

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2017-510550

(P2017-510550A)

(43) 公表日 平成29年4月13日 (2017.4.13)

(51) Int. Cl.	F I	テーマコード (参考)
C 0 7 D 403/12 (2006.01)	C O 7 D 403/12 C S P	4 C O 6 3
A 6 1 K 31/501 (2006.01)	A 6 1 K 31/501	4 C O 8 6
A 6 1 P 33/14 (2006.01)	A 6 1 P 33/14	4 H O 1 1
A O 1 P 7/02 (2006.01)	A O 1 P 7/02	
A O 1 P 7/04 (2006.01)	A O 1 P 7/04	
審査請求 未請求 予備審査請求 未請求 (全 91 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号	特願2016-549280 (P2016-549280)	(71) 出願人	508020155
(86) (22) 出願日	平成27年1月30日 (2015.1.30)		ビーエーエスエフ ソシエタス・ヨーロピア
(85) 翻訳文提出日	平成28年8月24日 (2016.8.24)		B A S F S E
(86) 国際出願番号	PCT/EP2015/051968		ドイツ連邦共和国 ルートヴィヒスハーフェン (番地なし)
(87) 国際公開番号	W02015/114106		D-67056 Ludwigshafen, Germany
(87) 国際公開日	平成27年8月6日 (2015.8.6)	(74) 代理人	100091096
(31) 優先権主張番号	14153482.6		弁理士 平木 祐輔
(32) 優先日	平成26年1月31日 (2014.1.31)	(74) 代理人	100118773
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 藤田 節
		(74) 代理人	100122389
			弁理士 新井 栄一
		最終頁に続く	

(54) 【発明の名称】 無脊椎有害生物防除用ピラゾール

(57) 【要約】

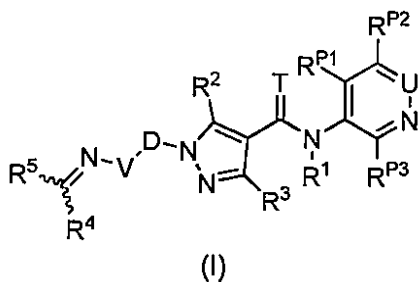
本発明は、新規の式Iのピラゾールに関する。さらに、本発明は、式Iのピラゾールの製造方法及び中間体に関し、さらに、それらを含む活性化化合物の組み合わせ、それらを含む組成物に関し、さらに、無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生育している植物を保護するためのそれらの使用に関する。さらに、本発明は、このような化合物を施用(適用)する方法に関する。本発明は、このような化合物を含む種子にも関する。

【選択図】 なし

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式Iのピラゾール化合物、並びにその塩、立体異性体、互変異性体及びN-オキシド
【化 1】



10

[式中、

Vは、O、S又はNR^{1a}であり、ここで、R^{1a}は、H、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルメチル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₁-C₁₀-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、OR^a、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル-C₁-C₄-アルキル及びヘタリール-C₁-C₄-アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、ハロゲン、CN、N
O₂、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシ
から選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、ある
いは、

20

R^{1a}及びR⁴は、R⁴が結合している炭素原子及びR^{1a}が結合している窒素原子並びに前記炭素原子と前記窒素原子の間の窒素原子と一緒にあって、4〜8員の複素環を形成しており、当該複素環は、2個の窒素原子をヘテロ原子として含有しており、互いに独立して、NR^B、O及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1個又は2個のヘテロ原子をさらに含有していてもよく、及び/又は、当該複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、

Dは、C₁-C₈-アルキレン、C₃-C₈-シクロアルキレン、C₃-C₈-ヘテロシクロアルキレン、C₂-C₈-アルケニレン、C₃-C₈-シクロアルケニレン、C₃-C₈-ヘテロシクロアルケニレン、又はC₂-C₈-アルキニレンであり、ここで、Dは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、

30

Uは、N又はCR^Uであり、

Tは、S、O又はNR^{1b}であり、ここで、R^{1b}は、H、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキルメチル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₁-C₁₀-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、OR^a、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル-C₁-C₄-アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル-C₁-C₄-アルキル及びヘタリール-C₁-C₄-アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、ハロゲン、CN、N
O₂、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシ
から選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、

40

R^{P1}、R^{P2}、R^{P3}及びR^Uは、互いに独立して、H、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₃-ハロアルキルチオ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルホニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル又はC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルから選択され、

R¹は、H、CN、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-ハロアルキニル、C₁-C₅-アルキレン-CN

50

、OR^a、C₁-C₅-アルキレン-OR^a、C(Y)R^b、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)R^b、C(Y)OR^c、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)OR^c、S(O)₂R^d、NR^eR^f、C₁-C₅-アルキレン-NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)NR^gR^h、S(O)_nNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅-アルキレン-S(O)₂R^d、C₁-C₅-アルキレン-S(O)_nNR^eR^f、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)NRⁱNR^eR^f、フェニル、ヘテロシクリル、ヘタリール、フェニル-C₁-C₅-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル-C₁-C₅-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₅-アルキル及びヘタリール-C₁-C₅-アルキルであり、ここで、最後に記載した7つの基の環は、非置換であってもよく、又は、基R^y及びR^xから選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、

R²及びR³は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル及びC₂-C₁₀-アルキニルから選択され、ここで、最後に記載した3つの基は、非置換であってもよく、部分的又は完全にハロゲン化されていてもよく、又は、1、2又は3個の同一の又は異なる置換基R^xを有していてもよく、

あるいは、R²及びR³は、さらに、OR^a、SR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)R^d、S(O)₂R^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、ヘテロシクリル、ヘタリール、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₅-C₁₀-シクロアルケニル及びフェニルから選択され、ここで、最後に記載した5つの基は、非置換であってもよく、又は、基R^y及びR^xから選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、

R⁴は、H、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-X、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-Xであり、ここで、Xは、O、S又はNR^Bから選択され、ここで、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、

R⁵は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-X、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-Xであり、ここで、Xは、O、S又はNR^Bから選択され、ここで、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、あるいは、

R⁴及びR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、3～8員の飽和又は不飽和の炭素環又は複素環を形成しており、当該複素環は、互いに独立して、NR^B、O及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有していてもよく、及び/又は、炭素環又は複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、

ここで、

R^Aは、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルコキシ、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、S(O)_nR^D、=O、=S、=NR^C、=NOR^C及び=NSR^Cであり、あるいは、

同じ炭素原子又は隣接する炭素原子に結合している2つのR^Aは、それらが結合している炭素原子(1個又は複数個)と一緒にあって、3～6員の飽和又は不飽和の炭素環又は複素環を形成しており、当該複素環は、互いに独立して、NR^B、O及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含有していてもよく、

R^Bは、H、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-アルキルカルボニル、C₁-C₂-ハロアルキルカルボニル又はC₁-C₂-アルコキシカルボニルであり、

R^Cは、H、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-ハロシクロアルキルであり、

R^Dは、H、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ又はC₁-C₄-ハロアルコキシであり、

nは、0、1、又は2であり、

Yは、O又はSであり、

R^a、R^b、R^cは、互いに独立して、H、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキルメチル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、

10

20

30

40

50

ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^dは、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^e及びR^fは、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルスルホニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリルカルボニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニル、フェニルカルボニル、フェニルスルホニル、ヘタリール、ヘタリールカルボニル、ヘタリールスルホニル、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した12個の基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、あるいは、

R^e及びR^fは、それらが結合している窒素原子と一緒に、5員又は6員の飽和又は不飽和の複素環を形成しており、当該複素環は、O、S及びNから選択されるさらなるヘテロ原子を環員原子として有していてもよく、ここで、当該複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^g及びR^hは、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

Rⁱは、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル及びフェニル- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した2つの基中のフェニル環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^xは、CN、NO₂、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシ、S(O)_nR^d、S(O)_nNR^eR^f、 C_1 - C_{10} -アルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシカルボニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、5～7員のヘテロシクリル、5員又は6員のヘタリール、フェニル、 C_3 - C_6 -シクロアルコキシ、3～6員のヘテロシクリルオキシ及びフェノキシであり、ここで、最後に記載した7つの基は、非置換であっても

よく、又は、1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる基 R^Y を有していてもよく、

R^Y は、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₄-ハロアルコキシ、S(O)_nR^d、S(O)_nNR^eR^f、C₁-C₄-アルキルカルボニル、C₁-C₄-ハロアルキルカルボニル、C₁-C₄-アルコキシカルボニル、C₁-C₄-ハロアルコキシカルボニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル及びC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルから選択される]。

【請求項2】

Vが、0又はSであり、好ましくはVが、0である、請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項3】

Dが、C₁-C₈-アルキレン、C₃-C₈-シクロアルキレン又はC₃-C₈-ヘテロシクロアルキレン、好ましくはC₁-C₈-アルキレンであり、ここで、Dは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい、請求項1又は2に記載の式Iの化合物。

10

【請求項4】

Dが、分枝のC₂-C₈-アルキレン、好ましくはアルファ分枝のC₂-C₈-アルキレンであり、ここで、分枝のC₂-C₈-アルキレンは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい、請求項3に記載の式Iの化合物。

【請求項5】

Dが、CH(CH₃)CH₂であり、ここで、好ましくは、CH₂基はVに結合し、CH(CH₃)基はピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V-CH₂CH(CH₃)-Nの連結が得られる、請求項3又は4に記載の式Iの化合物。

20

【請求項6】

R⁴が、H、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルメチルであり、R⁵が、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルメチルであり、ここで、それぞれの場合、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルメチルは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい、あるいは、

R⁴及びR⁵が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、非芳香族の5～6員の炭素環又は複素環を形成しており、当該複素環は、互いに独立して、NR^B、0及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含有していてもよく、及び/又は、炭素環又は複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい、請求項1～5のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

30

【請求項7】

Uが、N又はCHであり、好ましくはUが、Nであり、

Tが、0であり、

R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}が、Hである、請求項1～6のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項8】

R¹が、H、C₁-C₂-アルキル又はC₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキルであり、好ましくはR¹がC₁-C₂-アルキルであり、

R²及びR³が、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₄-シクロアルキル、C₃-C₄-ハロシクロアルキル、OR^a及びSR^a(式中、R^aは、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₄-シクロアルキル又はC₃-C₄-ハロシクロアルキルである)から選択され、好ましくは、R²が、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₃-シクロアルキル又はC₃-ハロシクロアルキル、より好ましくはCH₃又はハロメチルであり、好ましくは、R³がHである、請求項1～7のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

40

【請求項9】

R^Aが、ハロゲン、CN、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₁-C₂-アルコキシ、C₁-C

50

2 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_4 -シクロアルキル、 C_3 - C_4 -ハロシクロアルキル、 C_3 - C_4 -シクロアルコキシ又は C_3 - C_4 -ハロシクロアルコキシであり、あるいは、

2つの R^A が、同じ炭素原子に結合しており、それらが結合している炭素原子と一緒になって、シクロプロパンを形成する、請求項1~8のいずれか一項に記載の式Iの化合物。

【請求項10】

請求項1~9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物、並びに少なくとも1種の不活性な液体及び/又は固体の担体を含む組成物。

