、及び(xxii)ペルフルオロアルキルから独立に選択される1～10個の基である）であり；R^eは、(1)ハロゲン、(2)アルキル、(3)ペルフルオロアルキル、(4)-$S(O)_mR^i$、(5)シアノ、(6)$R^iO(CH_2)_v$-、(7)$R^iCO2(CH_2)_v$-、(8)$R_{10}CO(CH_2)_v$-、(9)任意に置換されていてもよいアリール（ここで、アリール置換基は、1～3個のハロゲン、アルキル、アルコキシ、又はヒドロキシである）、(10)$SO_2NR^gR^h$、又は(11)アミノであり；R^fは、(1)メチル、(2)X-C_1-C_2アルキル（式中、Xは0又は$S(O)_m$である）、(3)トリフルオロメチル、(4)NY^1Y^2（式中、Y^1及びY^2は、独立にH又はメチルである）、(5)ヒドロキシ、(6)ハロゲン、及び(7)アセチルアミノであり；R^g及びR^hは、独立に(1)水素、(2)アルキル（任意にヒドロキシ、アミノ、又はCO_2R^iで置換されていてもよい）、(3)アリール（任意にハロゲン、1,2-メチレンジオキシ、アルコキシ、アルキル又はペルフルオロアルキルで置換されていてもよい）(4)アリールアルキル（ここで、該アリールは、任意にペルフルオロアルキル又は1,2-メチレンジオキシで置換されていてもよい）；(5)アルコキシカルボニル、(6)アルカノイル、(7)アルカノイルアルキル、(9)アリールアルコキシカルボニル、(10)アミノカルボニル、(11)モノアルキルアミノカルボニル、(12)ジアルキルアミノカルボニルであり；或いはR^gとR^hが、それらが結合しているNと一緒に5員～6員環（O、$S(O)_m$、及びNから選択される0～2個のさらなるヘテロ原子を含有し、任意に、R^e及びオキソから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）を形成し；R^iは、(1)水素、(2)ペルフルオロアルキル、(3)アルキル、(4)任意に置換されていてもよいアリール又はアリールアルキル（ここで、アリール置換基は、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、及びヒドロキシから独立に選択される1～3個の基である）であり；かつ全ての他の可変記号は、上記式I'の定義通りである。

最も特に好ましくは、組成物が下記式の化合物である、ノズリスポリン酸誘導体のノズリスポラミド(nodulisporamide)；又はその薬学的に許容できる塩を含む製剤である。