【請求項11】

請求項1~9のいずれか一項で定義した少なくとも1種の化合物、並びに少なくとも1種の不活性な液体及び/又は固体の許容される担体、及び必要ならば、少なくとも1種の界面活性剤を含む、動物有害生物を駆除するための農業用組成物。

10

【請求項12】

無脊椎有害生物を駆除又は防除する方法であって、前記有害生物又はその食糧供給源、生息地又は繁殖場所を、殺有害生物有効量の請求項1~9のいずれか一項で定義した少なくとも1種の化合物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項13】

無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生育している植物を保護するための方法であって、植物、又は植物が生育している土壌若しくは水を、殺有害生物有効量の請求項1~9のいずれか一項で定義した少なくとも1種の化合物と接触させることを含む、前記方法。

【請求項14】

請求項1~9のいずれか一項で定義した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、100kgの種子当たり0.1g~10kgの量で含む、種子。

20

【請求項15】

無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生育している植物を保護するための、請求項1~9のいずれか一項で定義した化合物の使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、新規の式Iのピラゾールに関する。さらに、本発明は、式Iのピラゾールの製造方法及び中間体に関し、さらに、それらを含む活性化合物の組み合わせ、それらを含む組成物に関し、さらに、無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生育している植物を保護するためのそれらの使用に関する。さらに、本発明は、このような化合物を施用(適用)する方法に関する。本発明は、このような化合物を含む種子にも関する。

30

【背景技術】

【0002】

無脊椎有害生物、特に、節足動物及び線虫は、生育中及び収穫済みの作物を損傷し、木造住宅及び商業用構造物を攻撃することにより、食料供給及び資産に多大な経済的損失をもたらす。無脊椎有害生物、例えば、昆虫、クモ形類(arachnids)及び線虫を駆除する新たな薬剤が継続して必要とされている。

【0003】

WO 2009/027393、WO 2010/034737、WO 2010/034738及びWO 2010/112177には、ピラゾールカルボン酸由来のN-アリアルアミド誘導体が記載されている。これらの化合物は、無脊椎有害生物を駆除するのに有用であると記載されている。

40

【先行技術文献】

【特許文献】

【0004】

【特許文献1】 WO 2009/027393

【特許文献2】 WO 2010/034737

【特許文献3】 WO 2010/034738

【特許文献4】 WO 2010/112177

50

【 0 0 0 5 】

【課題を解決するための手段】

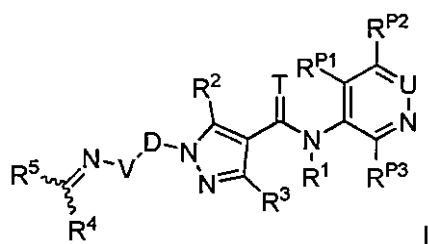
【 0 0 0 6 】

10

【 0 0 0 7 】

【 0 0 0 8 】

【化 1】



「式中、

30

40

U は、 N 又は CR^U であり、

50

ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、ハロゲン、CN、N₂、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ及びC₁-C₄-ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、

R^{P1}、R^{P2}、R^{P3}及びR^Uは、互いに独立して、H、ハロゲン、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₃-ハロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ、C₁-C₃-ハロアルコキシ、C₁-C₄-アルキルチオ、C₁-C₃-ハロアルキルチオ、C₁-C₄-アルキルスルフィニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルフィニル、C₁-C₄-アルキルスルホニル、C₁-C₃-ハロアルキルスルホニル、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-ハロアルケニル、C₂-C₄-アルキニル又はC₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキルから選択され、

R¹は、H、CN、C₁-C₁₀-アルキル、C₁-C₁₀-ハロアルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₃-C₁₀-ハロシクロアルキル、C₁-C₄-アルコキシ-C₁-C₄-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル、C₂-C₁₀-ハロアルケニル、C₂-C₁₀-アルキニル、C₃-C₁₀-ハロアルキニル、C₁-C₅-アルキレン-CN、OR^a、C₁-C₅-アルキレン-OR^a、C(Y)R^b、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)R^b、C(Y)OR^c、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)OR^c、S(O)₂R^d、NR^eR^f、C₁-C₅-アルキレン-NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)NR^gR^h、S(O)_nNR^eR^f、C(Y)NRⁱNR^eR^f、C₁-C₅-アルキレン-S(O)₂R^d、C₁-C₅-アルキレン-S(O)_nNR^eR^f、C₁-C₅-アルキレン-C(Y)NRⁱNR^eR^f、フェニル、ヘテロシクリル、ヘタリール、フェニル-C₁-C₅-アルキル、C₃-C₁₀-シクロアルキル-C₁-C₅-アルキル、ヘテロシクリル-C₁-C₅-アルキル及びヘタリール-C₁-C₅-アルキルであり、ここで、最後に記載した7つの基の環は、非置換であってもよく、又は、基R^y及びR^xから選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、

R²及びR³は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、NO₂、C₁-C₁₀-アルキル、C₂-C₁₀-アルケニル及びC₂-C₁₀-アルキニルから選択され、ここで、最後に記載した3つの基は、非置換であってもよく、部分的又は完全にハロゲン化されていてもよく、又は、1、2又は3個の同一の又は異なる置換基R^xを有していてもよく、

あるいは、R²及びR³は、さらに、OR^a、SR^a、C(Y)R^b、C(Y)OR^c、S(O)R^d、S(O)₂R^d、NR^eR^f、C(Y)NR^gR^h、ヘテロシクリル、ヘタリール、C₃-C₁₀-シクロアルキル、C₅-C₁₀-シクロアルケニル及びフェニルから選択され、ここで、最後に記載した5つの基は、非置換であってもよく、又は、基R^y及びR^xから選択される1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる置換基を有していてもよく、

R⁴は、H、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-X、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-Xであり、ここで、Xは、O、S又はNR^Bから選択され、ここで、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、

R⁵は、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルキル-X、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキル-Xであり、ここで、Xは、O、S又はNR^Bから選択され、ここで、C₁-C₆-アルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、あるいは、

R⁴及びR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒に、3~8員の飽和又は不飽和の炭素環又は複素環を形成しており、当該複素環は、互いに独立して、NR^B、O及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含有していてもよく、及び/又は、炭素環又は複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよく、

ここで、

R^Aは、ハロゲン、NO₂、CN、C₁-C₆-アルキル、C₁-C₆-アルコキシ、C₁-C₆-ハロアルキル、C₁-C₆-ハロアルコキシ、C₃-C₆-シクロアルキル、C₃-C₆-シクロアルコキシ、C₃-C₆-ハロシクロアルキル、C₃-C₆-ハロシクロアルコキシ、C₂-C₄-アルケニル、C₂-C₄-アルキニル、S(O)_nR^D、=O、=S、=NR^C、=NOR^C及び=NSR^Cであり、あるいは、

同じ炭素原子又は隣接する炭素原子に結合している2つのR^Aは、それらが結合している炭素原子(1個又は複数個)と一緒に、3~6員の飽和又は不飽和の炭素環又は複素環を形成しており、当該複素環は、互いに独立して、NR^B、O及びS(Sは酸化されていてもよく、

10

20

30

40

50

い)から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含有していてもよく、

R^B は、H、 C_1 - C_2 -アルキル、 C_1 - C_2 -ハロアルキル、 C_1 - C_2 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_2 -ハロアルキルカルボニル又は C_1 - C_2 -アルコキシカルボニルであり、

R^C は、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル又は C_3 - C_6 -ハロシクロアルキルであり、

R^D は、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル又は C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ又は C_1 - C_4 -ハロアルコキシであり、

nは、0、1、又は2であり、

Yは、O又はSであり、

R^a 、 R^b 、 R^c は、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^d は、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^e 及び R^f は、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -アルキルスルホニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルスルホニル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリルカルボニル、ヘテロシクリルスルホニル、フェニル、フェニルカルボニル、フェニルスルホニル、ヘタリール、ヘタリールカルボニル、ヘタリールスルホニル、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した12個の基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、あるいは、

R^e 及び R^f は、それらが結合している窒素原子と一緒に、5員又は6員の飽和又は不飽和の複素環を形成しており、当該複素環は、O、S及びNから選択されるさらなるヘテロ原子を環員原子として有していてもよく、ここで、当該複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^g 及び R^h は、互いに独立して、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリル- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル、ヘタリール、フェニル- C_1 - C_4 -アルキル及びヘタリール- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した6つの基中の環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

10

20

30

40

50

R^i は、H、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -シクロアルキルメチル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル、 C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキル、フェニル及びフェニル- C_1 - C_4 -アルキルから選択され、ここで、最後に記載した2つの基中のフェニル環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ及び C_1 - C_4 -ハロアルコキシから選択される1、2、3、4又は5個の置換基を有していてもよく、

R^x は、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシ、 $S(O)_nR^d$ 、 $S(O)_nNR^eR^f$ 、 C_1 - C_{10} -アルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシカルボニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、5～7員のヘテロシクリル、5員又は6員のヘタリール、フェニル、 C_3 - C_6 -シクロアルコキシ、3～6員のヘテロシクリルオキシ及びフェノキシであり、ここで、最後に記載した7つの基は、非置換であってもよく、又は、1、2、3、4又は5個の同一の又は異なる基 R^y を有していてもよく、

R^y は、ハロゲン、CN、 NO_2 、 C_1 - C_4 -アルキル、 C_1 - C_4 -ハロアルキル、 C_1 - C_4 -アルコキシ、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシ、 $S(O)_nR^d$ 、 $S(O)_nNR^eR^f$ 、 C_1 - C_4 -アルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルキルカルボニル、 C_1 - C_4 -アルコキシカルボニル、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシカルボニル、 C_3 - C_6 -シクロアルキル、 C_3 - C_6 -ハロシクロアルキル、 C_2 - C_4 -アルケニル、 C_2 - C_4 -ハロアルケニル、 C_2 - C_4 -アルキニル及び C_1 - C_4 -アルコキシ- C_1 - C_4 -アルキルから選択される]。

【0009】

別の態様では、本発明は、動物有害生物を駆除するための、少なくとも1種の式Iの化合物を含む組成物及び農業用組成物に関する。さらに別の態様では、本発明は、無脊椎有害生物を駆除又は防除する方法、及び無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生育している植物を保護する方法に関する。別の態様では、本発明は、式Iの化合物を含む種子に関し、さらに別の態様では、本発明は、無脊椎有害生物による攻撃又は寄生から生育している植物を保護するための式Iの化合物の使用に関する。

【0010】

本発明のさらなる実施形態は、特許請求の範囲、明細書及び実施例において見い出することができる。本発明の主題の、上記特徴及びさらに下記で説明される特徴は、それぞれで与えられる組み合わせだけでなく、本発明の範囲を逸脱することなく、他の組み合わせにも適用することができる。

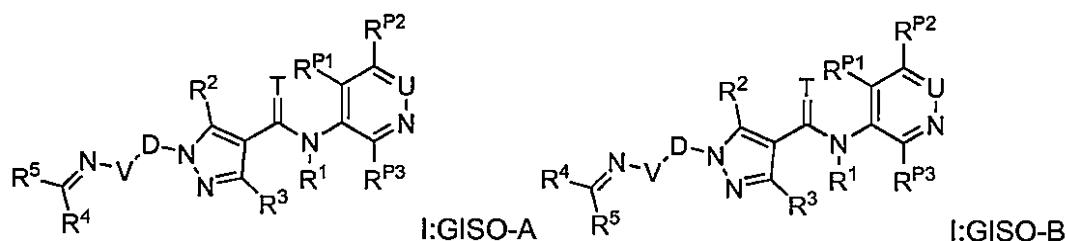
【発明を実施するための形態】

【0011】

上記の式Iの化合物では、置換基 R^4 及び R^5 の波線は、 R^4 及び R^5 が、炭素-窒素二重結合の炭素原子において両方の位置に存在し得る、すなわち、Vに対してシス立体配置又はトランス立体配置のいずれかで存在し得ることを示す。したがって、以下に図示するような、2つの幾何異性体GISO-A及びGISO-Bが、本発明の式Iの化合物に含まれる。

【0012】

【化2】



【0013】

明確にするために、本明細書全体では幾何異性体GISO-Aのみについて記載するが、その記載は、他の幾何異性体であるGISO-Bの開示も同様に包含する。

【0014】

本明細書において使用される場合、用語「幾何異性体」及び「幾何異性体化」は、特に

式Iの化合物のオキシム、チオオキシム又はヒドラゾン基の炭素-窒素二重結合に関する「E/Z-異性体」及び「E/Z-異性化」を示し、ここで、E及びZの立体配置は、カーン・インゴルド・プレローグ順位則(Cahn-Ingold-Prelog priority rules)を適用するIUPACにしたがい決定されるものと理解すべきである。

【0015】

本発明の式Iの化合物のオキシム、チオオキシム又はヒドラゾン基中に存在する炭素-窒素二重結合の場合には、E/Z-異性化のエネルギー障壁は、通常、特に炭素-炭素二重結合のE/Z-異性化のエネルギー障壁と比較した場合に、幾分低い。したがって、幾何異性体GISO-A及びGISO-Bが、例えば、溶液中に供給された場合、それらは通常、より安定性の高い幾何異性体が、より安定性の低い幾何異性体よりも高い割合で存在し得る平衡状態で存在し得る。立体的な理由では、E-異性体がZ-異性体より安定であることが多く、過剰に存在し得る。したがって、本発明の好ましい実施形態では、式Iの化合物において、E-異性体とZ-異性体の比が、少なくとも50:50、好ましくは少なくとも70:30、より好ましくは少なくとも90:1、最も好ましくは少なくとも99:1である。特定の特に好ましい実施形態では、式Iの化合物は、E-異性体の形態で存在し得る。

10

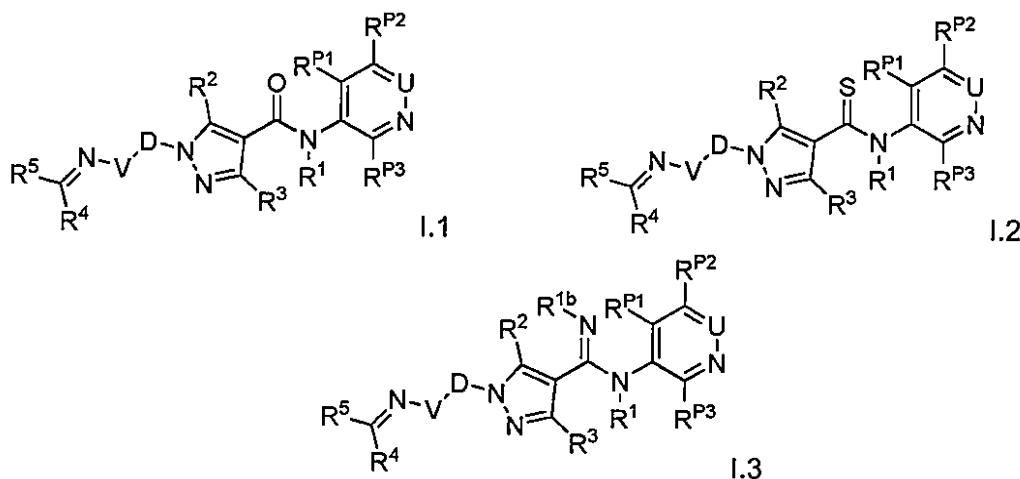
【0016】

1つの実施形態では、本発明は、式Iの化合物(式中、TはO、S又はNR^{1b}である)に関する。これらの化合物は、それぞれ式I.1、式I.2及び式I.3に相当する。

【0017】

【化3】

20



30

【0018】

本発明において、式I.1の化合物が好ましい。

【0019】

本発明による化合物は、有機化学の標準的方法によって、WO 2009/027393及びWO 2010/034737に記載される合成経路と同様に調製することができる。

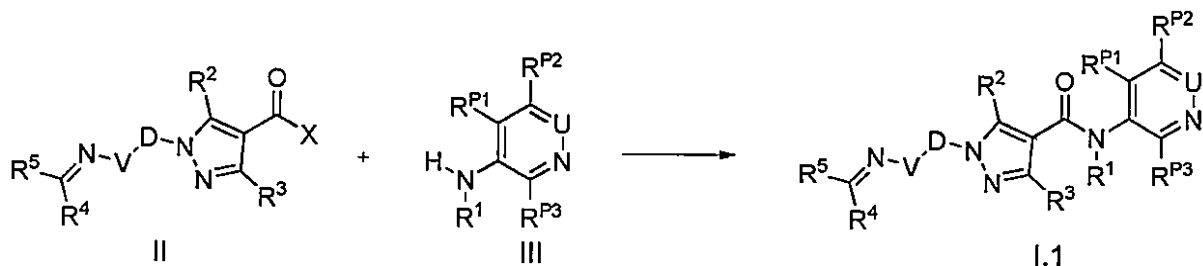
【0020】

式I.1の化合物(式中、TはOである)は、例えば、式IIの活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体を、式IIIの3-アミノピリジン又は4-アミノピリダジンと反応させることによって調製することができる(例えば、Houben-Weyl: 「Methoden der organ. Chemie」 [Methods of Organic Chemistry], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, Volume E5, pp. 941-1045)。

40

【0021】

【化 4】



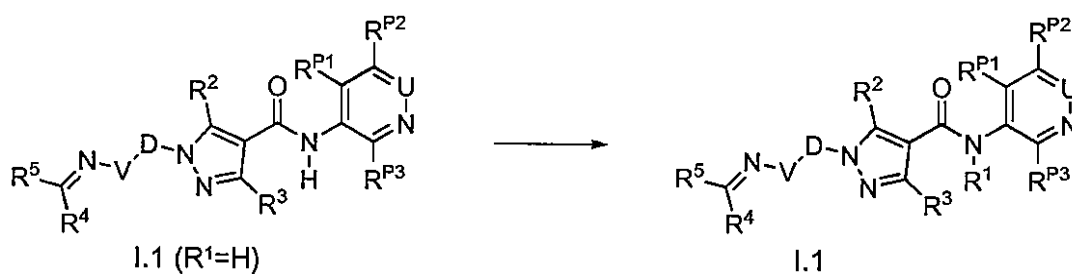
【0022】

10

式I.1の化合物(式中、 R^1 は水素ではない)はまた、塩基の存在下で、適切なアルキル化剤を使用して、アミドI.1(式中、 R^1 は水素である)をアルキル化することによって調製することができる。当該アルキル化は、文献から公知の標準の条件下で行うことができる。

【0023】

【化 5】



20

【0024】

式II及びIIIでは、基は式Iについての上記の意味、特に好ましいものとして記載された意味を有し、Xは適切な脱離基、例えば、ハロゲン、 N_3 、p-ニトロフェノキシ又はペンタフルオロフェノキシなどである。

【0025】

式IIの活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体は、ハロゲン化物、活性化エステル、無水物、アジド、例えば、塩化物、フッ化物、臭化物、パラ-ニトロフェニルエステル、ペンタフルオロフェニルエステル、N-ヒドロキシスクシンイミド、ヒドロキシベンゾトリアゾール-1-イルエステルが好ましい。

30

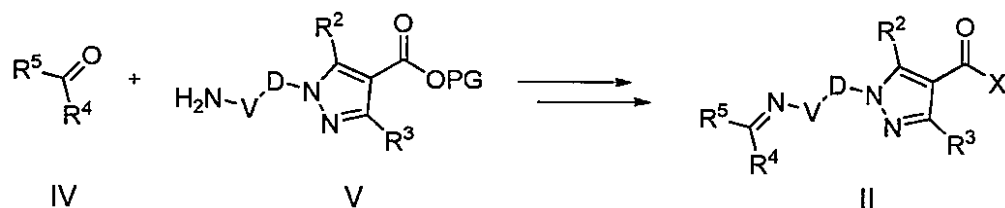
【0026】

式IIの活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体のオキシム、チオオキシム又はヒドラゾン基は、式IVのアルデヒド又はケトン、式Vの保護されたピラゾールカルボン酸誘導体(式中、PGは保護基、例えば、エチル、tert-ブチル、ベンジルなどである)と反応させることによって形成することができる。次いで、得られた生成物を脱保護し、式IIの活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体へと変換することができる。VがOであり、VがSであり、Vが NR^{1a} である、式IIの化合物を調製する方法は、それぞれ、WO 2013/072882、J. Org. Chem. 48(20)、p.3531(1983)、及びJP 2013/023476に記載されている。