【０１１６】

【化２６】



【０１１７】

式中、

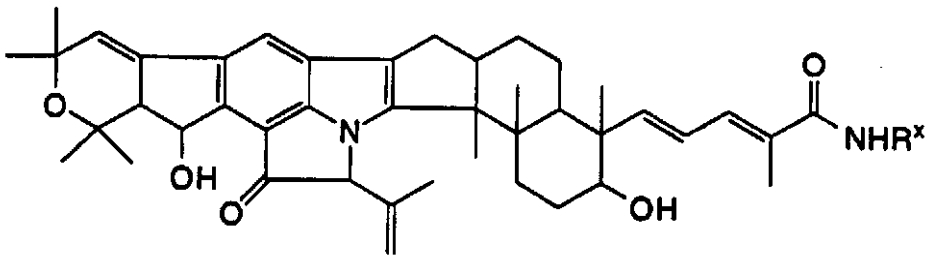
R_1は、水素、任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルキル、任意に置換されていてもよいC_2-C_{10}アルケニル、任意に置換されていてもよいC_2-C_{10}アルキニル、任意に置換されていてもよいC_3-C_8シクロアルキル、任意に置換されていてもよいC_5-C_8シクロアルケニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルの置換基は、C_1-C_5アルキル、C_1-C_{10}アルコキシ、C_1-C_{10}アルキルチオ、C_1-C_{10}アルキルスルホニル、C_3-C_8シクロアルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、シアノ、カルボキシ、アミノ、C_1-C_{10}モノアルキルアミノ、C_1-C_{10}ジアルキルアミノ、C_1-C_{10}アルカノイルアミノ及びベンゾイルアミノ（ここで、前記ベンゾイルは、任意に、C_1-C_4アルキル、C_1-C_4アルコキシ、C_1-C_4アルキルチオ、C_2-C_4アルケニル、C_2-C_4アルキニル、C_1-C_3-ペルフルオロアルキル、アミノ、ヒドロキシ、ハロゲン、C_1-C_5モノアルキルアミノ、C_1-C_5ジアルキルアミノ及びC_1-C_5アルカノイルアミノから独立選択される1～3個の基で置換されていてもよい）から独立に選択される1～3個の基である）、(7)フェニルC_0-C_5アルキル（ここで、前記フェニルは、任意に、C_1-C_4アルキル、C_1-C_4アルコキシ、C_1-C_4アルキルチオ、C_2-C_4アルケニル、C_2-C_4アルキニル、C_1-C_3ペルフルオロアルキル、アミノ、ヒドロキシ、カルボキシ、ハロゲン、C_1-C_5モノアルキルアミノ、C_1-C_5ジアルキルアミノ及びC_1-C_5アルカノイルアミノから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(8)C_1-C_5ペルフルオロアルキル、(9)モルフォリノ、ピリジル及びピペラジノから選択される5員又は6員環（任意に、ヒドロキシ、オキソ、C_1-C_{10}アルキル及びハロゲンから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）であり；R^2、R^3、及びR^4は、独立にOR^a、OCO_2R^b、$OC(O)NR^cR^d$であり；或いはR^1とR^2が一緒に=O、$=NOR^a$又は$=N\text{-}NR^cR^d$を表し；R^5はNR^cR^dであり；R^aは、(1)水素、(2)任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルキル、(3)任意に置換されていてもよいC_3-C_{10}アルケニル、(4)任意に置換されていてもよいC_3-C_{10}アルキニル、(5)任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルカノイル、(6)任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルケノイル、(7)任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルキノイル、(8)任意に置換されていてもよいベンゾイル、(9)任意に置換されていてもよいフェニル、(10)任意に置換されていてもよいC_1-C_7シクロアルカノイル、(11)任意に置換されていてもよいC_4-C_7シクロアルケノイル、(12)任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルキルスルホニル、(13)任意に置換されていてもよいC_3-C_8シクロアルキル、(14)任意に置換されていてもよいC_5-C_8シクロアルケニル（ここで、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルカノイル、アルケノイル、アルキノイル、ベンゾイル、フェニル、シクロアルカノイル、シクロアルケノイル、アルキルスルホニル、シクロアルキル及びシクロアルケニルの置換基は、ヒドロキシ、C_1-C_6アルコキシ、C_3-C_7シクロアルキル、アリールC_1-C_3アルコキシ、NR^g R^h、CO_2R^b、$CONR^cR^d$及びハロゲンから独立に選択される1～5個の基である）、(15)C_1-C_5ペルフルオロアルキル、(16)フェニルスルホニル（任意に、C_1-C_5アルキル、C_1-C_5ペルフルオロアルキル、ニトロ、ハロゲン又はシアノから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）、(17)ピペリジノ、モルフォリノ、ピリジル及びピペラジノから選択される5員又は6員環（任意に、C_1-C_5アルキル、C_1-C_5アルケニル、C_1-C_5ペルフルオロアルキル、アミノ、$C(O)R^cR^d$、シアノ、CO_2R^b又はハロゲンから独立に選択される1～4個の基で置換されていてもよ

い）であり；R^bは、(1)H、(2)任意に置換されていてもよいフェニル、(3)任意に置換されていてもよいC_1-C_{10}アルキル、(4)任意に置換されていてもよいC_3-C_{10}アルケニル、又は(5)任意に置換されていてもよいC_3-C_{10}アルキニル（ここで、フェニル、アルキル、アルケニル又はアルキニルの置換基は、ヒドロキシ、C_1-C_6アルコキシ、C_3-C_7シクロアルキル、ハロゲン、C_1-C_5アルカノイルオキシ、C(O)NR^cR^d、CO_2R^b、ホルミル、-NR^gR^h、任意に置換されていてもよいフェニル、及び任意に置換されていてもよいフェニルC_1-C_3アルコキシ（ここで、該フェニル置換基は、R^eから独立に選択される1～3個の基である）から独立に選択される1～5個の基である）であり；R^c及びR^dは、独立にR^bであり；或いはR^cとR^dが、それらが結合しているNと一緒にピペリジノ、モルフォリノ又はピペラジノ（任意に、R^g及びオキソから独立に選択される1～3個の基で置換されていてもよい）を形成し；R^eは、(1)ハロゲン、(2)C_1-C_7アルキル、(3)C_1-C_3ペルフルオロアルキル、(4)-$S(O)_mR^i$、(5)シアノ、(6)ニトロ、(7)$R^jO(CH_2)_v$-、(8)$R^jCO_2(CH_2)_v$-、(9)$R^jOCO(CH_2)_v$-、(10)任意に置換されていてもよいフェニル（ここで、該置換基は、1～3個のハロゲン、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、又はヒドロキシである）であり；vは0～3であり；R^g及びR^hは独立に(1)水素、(2)C_1-C_6アルキル、(3)アリール、(4)アリールC_1-C_6アルキル、(5)C_1-C_5アルコキシカルボニル、(6)C_1-C_5アルキルカルボニル、又は(7)C_1-C_5アルカノイルC_1-C_5アルキルであり；或いはR^gとR^hが、それらが結合しているNと一緒にピペリジノ、モルフォリノ又はピペラジノ（任意に、R^g及びオキソから独立に選択される1～3個の基置換されていてもよい）を形成し；R^i及びR^jは独立に(1)水素、(2)C_1-C_3ペルフルオロアルキル、(3)任意に置換されていてもよいC_1-C_6アルキル（ここで、該置換基はアリール又は置換フェニルである）；(4)フェニル又は置換フェニル（ここで、該置換基は、ハロゲン、C_1-C_6アルキル、C_1-C_6アルコキシ、又はヒドロキシから独立に選択される1～3個の基である）であり；mは0～2である。

最も特に好ましくは、下記式：

【０１１８】

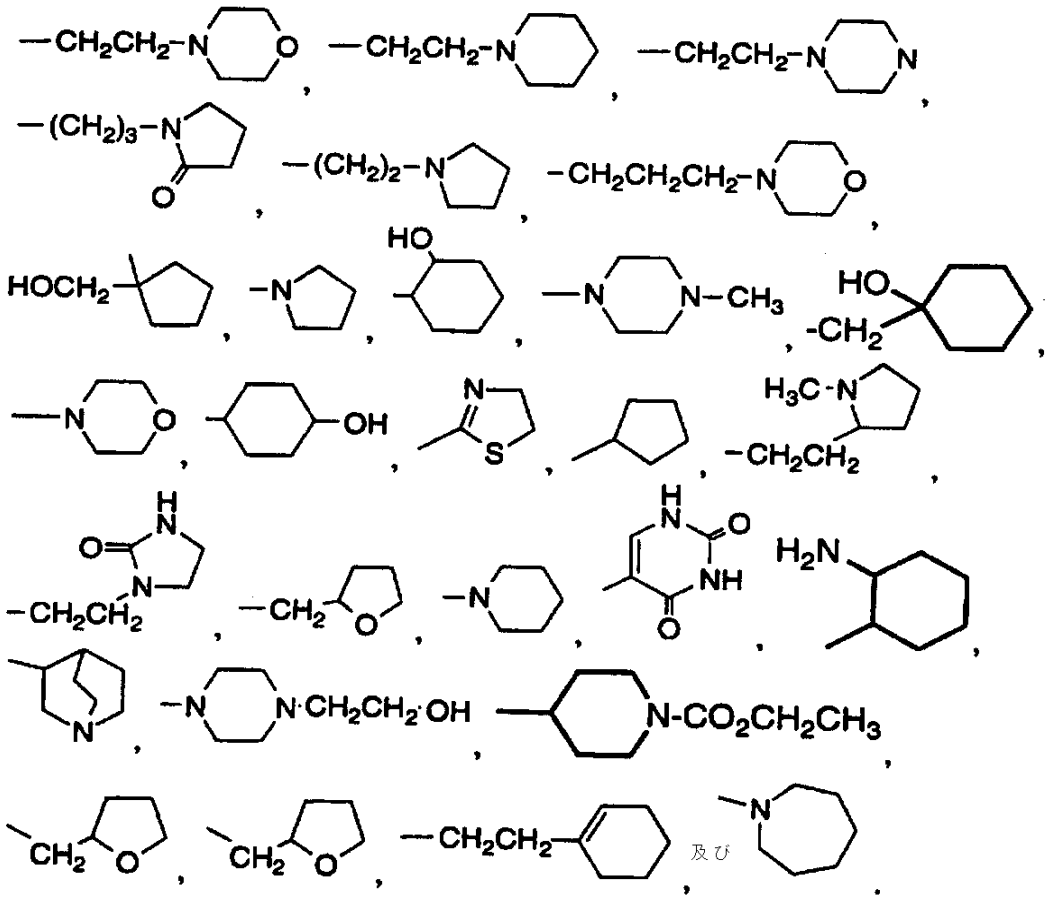
【化２７】



【０１１９】

（式中、R^xは、H、CH_3、CH_2CH_3、$C(CH_3)_3$、$CH_2CH_2CH_3$、CH_2CH_2OH、$CH(CO_2CH_3)CH_2OH$、$CH_2CO_2CH_3$、$CH_2CH(OCH_2CH_3)_2$、$CH_2CH_2OCH_2CH_2OH$、$CH(CH_3)(CH_2)_3C(CH_3)_2OH$、$(CH_2)_3OH$、$(CH_2)_4OH$、$(CH_2)SOH$、$CH(CH_2OH)CH_2CH_3$、$NHC(CH_3)_3$、$CH_2CN$、$(CH_2)_6OH$、$CH_2CH(OH)CH_3$、$CH(CH_2OH)CH_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2SCH_3$、$CH_2CH_2SCH_2CH_3$、$CH_2CONH$、$CH(CH_3)(CH_2OH)_2$、$CH_2CH_2NHCH_2CH_2OH$、$CH(CH_2OH)(CH_2)_3CH_3$、$CH(CH_2OCH_3)CH_3$、$(CH_2)_2SH$、$(CH_2)_4NH_2$、$CH_2CH_2SO_2CH_3$、$CH_2CH_2S(O)CH_3$、$CH(CH(CH_3)_2)CH_2OH$、$(CH_2)_3NH_2$、$(CH_2)_3N(CH_2CH_3)_2$、$(CH_2)_3N(CH_3)_2$、$OCH_2CH_3$、$CH_2CH(OH)CH_2OH$、$OCH_3$、$CH_2CH_2OCH_3$、$CH_2CH_2NHC(O)CH_3$、$C(CH_3)_2CH_2OH$、c-$C_3H_5$、c-$C_6H_{11}$、$(CH_2)_3OCH_2CH_3$、$CH_2CH{\equiv}CH_2$、$C(CH_2CH_3)(CH_2OH)_2$、$CH_2C{\equiv}CH$、$CH_2CO_2CH_2CH_3$、$CH_2CH_2F$、$(CH_2)_3OCH_2)_{11}CH_3$、$CH_2CH_2N(CH_3)_2$、$CH_2CH_2OCH_2CH_2NH_2$、$CH_2CF_3$、$NHCH_2CO_2CH_2CH_3$、$CH(CH_3)CO_2CH_3$、$C(CH_3)_2CH_2C(O)CH_3$、$CH(CO_2CH_2CH_3)_2$、$CH_2CH_3$、$CH(CH_2CH_2CH_3)CO_2CH_3$、$CH_2CH_2CH_2OCH_3$、$C(CH_3)_2C{\equiv}CH$、$(CH_2