40

【0027】

【化 6】

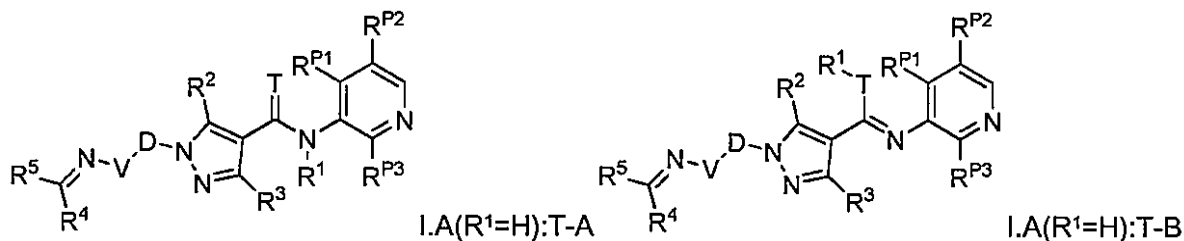


【0028】

あるいは、式IIの活性化されたピラゾールカルボン酸誘導体のオキシム、チオオキシム

50

【化 9】



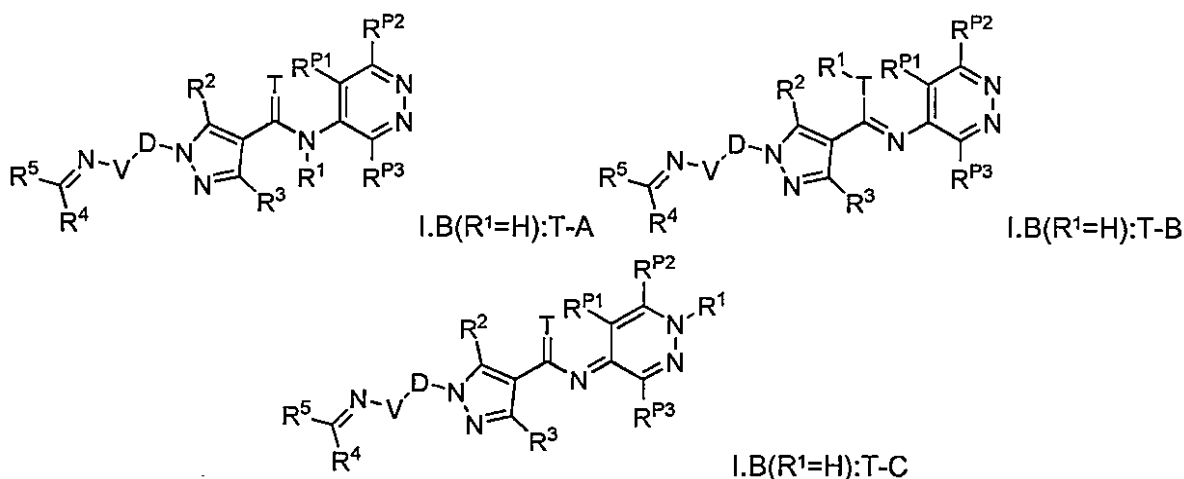
【0039】

式I.Bの化合物のように、UがNになるよう選択される場合、3種の互変異性体T-A、T-B及びT-Cが形成され得る。

10

【0040】

【化10】



20

【0041】

明確にするために、本明細書全体では互変異性体T-Aのみについて記載するが、その記載は、他の互変異性体の記載も同様に包含する。

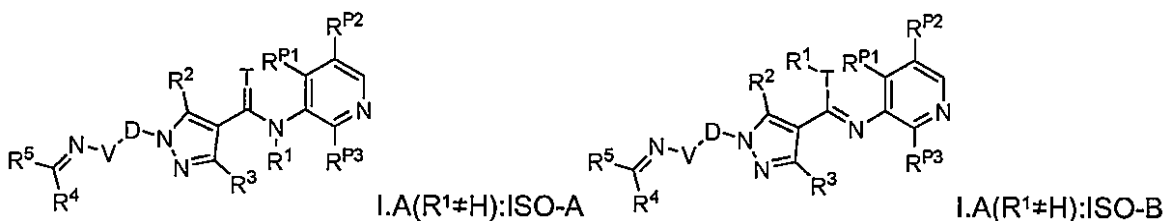
【0042】

30

R¹がHではない場合、式Iの化合物は、Uの意味に依存して、2種又は3種の異性形態で存在し得る。例えば、式I.Aの化合物のように、UがCHになるよう選択される場合、2種の構造異性体ISO-A及びISO-Bが形成され得る。

【0043】

【化11】



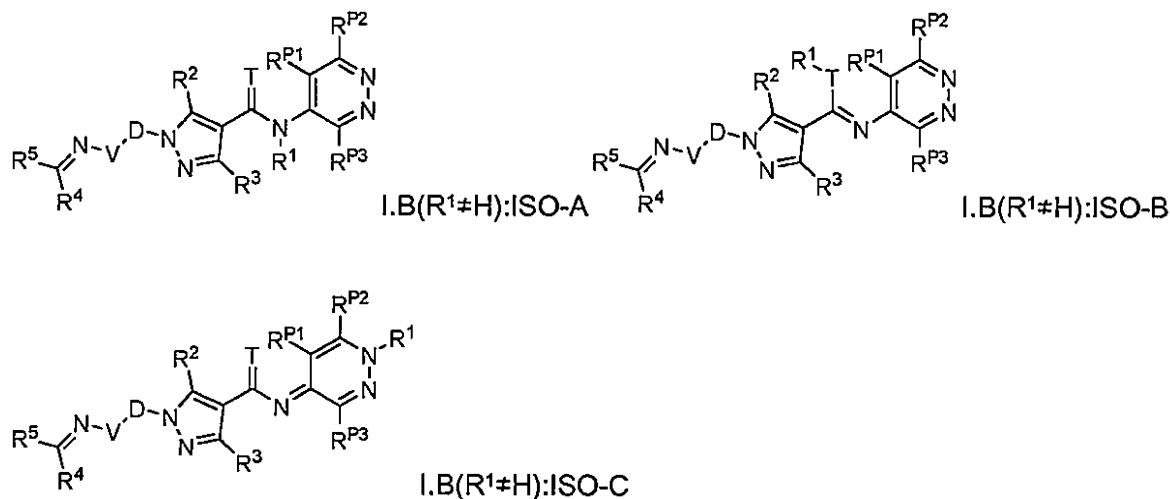
40

【0044】

式I.Bの化合物のように、UがNになるよう選択される場合、3種の構造異性体ISO-A、ISO-B及びISO-Cが形成され得る。

【0045】

【化 1 2】



10

【 0 0 4 6】

本発明において、式Iの化合物は、構造異性体ISO-Aの形態で存在することが好ましい。しかしながら、式Iの化合物はまた、構造異性体ISO-B若しくはISO-Cの形態、又は構造異性体ISO-A、ISO-B及びISO-Cの2種以上の混合物の形態で存在し得る。明確にするために、本明細書全体では構造異性体ISO-Aのみについて記載するが、その記載は、他の構造異性体の記載も同様に包含する。

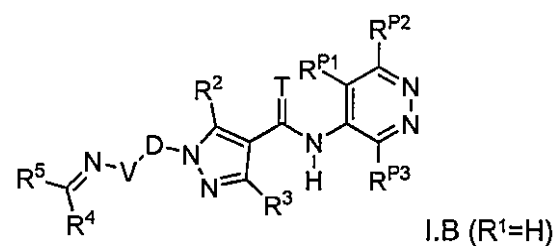
20

【 0 0 4 7】

異性体ISO-Cは、化合物I.B(式中、R¹は水素である)のアルキル化によって得ることができる。当該反応は、周知のピリダジンのN-アルキル化と同様に実施することができる。ピリダジンのN-アルキル化は文献において知られており、例えば、J. Chem. Soc., Perkin Trans. Vol.1, p.401(1988)、及びJ. Org. Chem. Vol.46, p.2467(1981)において見つけることができる。例えば、以下の化合物I.B.は、出発原料として使用され得る。

【 0 0 4 8】

【化 1 3】



30

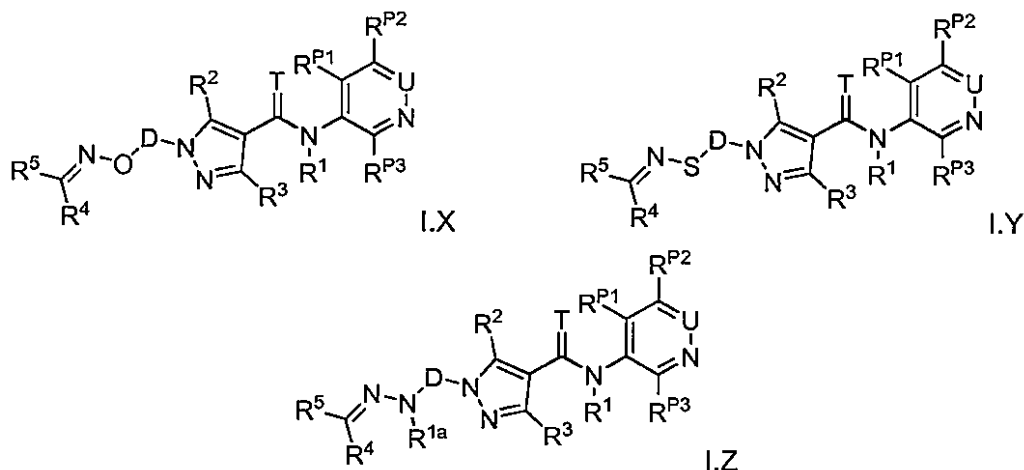
【 0 0 4 9】

一つのさらなる実施形態では、本発明は、式Iの化合物(式中、VはO、S又はNR^{1a}である)に関する。これらの化合物は、それぞれ、式I.X、式I.Y及び式I.Zに相当する。Vの意味に依存して、これらの化合物は、それぞれ、オキシム、チオオキシム及びヒドラゾンの化合物として示され得る。

40

【 0 0 5 0】

【化 1 4】



10

【0051】

本発明において、式I.X及び式I.Yの化合物が好ましい。式I.Xの化合物が特に好ましい。

【0052】

式Iの化合物は、オキシム、チオオキシム及びヒドラゾン部分のために、さらなる互変異性体を形成することもあり、これはVの選択に依存して決定する。例えば、 R^4 又は R^5 のいずれか1つが α -炭素原子において水素原子を供与する場合、イミン-エナミン互変異性が式I.X、I.Y及びI.Zの化合物において存在することができ、及び/又は R^{1a} がHになるよう選択される場合、アゾ-ヒドラゾン互変異性が式I.Zの化合物において存在することができる。オキシム、チオオキシム及びヒドラゾン部分のために形成される互変異性体は、本発明による式Iの化合物に含まれる。

20

【0053】

式Iの化合物のN-オキシドは、複素芳香族N-オキシドを調製する標準的な方法による、化合物Iの酸化によって、例えば、Journal of Organometallic Chemistry 1989、370、17-31に記載される方法によって調製することができる。

【0054】

個々の化合物が上記の経路で調製できない場合、他の化合物Iの誘導体化により、又は上記の合成経路の通常の変更によりそれらを調製することができる。例えば、個々の場合において、特定の化合物Iは、他の化合物Iから、エステル加水分解、アミド化、エステル化、エーテル開裂、オレフィン化、還元、酸化などによって有利に調製することができる。

30

【0055】

反応混合物は、通常的方式で、例えば、水と混合すること、相を分離させること、及び適切な場合、例えば、アルミナ上又はシリカゲル上のクロマトグラフィーで粗生成物を精製することによって後処理される。中間体及び最終生成物の一部は無色又は淡茶色の粘稠油の形態で得られることがあり、これらは、減圧下及び適度な昇温で、揮発性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る場合、それらは、再結晶化又は摩砕によって精製することができる。

40

【0056】

用語「本発明による化合物」、又は「式Iの化合物」は、本明細書で定義する化合物(1種又は複数種)、並びにその立体異性体、塩、互変異生体又はN-オキシドを含む。用語「本発明の化合物」は、用語「本発明による化合物」と同意義と理解され、したがって、その立体異性体、塩、互変異生体又はN-オキシドも含む。

【0057】

式Iの骨格に結合する基は、1つ又は複数のキラル中心を含有し得る。この場合には、式Iの化合物は、置換基に依存して、異なるエナンチオマー又はジアステレオマーの形態で

50

存在する。本発明は、式Iの全ての可能な立体異性体に関し、すなわち、単一のエナンチオマー又はジアステレオマー、並びにそれらの混合物に関する。

【0058】

すでに上記に示した通り、式Iの化合物は、オキシム、チオオキシム又はヒドラゾンの基の炭素-窒素二重結合において、置換基の配置に依存して、異なる幾何異性体の形態で存在し得る。本発明は、式Iの化合物のE-異性体及びZ-異性体の両方に関する。本発明の好ましい実施形態では、式Iの化合物は、E-異性体の形態で存在し得る。