)_4CH_3$、$CH(CH_2CH_2CH_3)_2$、$(CH_2)_5CH_3$,$CH_2CH_2CO_2H$、$CH(CH(CH_3)_2)CO_2CH_3$、$OCH_2CO_2H$、$CH(CH(CH_3)_2)CH_2OH$、$CH(CH(CH_3)_2)CH_2OH$、$CH(CH_3)CH_2OH$、$CH(CH_3)CH_2OH$、$CH(CH_3)_2$、$C(CH_3)_3$、$(CH_2)CH(CH_3)_2$、$CH(CH_3)CH_2CH_3$、$CH_2CH(CH_3)OH$、$(CH_2)_3CH_3$、$(CH_2)_2OCH_2CH_3$、1-アダマンチル、$(CH_2)_8CH_3$、$CH(CH_3)CH(CH_3)_2$、$(CH_2)_3NHCH_3$、$(CH_2)_2N(CH_2CH_3)_2$、

【０１２０】
【化２８】



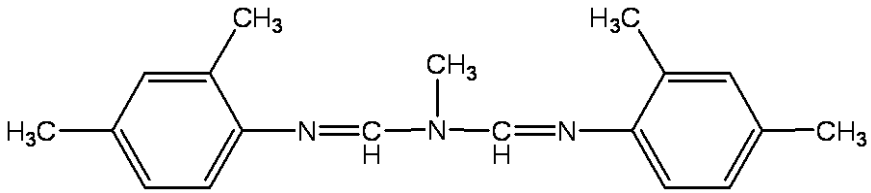
【０１２１】
から成る群より選択される）
の化合物を含む組成物である。

発明使用のための組成物に特に好ましいノズリスポラミド化合物は、R^Xがt-ブチルを有するもの(又は「ノズリスポラミド」)である。

本発明の別の実施形態では、式Iの化合物をホルムアミド化合物と併用投与してよい。ホルムアミド分類の化合物としては、限定するものではないが、アミトラズ剤(amitraz)(Mitaban(登録商標)、Pfizer；Point-Guard(登録商標)、Intervet；Preventic(登録商標)、Virbac；Taktic(登録商標)、Intervet)、クロロジメホルム、クロロメブホルム、ホルメタナート及びホルムパラナートが挙げられる。アミトラズ剤は、殺ダニ剤として及びマダニ類を防除するために有用であると認められているホルムアミドファミリーの周知な殺ダニ剤(acaracide)／殺虫剤である。Plumb’s Veterinary Drug Handbook (Fifth Edition), ed. Donald C. Plumb, Blackwell Publishing, pg. 34, (2005)を参照されたい。ホルムアミドファミリーの殺虫剤は、特徴的な-N=CR-NR’-部分で区別される。アミトラズ剤は、化合物中に該成分が2つある点でホルムアミドファミリーの他のメンバーと異なる。アミトラズ剤は、下記構造を有する。

【０１２２】

【化２９】

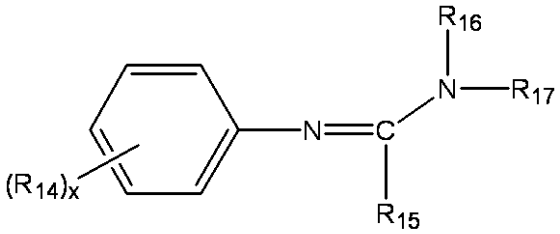


【０１２３】

一実施形態では、式Iの化合物を下記式(3)の1種以上のホルムアミド化合物と併用投与する。

【０１２４】

【化３０】



(3)

【０１２５】

式中：

Xは0～5の整数であり；

R_{14}は、アルキル、ハロゲン又は-OC(=O)NR_aR_b（式中、R_a及びR_bは独立に水素又はアルキルである）であり；

ここで、R_a及びR_bは独立に水素又はアルキルであり；

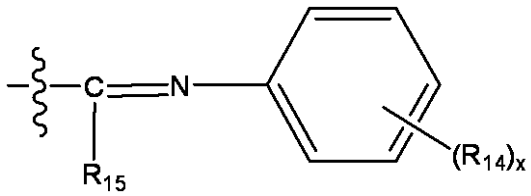
R_{15}は水素又はアルキルであり；

R_{16}は水素又はアルキルであり；

R_{17}isは水素、アルキル又は下記基である。

【０１２６】

【化３１】



【０１２７】

式Iの化合物と併用投与し得る他分類の化合物としては、限定するものではないが、2-アシル-4-オキソ-ピラジノ-イソキノリン誘導体、例えばプラジカンテル又は1,4,5,6-テトラヒドロ-2-[2-置換]ビニルピリミジン及び2-[(2-置換)ビニル]-2-イミダゾリン、例えばピランテル(参照によってここに援用する米国特許第3,502,661号を参照されたい)が挙げられる。

式Iの殺寄生虫剤と追加殺寄生虫剤の質量比は、約5/1～約20,000/1であってよい。

本発明の殺寄生虫剤と関連する内部及び外部寄生虫に効く殺寄生虫剤(endectocidal parasiticide)は、例えば、ミクロスフェア、顆粒又は移植片のような制御放出及び徐放性製剤に含めてよい。これは、例えば、外部寄生虫の制御放出製剤、例えばフィプロニル、及び／又はエンデクトシド(endectocide)、例えばイベルメクチンを適切なビヒクル、例えば水、油若しくは中鎖トリグリセリド中で混合することによって得られる。

該制御放出製剤では、好ましくは5～100mg/kg/日、例えば45mg/kg/日の式Iの化合物及

び0.01～15mg/kg/日の殺外部寄生虫剤、例えばフィプロニル、又は例えば、0.5mg/kg/日のエンデクトシド、例えばイベルメクチンを放出するように製剤を調製する。

該制御放出製剤の場合、動物の非常に長い持続期間の処置のための用量は、好ましくは式Iの化合物及び1～20mg/kgのフィプロニル又は2mg/kg～3mg/kgのエンデクトシド、特にイベルメクチンを含むであろう。

本発明の好ましい実施形態では、式Iの化合物を含む組成物を経皮／局所適用する。

さらに好ましい実施形態では、化合物含有造形品、例えば首輪、大型メダル、耳標、体の一部を固定するためのバンド、並びに接着性ストリップ及びホイルの形態で局所適用を行う。

一般に、3週間の間に、総量で10mg/kg～300mg/kg、好ましくは20mg/kg～200mg/kg、最も好ましくは25mg/kg～160mg/kg(処置動物の体重)の式Iの化合物を放出する固体製剤を適用するのが好ましい。

造形品の調製のためには、熱可塑性及び可撓性プラスチック並びにエラストマー及び熱可塑性エラストマーを使用する。適切なプラスチック及びエラストマーは、式Iの化合物と十分に適合性のポリビニル樹脂、ポリウレタン、ポリアクリラート、エポキシ樹脂、セルロール、セルロール誘導体、ポリアミド及びポリエステルである。プラスチック及びエラストマーの詳細リスト並びに造形品の調製手順は、例えばWO 03/086075に与えられている。

【実施例】

【０１２８】

以下の合成例及び生物学的例はこの発明を説明するためのものであり、如何なる場合にも本発明の範囲を制限するものと解釈すべきでない。

（実施例）

本発明を以下の実施例でさらに詳細に説明する。

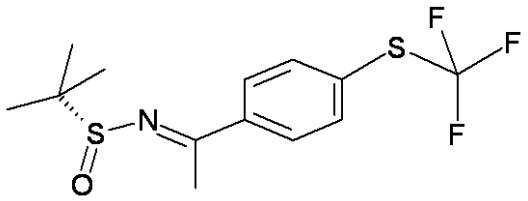
S.　合成例

S.1　(5-クロロ-チエノ[2,3-d]ピリミジン-4-イル)-[(S)-1-(4-トリフルオロメチルスルファニル-フェニル)-エチル]-アミン(化合物C.3-S)の合成

工程1：2-メチル-プロパン-2-(R)-スルフィン酸[1-(4-トリフルオロメチルスルファニル-フェニル)-エチリデン]-アミド(S.1)の合成

【０１２９】

【化３２】



(S.1)