【0059】

すでに上記に示した通り、式Iの化合物は、 R^1 (ただし、 R^1 はHではない)の位置に依存して、異なる構造異性体の形態で存在し得る。本発明は、式I.A($R^1 \neq H$): ISO-A、式I.A($R^1 \neq H$): ISO-B、式I.B($R^1 \neq H$): ISO-A、式I.B($R^1 \neq H$): ISO-B、式I.B($R^1 \neq H$): ISO-Cの化合物で示される全ての可能な構造異性体、及びそれらの混合物に関する。

10

【0060】

すでに上記に示した通り、式Iの化合物は、 R^1 がHである場合、Vが NR^{1a} (R^{1a} はHである)である場合、及び/又は R^4 又は R^5 のいずれか1つが α -炭素原子において水素原子を供与する場合、異なる互変異性体の形態で存在し得る。本発明は、式Iの全ての可能な互変異性体に関する。

【0061】

式Iの化合物は、アモルファスであってもよく、あるいは、異なる巨視的性質(安定性など)を有し得る、又は異なる生物学的特性(活性など)を示し得る、1つ又は複数の異なる結晶状態(多形体)で存在してもよい。本発明は、アモルファス及び結晶の式Iの化合物、それぞれの化合物Iの異なる結晶状態の混合物、並びにそれらのアモルファス又は結晶の塩に関する。

20

【0062】

式Iの化合物の塩は、獣医学的及び/又は農業的に許容される塩、好ましくは農業的に許容される塩であることが好ましい。それらは、通例の方法で、例えば、式Iの化合物が塩基性官能基を有する場合には、化合物を、当該陰イオン(アニオン)の酸で反応させることによって形成することができる。

【0063】

式Iの化合物の獣医学的及び/又は農業的に有用な塩は、とりわけ、陽イオン(カチオン)及び陰イオンがそれぞれ式Iの化合物の殺有害生物作用に悪影響を及ぼさないような、酸の酸付加塩を包含する。

30

【0064】

有用な酸付加塩の陰イオンは、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、重炭酸イオン、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、及び C_1 - C_4 -アルカン酸の陰イオン、好適には、ギ酸イオン、酢酸イオン、プロピオン酸イオン及び酪酸イオンである。それらは、式Iの化合物を、対応する陰イオンの酸、好適には塩酸、臭化水素酸、硫酸、リン酸又は硝酸と反応させることによって形成することができる。

40

【0065】

用語「N-オキシド」は、N-オキシド部分に酸化されている少なくとも1つの第三級窒素原子を有する任意の式Iの化合物を含む。

【0066】

可変要素の前記定義に記述されている有機部分は、用語ハロゲンのように、個々の基メンバーの個々の一覧に関する総称である。 C_n - C_m という接頭辞は、それぞれの場合、該基の炭素原子の可能な数を示す。

【0067】

用語「ハロゲン」は、それぞれの場合、フッ素、臭素、塩素又はヨウ素、特にフッ素、塩素又は臭素を示す。

50

【0068】

本明細書において及びアルキルアミノ、アルキルカルボニル、アルキルチオ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル及びアルコシアルキルのアルキル部分において使用される用語「アルキル」は、それぞれの場合、通常1~10個の炭素原子、頻繁には1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子、より好ましくは1~3個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝のアルキル基を示す。アルキル基の例は、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、2-ブチル、イソ-ブチル、tert-ブチル、n-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、n-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-メチルプロピル及び1-エチル-2-メチルプロピルである。

10

【0069】

本明細書において及びハロアルキルカルボニル、ハロアルコシカルボニル、ハロアルキルチオ、ハロアルキルスルホニル、ハロアルキルスルフィニル、ハロアルコシ及びハロアルコシアルキルのハロアルキル部分において使用される用語「ハロアルキル」は、それぞれの場合、この基の水素原子がハロゲン原子で部分的又は完全に置換されている、通常1~10個の炭素原子、頻繁には1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝のアルキル基を示す。好ましいハロアルキル部分は、 C_1 - C_4 -ハロアルキルから、より好ましくは C_1 - C_3 -ハロアルキル又は C_1 - C_2 -ハロアルキルから、特に C_1 - C_2 -フルオロアルキル、例えば、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、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、ペンタフルオロエチルなどから選択される。

20

【0070】

本明細書において使用される用語「アルコキシ」は、それぞれの場合、酸素原子を介して結合している、通常1~10個の炭素原子、頻繁には1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝のアルキル基を示す。アルコキシ基の例は、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、イソ-プロポキシ、n-ブチルオキシ、2-ブチルオキシ、イソ-ブチルオキシ、tert-ブチルオキシなどである。

30

【0071】

本明細書において使用される用語「アルコシアルキル」は、1個の炭素原子が前記で定義した、通常1~4個、好ましくは1~2個の炭素原子を含むアルコキシ基を有する、通常1~10個、頻繁には1~4個、好ましくは1~2個の炭素原子を含むアルキルを指す。例は、 $C_2H_5OCH_3$ 、 $CH_3CH_2OC_2H_5$ 、2-(メトキシ)エチル及び2-(エトキシ)エチルである。

【0072】

本明細書において使用される用語「ハロアルコキシ」は、それぞれの場合、この基の水素原子がハロゲン原子、特にフッ素原子で、部分的又は完全に置換されている、1~10個の炭素原子、頻繁には1~6個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝のアルコキシ基を示す。好ましいハロアルコキシ部分としては、 C_1 - C_4 -ハロアルコキシ、特に、 C_1 - C_2 -フルオロアルコキシ、例えば、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、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、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などが挙げられる。

40

【0073】

本明細書において使用される用語「アルキルチオ」「(アルキルスルファニル：アルキル-S-)」は、硫黄原子を介して結合している、1~10個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子(= C_1 - C_4 -アルキルチオ)、より好ましくは1~3個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝の飽和アルキル基を示す。

50

【0074】

本明細書において使用される用語「ハロアルキルチオ」は、水素原子がフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で、部分的又は完全に置換されている、前記のアルキルチオ基を示す。

【0075】

本明細書において使用される用語「アルキルスルフィニル」(アルキルスルホキシル： C_1 - C_6 -アルキル-S(=O)-)は、アルキル基の任意の位置において、スルフィニル基の硫黄原子を介して結合している、1~10個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子(= C_1 - C_4 -アルキルスルフィニル)、より好ましくは1~3個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝の飽和アルキル基(前記した通りである)を示す。

10

【0076】

本明細書において使用される用語「ハロアルキルスルフィニル」は、水素原子がフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で、部分的又は完全に置換されている、前記のアルキルスルフィニル基を示す。

【0077】

本明細書において使用される用語「アルキルスルホニル」(アルキル-S(=O)₂-)は、アルキル基の任意の位置において、スルホニル基の硫黄原子を介して結合している、1~10個の炭素原子、好ましくは1~4個の炭素原子(= C_1 - C_4 -アルキルスルホニル)、好ましくは1~3個の炭素原子を有する、直鎖又は分枝の飽和アルキル基を示す。

20

【0078】

本明細書において使用される用語「ハロアルキルスルホニル」は、水素原子がフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で、部分的又は完全に置換されている、前記のアルキルスルホニル基を示す。

【0079】

用語「アルキルカルボニル」は、カルボニル基(C=O)の炭素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したアルキル基を示す。

【0080】

用語「ハロアルキルカルボニル」は、水素原子がフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で、部分的又は完全に置換されている、前記のアルキルカルボニル基を示す。

【0081】

用語「アルコキシカルボニル」は、酸素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したアルキル基である。

30

【0082】

用語「ハロアルコキシカルボニル」は、水素原子がフッ素、塩素、臭素及び/又はヨウ素で、部分的又は完全に置換されている、前記のアルコキシカルボニル基を示す。

【0083】

本明細書において使用される用語「アルケニル」は、それぞれの場合、通常2~10個、頻繁には2~6個、好ましくは2~4個の炭素原子を有する単不飽和炭化水素基(singly unsaturated hydrocarbon radical)、例えば、ビニル、アリル(2-プロペン-1-イル)、1-プロペン-1-イル、2-プロペン-2-イル、メタリル(2-メチルプロパ-2-エン-1-イル)、2-ブテン-1-イル、3-ブテン-1-イル、2-ペンテン-1-イル、3-ペンテン-1-イル、4-ペンテン-1-イル、1-メチルブタ-2-エン-1-イル、2-エチルプロパ-2-エン-1-イルなどを示す。

40

【0084】

本明細書において使用される用語「ハロアルケニル」は、水素原子がハロゲン原子で、部分的又は完全に置換されている、上記で定義したアルケニル基を示す。

【0085】

本明細書において使用される用語「アルキニル」は、それぞれの場合、通常2~10個、頻繁には2~6個、好ましくは2~4個の炭素原子を有する単不飽和炭化水素基、例えば、エチニル、プロパルギル(2-プロピン-1-イル)、1-プロピン-1-イル、1-メチルプロパ-2-イン-1-イル)、2-ブチン-1-イル、3-ブチン-1-イル、1-ペンチン-1-イル、3-ペンチン-1-イ

50

ル、4-ペンチン-1-イル、1-メチルブタ-2-イン-1-イル、1-エチルプロパ-2-イン-1-イルなどを示す。

【0086】

本明細書において使用される用語「ハロアルキニル」は、水素原子がハロゲン原子で、部分的又は完全に置換されている、上記で定義したアルキニル基を示す。

【0087】

本明細書において及びシクロアルコキシ及びシクロアルキルメチルのシクロアルキル部分において使用される用語「シクロアルキル」は、それぞれの場合、通常3～10個又は3～6個の炭素原子を有する単環式環状脂肪族基、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、シクロノニル及びシクロデシル、又はシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル及びシクロヘキシルを示す。

10

【0088】

本明細書において及びハロシクロアルコキシのハロシクロアルキル部分において使用される用語「ハロシクロアルキル」は、それぞれの場合、水素原子の少なくとも1個、例えば、1、2、3、4又は5個がハロゲンで、特にフッ素又は塩素で、置換されている、通常3～10個のC原子、又は3～6個のC原子を有する、単環式環状脂肪族基を示す。例は、1-及び2-フルオロシクロプロピル、1,2-、2,2-及び2,3-ジフルオロシクロプロピル、1,2,2-トリフルオロシクロプロピル、2,2,3,3-テトラフルオロシクロプロピル、1-及び2-クロロシクロプロピル、1,2-、2,2-及び2,3-ジクロロシクロプロピル、1,2,2-トリクロロシクロプロピル、2,2,3,3-テトラクロロシクロプロピル、1-、2-及び3-フルオロシクロペンチル、1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-ジフルオロシクロペンチル、1-、2-及び3-クロロシクロペンチル、1,2-、2,2-、2,3-、3,3-、3,4-、2,5-ジクロロシクロペンチルなどである。