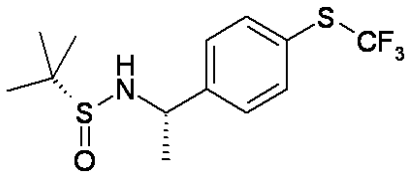
【０１３０】

5.44g(24.7mmol)の4-(トリフルオロメチルチオ)-アセトフェノンを100mlのTHFに溶解させた後、9.33ml(9.40g;41.2mmol)の$Ti(OEt)_4$を添加した。2.50g(20.6mmol)の(R)-(+)-2-メチル-2-プロパンスルフィンアミドを少しずつ添加した。混合物を65℃で16時間撹拌した。室温に冷まして、溶媒を除去し、残留物に酢酸エチルを添加した。水を慎重に添加した。沈殿物をろ過で除去し、酢酸エチルで徹底的に洗浄した。沈殿物を捨てた。ろ液については、層を分け、水層を酢酸エチルで2回抽出した。混ぜ合わせた有機層をNa_2SO_4上で乾燥させ、溶媒を除去して約7gの粗生成物を得た。粗生成物をシリカ(シクロヘキサン/酢酸エチル)上で精製して約4.9gの所望生成物を得た。

工程2：2-メチル-プロパン-2-(R)-スルフィン酸[(S)-1-(4-トリフルオロメチルスルファニル-フェニル)-エチル]-アミド(S.1)

【０１３１】

【化３３】



(S.2)

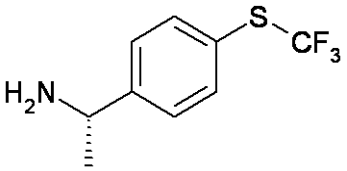
【０１３２】

5.6g(17.3mmol)(4a)を60mlのTHFに溶解させて0℃に冷却した。THF中のL-セレクトリド(selectride)の1.0M溶液52mlをゆっくり添加した。この温度で30分間撹拌を続けた。混合物を室温に戻して撹拌を2時間続けた。

工程3：(S)-1-(4-トリフルオロメチルスルファニル-フェニル)-エチルアミン(S.3)

【０１３３】

【化３４】



(S.3)

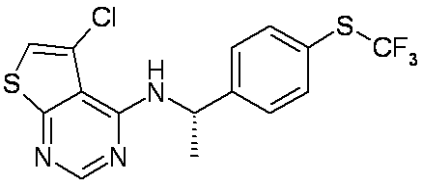
【０１３４】

3.50g(10.8mmol)(S.2)を40mlのメタノールに溶かし、注射器により10℃で5.4ml(21.6mmol)の4N HCl溶液を10℃で加えた。冷却浴を除去し、室温で2時間撹拌を続けた。溶媒を除去し、水を加えた。溶液をジクロロメタンで2回抽出した。水層にNa_2CO_3溶液を添加して塩基性pHを調整し、水層をジクロロメタンで3回抽出した。有機層を混ぜ合わせてNa_2SO_4上で乾燥させた。溶媒を除去して2.27gの無色油を得た。エナンチオマー分析は、(S)-エナンチオマーが優勢にエナンチオマー比>99：<1を示した。

工程4：(5-クロロ-チエノ[2,3-d]ピリミジン-4-イル)-[(S)-1-(4-トリフルオロメチル-スルファニル-フェニル)-エチル]-アミン(化合物C.3-S)の合成

【０１３５】

【化３５】



【０１３６】

2.07g(10.1mmol)の4,4-ジクロロ-チエノ-[2,3-d]-ピリミジン、0.94gのトリエチルアミン(9.2mmol)及び155mg(0.42mmol)のテトラブチルアンモニウムヨージドを100mlのトルエン中で混合した。1.85g(8.4mmol)(S.3)を加えて混合物を加熱して15時間還流させた。室温に冷まして、溶媒を除去し、残留物に水を加えた。水層をジクロロメタンで3回抽出した。混ぜ合わせた有機層を1N HCl及び水で連続的に洗浄し、Na_2SO_4上で乾燥させた。溶媒を除去し、残留物をシリカ(シクロヘキサン/酢酸エチル)上で精製して2.37gの化合物C.3-Sを得た。

本発明の式Iの他の化合物は、合成例で上述したのと同様に調製可能である。

C. 化合物例

本発明の方法で使うのに好ましいいくつかの例を下表Cでそれらの物理的データによって特徴づける。

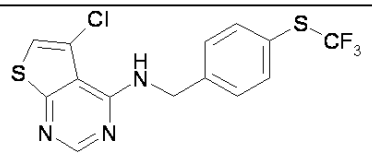
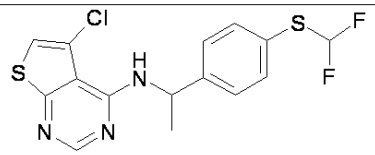
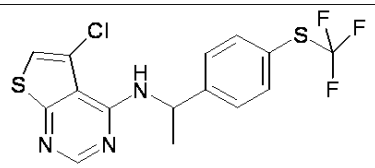
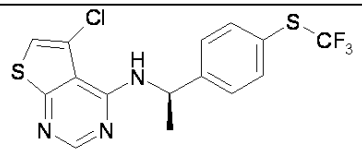
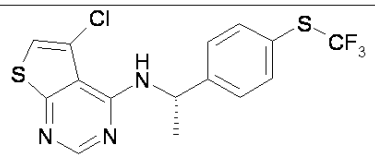
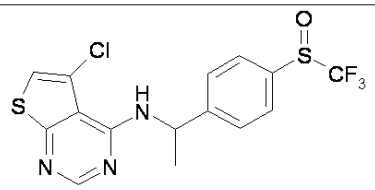
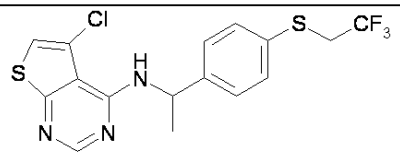
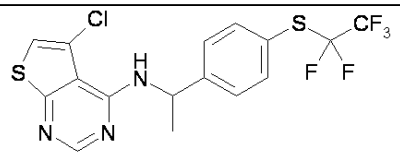
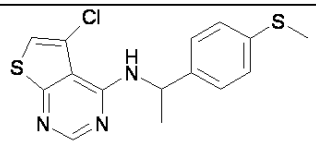
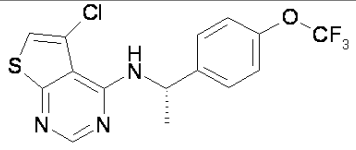
例えば連動型高速液体クロマトグラフィー／質量分析(HPLC/MS)又はそれらの融点で化合物を特徴づけた。

分析用HPLCカラム：RP-18カラムChromolith Speed ROD(Merck KgaA, Germany)。溶出：アセトニトリル+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)／水+0.1%トリフルオロ酢酸(TFA)（比率5:95→95:5で5分間40℃で）。

【０１３７】

表C：

【化３６】

化合物 実施例番号	構造	物理-化学データ： HPLC-MS：t_r[分]；m/z又は m_p=融点[℃]
C.1		t_r = 3.871分 m/z: 376.05 g/mol
C.2		t_r = 3.659分 m/z: 371.70 g/mol
C.3		t_r = 4.231分 m/z: 390.05 g/mol
C.3-R		t_r = 4.231分 m/z: 390.05 g/mol
C.3-S		t_r = 4.231分 m/z: 390.05 g/mol
C.4		t_r = 3.283分 m/z: 405.60 g/mol
C.5		t_r = 3.955分 m/z: 404.15 g/mol
C.6		t_r = 4.295分 m/z ： 439.60 g/mol
比較例 CE.1		t_r = 3.858分 m/z ： 335.80 g/mol
比較例CE.2		m_p = 79-80℃

【０１３８】

B.　害虫に対する作用の生物学的実施例

特に断りがなければ、一般的条件下で、ほとんどの試験溶液を以下のように調製する：

1:1(vol:vol)の蒸留水：アセトンの混合物に所望濃度で活性化合物を溶解させる。使用日に試験溶液を調製する。

一般に1000ppm、500ppm、300ppm、100ppm及び30ppm(wt/vol)の濃度で試験溶液を調製する。

B.1 ササゲ・アブラムシ(Cowpea aphid)(マメアブラムシ(アフィス・クラッチヴォラ(aphis craccivora))

種々の段階の約100～150匹のアブラムシによってコロニー形成された鉢植えササゲ植物に、害虫個体数を記録した後に噴霧した。24、72、及び120時間後に個体数の減少を評価した。

この試験では、化合物C.1、C.2、C.3、C.4、C.5及びC.6は、300ppmで未処置コントロールに比べて80%を超える死亡率を示した。

B.2 ハダニ(Spider Mite)テトラニクス種(Tetranychus spp.)

接触／経口活性：

種々の段階の約50匹のダニによってコロニー形成された鉢植えワタ植物に、害虫個体数を記録した後に噴霧する。24、72、及び120時間後に個体数の減少(又は増加)を評価する。

この試験では、化合物C.3及びC.6は、300ppmで未処置コントロールに比べて80%を超える死亡率を示した。

B.3 トビイロウンカ(Rice brown plant hopper)ニラパルバタ・ルゲンス(Nilaparvata lugens)

イネ苗をきれいにして噴霧24時間前に洗浄した。50:50のアセトン:水(vol:vol)に活性化合物を配合して0.1%vol/volの界面活性剤(EL 620)を添加した。鉢植えイネ苗に5mlの試験溶液を噴霧し、空気乾燥させ、ケージに入れ、10匹の成虫を接種した。処置したイネ植物を約28～29℃及び約50～60%の相対湿度で維持した。72時間後に死亡率を記録した。