20

【0089】

用語「シクロアルコキシ」は、酸素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したシクロアルキル基を示す。

【0090】

用語「ハロシクロアルコキシ」は、酸素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したハロシクロアルキル基を示す。

【0091】

用語「シクロアルキルアルキル」は、アルキル基、例えば、 C_1 - C_5 -アルキル基又は C_1 - C_4 -アルキル基、特にメチル基(=シクロアルキルメチル)を介して分子の残部に結合している、上記で定義したシクロアルキル基を示す。

30

【0092】

本明細書において使用される用語「シクロアルケニル」は、それぞれの場合、通常5～10個又は3～8個の炭素原子を有する単環式単不飽和非芳香族基(例えば、シクロヘプテニル又はシクロオクテニルを含む)を示す。

【0093】

用語「ヘテロシクリル」は、一般に5員又は6員の、特に6員の単環式の複素環式非芳香族基を含む。複素環式非芳香族基は、通常、環員としてN、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含み、ここで、環員としてのS原子は、S、SO又はSO₂として存在することができる。5員又は6員の複素環式基の例は、飽和又は不飽和の非芳香族複素環式環、例えば、オキシラニル、オキセタニル、チエタニル、チエタニル-S-オキシド(S-オキシチエタニル)、チエタニル-S-ジオキシド(S-ジオキシチエタニル)、ピロリジニル、ピロリニル、ピラゾリニル、テトラヒドロフラニル、ジヒドロフラニル、1,3-ジオキソラニル、チオラニル、S-オキシチオラニル、S-ジオキシチオラニル、ジヒドロチエニル、S-オキシジヒドロチエニル、S-ジオキシジヒドロチエニル、オキサゾリジニル、オキサゾリニル、チアゾリニル、オキサチオラニル、ペペリジニル、ペペラジニル、ピラニル、ジヒドロピラニル、テトラヒドロピラニル、1,3-及び1,4-ジオキサニル、チオピラニル、S-オキシチオピラニル、S-ジオキシチオピラニル、ジヒドロチオピラニル、S-オキシジヒドロチオピラ

40

50

ニル、S-ジオキソジヒドロチオピラニル、テトラヒドロチオピラニル、S-オキシテトラヒドロチオピラニル、S-ジオキソテトラヒドロチオピラニル、モルホリニル、チオモルホリニル、S-オキシチオモルホリニル、S-ジオキソチオモルホリニル、チアジニルなどを含む。環員として1個又は2個のカルボニル基を含む複素環式環の例は、ピロリジン-2-オニル、ピロリジン-2,5-ジオニル、イミダゾリジン-2-オニル、オキサゾリジン-2-オニル、チアゾリジン-2-オニルなどを含む

【0094】

用語「ヘタリール」は、環員としてN、O及びSから選択される1、2、3又は4個のヘテロ原子を含む、単環式の5員又は6員の複素芳香族基を含む。5員又は6員の複素芳香族基の例は、ピリジル、すなわち、2-、3-又は4-ピリジル、ピリミジニル、すなわち、2-、4-又は5-ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、すなわち、3-又は4-ピリダジニル、チエニル、すなわち、2-又は3-チエニル、フリル、すなわち、2-又は3-フリル、ピロリル、すなわち、2-又は3-ピロリル、オキサゾリル、すなわち、2-、3-又は5-オキサゾリル、イソオキサゾリル、すなわち、3-、4-又は5-イソオキサゾリル、チアゾリル、すなわち、2-、3-又は5-チアゾリル、イソチアゾリル、すなわち、3-、4-又は5-イソチアゾリル、ピラゾリル、すなわち、1-、3-、4-又は5-ピラゾリル、すなわち、1-、2-、4-又は5-イミダゾリル、オキサジアゾリル、例えば、2-又は5-[1,3,4]オキサジアゾリル、4-又は5-(1,2,3-オキサジアゾール)イル、3-又は5-(1,2,4-オキサジアゾール)イル、2-又は5-(1,3,4-チアジアゾール)イル、チアジアゾリル、例えば、2-又は5-(1,3,4-チアジアゾール)イル、4-又は5-(1,2,3-チアジアゾール)イル、3-又は5-(1,2,4-チアジアゾール)イル、トリアゾリル、例えば、1H-、2H-又は3H-1,2,3-トリアゾール-4-イル、2H-トリアゾール-3-イル、1H-、2H-又は4H-1,2,4-トリアゾリル及びテトラゾリル、すなわち、1H-又は2H-テトラゾリルを含む。用語「ヘタリール」はまた、環員としてN、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含む、二環式の8～10員の複素芳香族基であって、5員又は6員の複素芳香族環がフェニル環又は5員又は6員の複素芳香族基と縮合している、前記複素芳香族基を含む。フェニル環又は5員又は6員の複素芳香族基と縮合している5員又は6員の複素芳香族環の例は、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、インドリル、インダゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサチアゾリル、ベンゾオキサジアゾリル、ベンゾチアジアゾリル、ベンゾオキサジニル、キノリニル(chinoliny)l、イソキノリニル、プリニル、1,8-ナフチリジル、プテリジル、ピリド[3,2-d]ピリミジル又はピリドイミダゾリルなどを含む。これらの縮合ヘタリール基は、5員又は6員の複素芳香族環の任意の環原子を介して、又は縮合フェニル部分の炭素原子を介して、分子の残部に結合され得る。

【0095】

用語「ヘテロシクリルオキシ」及び「フェノキシ」は、酸素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したヘテロシクリル及びフィニルを示す。

【0096】

用語「ヘテロシクリルスルホニル」、「フェニルスルホニル」及び「ヘタリールスルホニル」は、それぞれ、スルホニル基の硫黄原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したヘテロシクリル、フェニル、及び上記で定義したヘタリールを示す。

【0097】

用語「ヘテロシクリルカルボニル」、「フェニルカルボニル」及び「ヘタリールカルボニル」は、それぞれ、カルボニル基(C=O)の炭素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したヘテロシクリル、フェニル、及び上記で定義したヘタリールを示す。

【0098】

用語「ヘテロシクリルアルキル」及び「ヘタリールアルキル」は、それぞれ、C₁-C₅-アルキル基又はC₁-C₄-アルキル基、特に、メチル基(それぞれ、=ヘテロシクリルメチル又はヘタリールメチル)を介して分子の残部に結合している、上記で定義したヘテロシクリル又はヘタリールを示す。

【0099】

用語「フェニルアルキル」は、C₁-C₅-アルキル基又はC₁-C₄-アルキル基、特に、メチル

基(=フェニルメチル)を介して分子の残部に結合しているフェニル(ベンジル、1-フェニルエチル、2-フェニルエチル、2-フェノキシエチルなどを含む)を示す。

【0100】

用語「ヘテロシクロアルキル」は、一般に、3～8員の、特に6員の単環式の飽和複素環式非芳香族基を含む。複素環式非芳香族基は、通常、環員としてN、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含み、ここで、環員としてのS原子は、S、SO又はSO₂として存在することができる。

【0101】

用語「ヘテロシクロアルケニル」は、一般に、3～8員の、特に6員の単環式の単不飽和複素環式非芳香族基を含む。複素環式非芳香族基は、通常、環員としてN、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含み、ここで、環員としてのS原子は、S、SO又はSO₂として存在することができる。

10

【0102】

用語「アルキレン」「シクロアルキレン」、「ヘテロシクロアルキレン」、「アルケニレン」、「シクロアルケニレン」、「ヘテロシクロアルケニレン」及び「アルキニレン」は、それぞれ、それぞれの基の2個の原子を介して、好ましくは2個の炭素原子を介して分子の残部に結合している、上記で定義したアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルケニル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルケニル及びアルキニルを示す。

【0103】

用語「炭素環」は、一般に、3～8個、又は5～8個、好ましくは5個又は6個の炭素原子を含む、3～8員の、又は5～8員の、好ましくは5員又は6員の単環式非芳香族環を含む。

20

【0104】

用語「複素環」は、一般に、環員としてN、O及びSから選択される1、2又は3個のヘテロ原子を含む、上記「炭素環」で記載した、3～8員の、又は5～8員の、好ましくは5員又は6員の単環式非芳香族環を含む、ここで、環員としてのS原子は、S、SO又はSO₂として存在することができる。

可変要素に関して、中間体の特に好ましい実施形態は、式Iの化合物のものに相当する。

【0105】

特定の実施形態では、式Iの化合物の可変要素は以下の意味を有し、これらの意味(それら自体及び互いの組み合わせの両方)は、式Iの化合物の特定の実施形態である：

30

【0106】

好ましい実施形態では、本発明は、式Iの化合物(式中、TはOである)、すなわち、上で図示した、式I.1の化合物に関する。

【0107】

別の好ましい実施形態では、本発明は、式Iの化合物(式中、UはCH又はNである)、すなわち、上で図示した、式I.A及びI.Bの化合物に関する。本発明において、式Iの化合物(式中、UはNである)、すなわち、式I.Bの化合物が特に好ましい。

【0108】

別の好ましい実施形態では、本発明は、式Iの化合物(式中、VはO又はSである)、すなわち、上で図示した、式I.X及びI.Yの化合物に関する

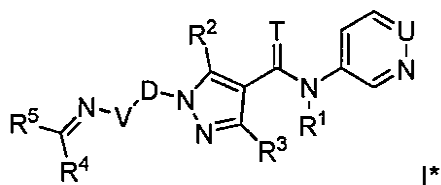
40

【0109】

式Iの化合物の好ましい実施形態では、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}は、Hである。これらの化合物は、式I*に相当する。

【0110】

【化 1 5】



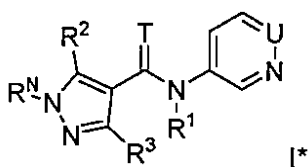
【0 1 1 1】

式I*の化合物はまた、以下の式I*(式中、R^Nは、ピラゾール環の窒素原子における(R⁵)(R⁴)C=N-V-D-置換基を表す)により表すこともできる。

10

【0 1 1 2】

【化 1 6】



【0 1 1 3】

式Iの化合物の別の好ましい実施形態では、R¹はH、C₁-C₂-アルキル、又はC₁-C₂-アルコキシ-C₁-C₂-アルキル、好ましくはC₁-C₂-アルキルである。

20

【0 1 1 4】

式Iの化合物の別の好ましい実施形態では、R²及びR³は、互いに独立して、H、ハロゲン、CN、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₄-シクロアルキル、C₃-C₄-ハロシクロアルキル、OR^a及びSR^a(式中、R^aは、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₄-シクロアルキル又はC₃-C₄-ハロシクロアルキルである)から選択される。好ましくは、R²は、C₁-C₂-アルキル、C₁-C₂-ハロアルキル、C₃-シクロアルキル又はC₃-ハロシクロアルキルであり、より好ましくはR²は、CH₃又はハロメチルである。好ましくは、R³はHである。