この試験では、化合物C.3及びC.6は、300ppmで未処置コントロールに比べて80%を超える死亡率を示した。

B.4. 黄熱病蚊(Yellow fever mosquito)アエデス・アエギプチ(Aedes aegypti)に対する活性

100%DMSOに化合物を配合し、180ulの1X Luria Broth培地と10匹のアエデス・アエギプチ(A. aegypti)の新生幼虫を含有するマイクロタイタープレート内で試験した。DMSOのみを含有するコントロールウェルの平均運動性と比較した幼虫の運動性に基づいて化合物の効力を決定した。10ppmの濃度で運動性の減少が>80%の化合物を用量反応アッセイで試験してEC50値を決定した。

この試験では、化合物C.1、C.2、C.3、C.4、C.5及びC.6は<1ppmのEC50値を示した。

【０１３９】

B.5. ラット殺外部寄生虫剤モデルにおける活性

ラットに50匹のクテノセファリデス・フェリス(Ctenocephalides felis)ノミを寄生させた。約24時間後にラット(3匹／群)を試験化合物で20mg/kg又は10mg/kg(体重)の用量にて局所処置した。各研究でプラセボ(ビヒクル)群及びポジティブコントロール群を含めた。処置48時間後に、ノミ取り櫛を用いて各ラットからノミを収集した。下記式を用いて処置群毎のパーセント効力を計算した。

%効力=100x(C-T)/C

式中、Cは、プラセボ群で記録された生きているノミ数の幾何平均であり、Tは、それぞれの処置群で記録された生きているノミ数の幾何平均である。

化合物C.3-Sは、20mg/kg及び10mg/kgの用量でそれぞれ平均89%及び71%だけノミ数を減少させた(n=2[レプリカ数])。

CB. 生物学的比較例

本発明の化合物は、驚くべきことに、例えばWO2006/047397で開示されている比較例CE.2(当該明細書では化合物番号42)及びWO2007/135029で開示されている比較例CE.2(当該明細書では化合物C.2)に比べて予想外に高い生物学的活性を示した。

【０１４０】

表CB.1.1　比較化合物CE.1の活性

生物	濃度 [ppm]	化合物例C.3 活性[%]	化合物例CE.1 活性[%]
ニラパルバタ・ルゲンス	300	100	0
ハダニ	300	90	n.a.*

*化合物CE.1は、500ppmで50%の活性を示した。

【０１４１】

表CB.1.2　比較化合物CE.2の活性

生物	濃度 [ppm]	化合物例C.3 活性[%]	化合物例CE.2 活性[%]
ハダニ	300	90	50

【０１４２】

CB.2　生物学的比較試験2：

本発明の化合物では、S-エナンチオマーについて、また当該技術分野における立体異性体化合物(例えばWO2007/135029で開示されている化合物例CE.2(当該明細書では化合物C.2))と比較してもさらに高い生物学的活性を実証できるであろう。

【０１４３】

表CB.2.1　異なる立体異性体の活性

生物	濃度 [ppm]	化合物例3の立体異性体 活性[%]		
		C.3	C.3-R	C.3-S
ニラパルバタ・ルゲンス	300	100	0	100
ハダニ	300	90	0	90
ササゲアブラムシ (Cow pea aphid)	300	100	0	100
アエデス・アエギプチ	EC_{50}	1[ppm]での活性		
		C.3	C.3-R	C.3-S
	EC50	0.29	0	0.21

【０１４４】

表CB.2.2　立体異性比較化合物CE.2の活性

生物	濃度 [ppm]	化合物例C.3-S 活性[%]	比較例CE.2 活性[%]
ハダニ	300	90	50
クテノセファリデス・フェリス	用量 [mg/kg]	効力[%]	
	10	71	70
	20	89	82

フロントページの続き

(74)代理人 100123777
弁理士 市川 さつき
(74)代理人 100137626
弁理士 田代 玄
(72)発明者 ソル マーク デビッド
アメリカ合衆国 ジョージア州 ３０００５ アルファレッタ ニューポート ショア ６０５
(72)発明者 メン チャールズ キュー
アメリカ合衆国 ジョージア州 ３００９７ ジョンズ クリーク ベルクレスト ドライブ ７１５８
(72)発明者 ポールマン マティアス
ドイツ連邦共和国 ６７２５１ フラインスハイム アム ランゲンシュタイン １３
(72)発明者 バウマン アーンスト
ドイツ連邦共和国 ６７３７３ ドゥーデンホーフェン ファルケンシュトラーセ ６アー
(72)発明者 パウリーニ ラルフ
ドイツ連邦共和国 ６７０９８ バート デュルクハイム イム ノンネンガルテン ５７

審査官 天野 皓己

(56)参考文献 特開平０３－２７５６７５（ＪＰ，Ａ）
国際公開第２００７／１３５０２９（WO，Ａ１）
特表２００８－５１７９３６（ＪＰ，Ａ）

(58)調査した分野(Int.Cl.，ＤＢ名)
Ｃ０７Ｄ ４９５／０４
Ａ０１Ｎ ４３／９０
Ａ０１Ｐ ７／０２
Ａ０１Ｐ ７／０４
ＣＡｐｌｕｓ／ＲＥＧＩＳＴＲＹ（ＳＴＮ）