【0 1 1 5】

式Iの化合物の第一の好ましい実施形態では、R⁴は、H、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルメチルであり、R⁵は、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルメチルであり、ここで、それぞれの場合、C₁-C₄-アルキル、C₁-C₄-ハロアルキル、C₃-C₆-シクロアルキル又はC₃-C₆-シクロアルキルメチルは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい。

30

【0 1 1 6】

式Iの化合物の第二の好ましい実施形態では、R⁴及びR⁵は、両方とも、C₁-C₄-アルキル-X(式中、XはO、S又はNR^Bから選択される)から独立して選択される。

【0 1 1 7】

式Iの化合物の第三の好ましい実施形態では、R⁴及びR⁵は、それらが結合している炭素原子と一緒に、非芳香族の、5~6員の炭素環又は複素環を形成しており、該複素環は、互いに独立して、NR^B、O及びS(Sは酸化されていてもよい)から選択される1個又は2個のヘテロ原子を含有していてもよく、及び/又は、炭素環又は複素環は、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい。

40

【0 1 1 8】

式Iの化合物の別の好ましい実施形態では、Dは、C₁-C₈-アルキレン、C₃-C₈-シクロアルキレン又はC₃-C₈-ヘテロシクロアルキレン、好ましくはC₂-C₈-アルキレンであり、ここで、Dは、非置換であってもよく、又は、互いに独立して、R^Aから選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい。好ましくは、Dは、分枝のC₂-C₈-アルキレン、より好ましくはアルファ分枝のC₂-C₈-アルキレンであり、ここで、C₂-C₈-アルキレンは、

50

非置換であってもよく、又は、互いに独立して、 R^A から選択される置換基により部分的又は完全に置換されていてもよい。Dは $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2$ であり、ここで、好ましくは、 CH_2 基はVに結合し、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 基はピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、 $\text{V}-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}$ の連結が得られることが特に好ましい。

【0119】

第一の好ましい実施形態では、 R^A は、ハロゲン、CN、 C_1 - C_2 -アルキル、 C_1 - C_2 -ハロアルキル、 C_1 - C_2 -アルコキシ、 C_1 - C_2 -ハロアルコキシ、 C_3 - C_4 -シクロアルキル、 C_3 - C_4 -ハロシクロアルキル、 C_3 - C_4 -シクロアルコキシ又は C_3 - C_4 -ハロシクロアルコキシである。

【0120】

第二の好ましい実施形態では、2つの R^A は、同じ炭素原子に結合しており、それらが結合している炭素原子と一緒にあって、シクロプロパンを形成する。

【0121】

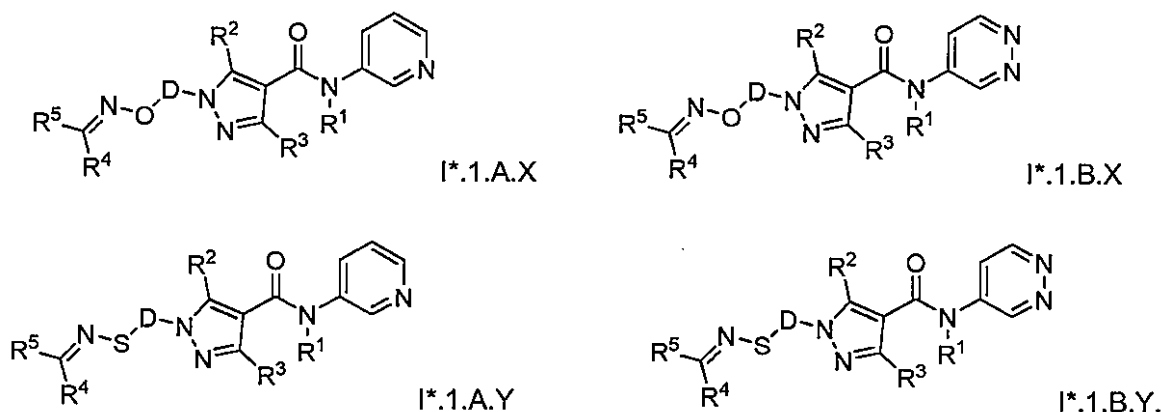
好ましい実施形態では、 R^B は、H、 C_1 - C_2 -アルキル、 C_1 - C_2 -ハロアルキル又は C_3 - C_6 -シクロアルキルである。

【0122】

上記の観点から、本発明は、
 式Iの化合物(式中、TはOであり、UはCHであり、VはOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} はHである)、すなわち、式I*.1.A.Xの化合物；
 式Iの化合物(式中、TはOであり、UはNであり、VはOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} はHである)、すなわち、式I*.1.B.Xの化合物；
 式Iの化合物(式中、TはOであり、UはCHであり、VはSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} はHである)、すなわち、式I*.1.A.Yの化合物；又は
 式Iの化合物(式中、TはOであり、UはNであり、VはSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} はHである)、すなわち、式I*.1.B.Yの化合物；
 に関する。

【0123】

【化17】



【0124】

特に、それらの使用の観点から、以下の表にまとめられた式Iの化合物が好ましく、これらの化合物は、式I.1、特に、式I*.1.A.X、I*.1.B.X、I*.1.A.Y及びI*.1.B.Yの化合物に、それぞれ相当する(表1~9は式I*.1.A.Xの化合物を含み、表10~18は式I*.1.B.Xの化合物を含み、表19~27は式I*.1.A.Yの化合物を含み、表28~36は式I*.1.B.Yの化合物を含む)。さらに、表中の置換基について記載した各基は、それ自体で、それらが記載された組み合わせから独立して、当該置換基の特に好ましい態様である。

【0125】

表1

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0126】

表2

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0127】

表3

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

10

【0128】

表4

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0129】

表5

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

20

【0130】

表6

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0131】

表7

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基はVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基はピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V- $CH_2CH(CH_3)$ -Nの連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

30

【0132】

表8

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V- $CH_2CH(CH_3)$ -Nの連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0133】

表9

UがCHであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V- $CH_2CH(CH_3)$ -Nの連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

40

【0134】

表10

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において

50

、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0135】

表11

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0136】

表12

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

10

【0137】

表13

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0138】

表14

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

20

【0139】

表15

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0140】

表16

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、 $V-CH_2CH(CH_3)-N$ の連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

30

【0141】

表17

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、 $V-CH_2CH(CH_3)-N$ の連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

40

【0142】

表18

UがNであり、VがOであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、 $V-CH_2CH(CH_3)-N$ の連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0143】

表19

UがCHであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、D

50

がCH₂であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0144】

表20

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がCH₃であり、R³がHであり、DがCH₂であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0145】

表21

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がCH₂CH₃であり、R³がHであり、DがCH₂であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

10

【0146】

表22

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がHであり、R³がHであり、DがCH₂CH₂であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0147】

表23

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がCH₃であり、R³がHであり、DがCH₂CH₂であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

20

【0148】

表24

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がCH₂CH₃であり、R³がHであり、DがCH₂CH₂であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0149】

表25

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がHであり、R³がHであり、DがCH₂CH(CH₃)(ここで、CH₂基がVに結合し、CH(CH₃)基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V-CH₂CH(CH₃)-Nの連結が得られる)であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

30

【0150】

表26

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がCH₃であり、R³がHであり、DがCH₂CH(CH₃)(ここで、CH₂基がVに結合し、CH(CH₃)基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V-CH₂CH(CH₃)-Nの連結が得られる)であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

40

【0151】

表27

UがCHであり、VがSであり、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}がHであり、R¹がCH₂CH₃であり、R³がHであり、DがCH₂CH(CH₃)(ここで、CH₂基がVに結合し、CH(CH₃)基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V-CH₂CH(CH₃)-Nの連結が得られる)であり、化合物についてのR²、R⁴及びR⁵の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0152】

表28

50

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0153】

表29

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0154】

表30

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0155】

表31

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0156】

表32

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0157】

表33

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが CH_2CH_2 であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0158】

表34

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 がHであり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V- $CH_2CH(CH_3)$ -Nの連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0159】

表35

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V- $CH_2CH(CH_3)$ -Nの連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0160】

表36

UがNであり、VがSであり、 R^{P1} 、 R^{P2} 及び R^{P3} がHであり、 R^1 が CH_2CH_3 であり、 R^3 がHであり、Dが $CH_2CH(CH_3)$ (ここで、 CH_2 基がVに結合し、 $CH(CH_3)$ 基がピラゾール部分の窒素原子に結合することにより、V- $CH_2CH(CH_3)$ -Nの連結が得られる)であり、化合物についての R^2 、 R^4 及び R^5 の組み合わせが、それぞれの場合において、表Aの1つの行に対応する、式I.1の化合物

【0161】

10

20

30

40

50

【表 1】

表A

No.	R ²	R ⁵	R ⁴	No.	R ²	R ⁵	R ⁴
A-1	CH ₃	CH ₃	H	A-22	CH ₃	CH ₂ -C-C ₆ H ₁₁	H
A-2	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-23	CH ₃	CH ₂ CN	H
A-3	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	A-24	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H
A-4	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	A-25	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	H
A-5	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	A-26	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H
A-6	CH ₃	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	H	A-27	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H
A-7	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	A-28	CHF ₂	CH ₃	H
A-8	CH ₃	C(CH ₃) ₃	H	A-29	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	H
A-9	CH ₃	CH ₂ F	H	A-30	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-10	CH ₃	CHF ₂	H	A-31	CHF ₂	CH(CH ₃) ₂	H
A-11	CH ₃	CF ₃	H	A-32	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-12	CH ₃	CH ₂ CH ₂ F	H	A-33	CHF ₂	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	H
A-13	CH ₃	CH ₂ CHF ₂	H	A-34	CHF ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H
A-14	CH ₃	CH ₂ CF ₃	H	A-35	CHF ₂	C(CH ₃) ₃	H
A-15	CH ₃	c-C ₃ H ₅	H	A-36	CHF ₂	CH ₂ F	H
A-16	CH ₃	c-C ₄ H ₇	H	A-37	CHF ₂	CHF ₂	H
A-17	CH ₃	c-C ₅ H ₉	H	A-38	CHF ₂	CF ₃	H
A-18	CH ₃	c-C ₆ H ₁₁	H	A-39	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ F	H
A-19	CH ₃	CH ₂ -C-C ₃ H ₅	H	A-40	CHF ₂	CH ₂ CHF ₂	H
A-20	CH ₃	CH ₂ -C-C ₄ H ₇	H	A-41	CHF ₂	CH ₂ CF ₃	H
A-21	CH ₃	CH ₂ -C-C ₅ H ₉	H	A-42	CHF ₂	c-C ₃ H ₅	H

10

20

No.	R ²	R ⁵	R ⁴	No.	R ²	R ⁵	R ⁴
A-43	CHF ₂	c-C ₄ H ₇	H	A-84	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-44	CHF ₂	c-C ₅ H ₉	H	A-85	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-45	CHF ₂	c-C ₆ H ₁₁	H	A-86	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-46	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₃ H ₅	H	A-87	CH ₃	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	CH ₃
A-47	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₄ H ₇	H	A-88	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-48	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₅ H ₉	H	A-89	CH ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-49	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₆ H ₁₁	H	A-90	CH ₃	CH ₂ F	CH ₃
A-50	CHF ₂	CH ₂ CN	H	A-91	CH ₃	CHF ₂	CH ₃
A-51	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CN	H	A-92	CH ₃	CF ₃	CH ₃
A-52	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃	H	A-93	CH ₃	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃
A-53	CHF ₂	CH(CH ₃)OCH ₃	H	A-94	CH ₃	CH ₂ CHF ₂	CH ₃
A-54	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	A-95	CH ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-55	CF ₃	CH ₃	H	A-96	CH ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃
A-56	CF ₃	CH ₂ CH ₃	H	A-97	CH ₃	c-C ₄ H ₇	CH ₃
A-57	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	A-98	CH ₃	c-C ₅ H ₉	CH ₃
A-58	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	H	A-99	CH ₃	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃
A-59	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	A-100	CH ₃	CH ₂ -C-C ₃ H ₅	CH ₃
A-60	CF ₃	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	H	A-101	CH ₃	CH ₂ -C-C ₄ H ₇	CH ₃
A-61	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	H	A-102	CH ₃	CH ₂ -C-C ₅ H ₉	CH ₃
A-62	CF ₃	C(CH ₃) ₃	H	A-103	CH ₃	CH ₂ -C-C ₆ H ₁₁	CH ₃
A-63	CF ₃	CH ₂ F	H	A-104	CH ₃	CH ₂ CN	CH ₃
A-64	CF ₃	CHF ₂	H	A-105	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃
A-65	CF ₃	CF ₃	H	A-106	CH ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃
A-66	CF ₃	CH ₂ CH ₂ F	H	A-107	CH ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃
A-67	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	H	A-108	CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃
A-68	CF ₃	CH ₂ CF ₃	H	A-109	CHF ₂	CH ₃	CH ₃
A-69	CF ₃	c-C ₃ H ₅	H	A-110	CHF ₂	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-70	CF ₃	c-C ₄ H ₇	H	A-111	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-71	CF ₃	c-C ₅ H ₉	H	A-112	CHF ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-72	CF ₃	c-C ₆ H ₁₁	H	A-113	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-73	CF ₃	CH ₂ -C-C ₃ H ₅	H	A-114	CHF ₂	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	CH ₃
A-74	CF ₃	CH ₂ -C-C ₄ H ₇	H	A-115	CHF ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-75	CF ₃	CH ₂ -C-C ₅ H ₉	H	A-116	CHF ₂	C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-76	CF ₃	CH ₂ -C-C ₆ H ₁₁	H	A-117	CHF ₂	CH ₂ F	CH ₃
A-77	CF ₃	CH ₂ CN	H	A-118	CHF ₂	CHF ₂	CH ₃
A-78	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	H	A-119	CHF ₂	CF ₃	CH ₃
A-79	CF ₃	CH ₂ OCH ₃	H	A-120	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃
A-80	CF ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	H	A-121	CHF ₂	CH ₂ CHF ₂	CH ₃
A-81	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	A-122	CHF ₂	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-82	CH ₃	CH ₃	CH ₃	A-123	CHF ₂	c-C ₃ H ₅	CH ₃
A-83	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	A-124	CHF ₂	c-C ₄ H ₇	CH ₃

10

20

30

40

No.	R ²	R ⁵	R ⁴	No.	R ²	R ⁵	R ⁴
A-125	CHF ₂	c-C ₅ H ₉	CH ₃	A-166	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-126	CHF ₂	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	A-167	CH ₃	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
A-127	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₃ H ₅	CH ₃	A-168	CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-128	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₄ H ₇	CH ₃	A-169	CHF ₂	OCH ₃	OCH ₃
A-129	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₅ H ₉	CH ₃	A-170	CHF ₂	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃
A-130	CHF ₂	CH ₂ -C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	A-171	CHF ₂	SCH ₃	SCH ₃
A-131	CHF ₂	CH ₂ CN	CH ₃	A-172	CHF ₂	SCH ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-132	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	A-173	CHF ₂	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
A-133	CHF ₂	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	A-174	CHF ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-134	CHF ₂	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃	A-175	CF ₃	OCH ₃	OCH ₃
A-135	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	A-176	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃
A-136	CF ₃	CH ₃	CH ₃	A-177	CF ₃	SCH ₃	SCH ₃
A-137	CF ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	A-178	CF ₃	SCH ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-138	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	A-179	CF ₃	N(CH ₃) ₂	N(CH ₃) ₂
A-139	CF ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	A-180	CF ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-140	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	A-181	CH ₃	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃
A-141	CF ₃	CH(CH ₃)(CH ₂ CH ₃)	CH ₃	A-182	CH ₃	OCH ₃	SCH ₃
A-142	CF ₃	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	A-183	CH ₃	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-143	CF ₃	C(CH ₃) ₃	CH ₃	A-184	CH ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
A-144	CF ₃	CH ₂ F	CH ₃	A-185	CH ₃	OCH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-145	CF ₃	CHF ₂	CH ₃	A-186	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃
A-146	CF ₃	CF ₃	CH ₃	A-187	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-147	CF ₃	CH ₂ CH ₂ F	CH ₃	A-188	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
A-148	CF ₃	CH ₂ CHF ₂	CH ₃	A-189	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-149	CF ₃	CH ₂ CF ₃	CH ₃	A-190	CH ₃	SCH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-150	CF ₃	c-C ₃ H ₅	CH ₃	A-191	CH ₃	SCH ₃	N(CH ₃) ₂
A-151	CF ₃	c-C ₄ H ₇	CH ₃	A-192	CH ₃	SCH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-152	CF ₃	c-C ₅ H ₉	CH ₃	A-193	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
A-153	CF ₃	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	A-194	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-154	CF ₃	CH ₂ -C-C ₃ H ₅	CH ₃	A-195	CH ₃	N(CH ₃) ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-155	CF ₃	CH ₂ -C-C ₄ H ₇	CH ₃	A-196	CHF ₂	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃
A-156	CF ₃	CH ₂ -C-C ₅ H ₉	CH ₃	A-197	CHF ₂	OCH ₃	SCH ₃
A-157	CF ₃	CH ₂ -C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	A-198	CHF ₂	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-158	CF ₃	CH ₂ CN	CH ₃	A-199	CHF ₂	OCH ₃	N(CH ₃) ₂
A-159	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CN	CH ₃	A-200	CHF ₂	OCH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-160	CF ₃	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	A-201	CHF ₂	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃
A-161	CF ₃	CH(CH ₃)OCH ₃	CH ₃	A-202	CHF ₂	OCH ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-162	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₃	A-203	CHF ₂	OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂
A-163	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	A-204	CHF ₂	OCH ₂ CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂
A-164	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	A-205	CHF ₂	SCH ₃	SCH ₂ CH ₃
A-165	CH ₃	SCH ₃	SCH ₃	A-206	CHF ₂	SCH ₃	N(CH ₃) ₂

10

20

30

40

No.	R ²	R ⁵	R ⁴	No.	R ²	R ⁵	R ⁴
A-207	CHF ₂	SCH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-232	CH ₃	N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)	
A-208	CHF ₂	SCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	A-233	CH ₃	O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	
A-209	CHF ₂	SCH ₂ CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-234	CH ₃	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂	
A-210	CHF ₂	N(CH ₃) ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-235	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂	
A-211	CF ₃	OCH ₃	OCH ₂ CH ₃	A-236	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-212	CF ₃	OCH ₃	SCH ₃	A-237	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-213	CF ₃	OCH ₃	SCH ₂ CH ₃	A-238	CHF ₂	O-CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-214	CF ₃	OCH ₃	N(CH ₃) ₂	A-239	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂	
A-215	CF ₃	OCH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-240	CHF ₂	O-CH ₂ CH ₂ -O	
A-216	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH ₃	A-241	CHF ₂	S-CH ₂ CH ₂ -S	
A-217	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	SCH ₂ CH ₃	A-242	CHF ₂	N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)	
A-218	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	A-243	CHF ₂	O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	
A-219	CF ₃	OCH ₂ CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-244	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂	
A-220	CF ₃	SCH ₃	SCH ₂ CH ₃	A-245	CHF ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂	
A-221	CF ₃	SCH ₃	N(CH ₃) ₂	A-246	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-222	CF ₃	SCH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-247	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-223	CF ₃	SCH ₂ CH ₃	N(CH ₃) ₂	A-248	CF ₃	O-CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-224	CF ₃	SCH ₂ CH ₃	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-249	CF ₃	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂	
A-225	CF ₃	N(CH ₃) ₂	N(CH ₂ CH ₃) ₂	A-250	CF ₃	O-CH ₂ CH ₂ -O	
A-226	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		A-251	CF ₃	S-CH ₂ CH ₂ -S	
A-227	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		A-252	CF ₃	N(CH ₃)-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃)	
A-228	CH ₃	O-CH ₂ CH ₂ CH ₂		A-253	CF ₃	O-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	
A-229	CH ₃	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂		A-254	CF ₃	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂	
A-230	CH ₃	O-CH ₂ CH ₂ -O		A-255	CF ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂	
A-231	CH ₃	S-CH ₂ CH ₂ -S					

10

20

【0162】

本発明は、少なくとも1種の本発明の化合物と、本明細書の以下で定義する少なくとも1種の混合パートナーとの混合物に関する。成分Iとしての本発明の1種の化合物と、成分IIとしての本明細書の以下で定義する1種の混合パートナーとの二成分混合物が好ましい。このような二成分混合物の好ましい重量比は、5000：1～1：5000、好ましくは1000：1～1：1000、より好ましくは100：1～1：100、特に好ましくは10：1～1：10である。このような二成分混合物では、成分I及びIIは、等量で使用され得るか、あるいは、過剰の成分I、又は過剰の成分IIが使用され得る。

30

【0163】

混合パートナーは、殺有害生物剤、特に殺虫剤、殺線虫剤及び殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、植物成長調節剤、肥料などから選択することができる。好ましい混合パートナーは、殺虫剤、殺線虫剤及び殺菌剤である。

40

【0164】

本発明の化合物と一緒に使用することができ、有望な相乗作用効果が生み出され得る、殺虫剤抵抗性対策委員会(IRAC)の作用様式による分類によりグループ化され、番号付けされた殺有害生物剤の以下の一覧Mは、可能な組合せを例示することを意図するものであるが、いかなる制限も課すことを意図するものではない：

【0165】

M.1 アセチルコリンエステラーゼ(AChE)阻害剤： M.1A カルバメート類(carbamates)のクラスから、例えば、アルジカルブ(aldicarb)、アラニカルブ(alanycarb)、ベンジオカルブ(bendiocarb)、ベンフラカルブ(benfuracarb)、ブトカルボキシム(butocarboxim)、ブトキシカルボキシム(butoxycarboxim)、カルバリル(carbaryl)、カルボフラン(carbofu

50

ran)、カルボスルファン(carbosulfan)、エチオフエンカルブ(ethiofencarb)、フェノブカルブ(fenobucarb)、ホルメタネート(formetanate)、フラチオカルブ(furathiocarb)、イソプロカルブ(isoprocab)、メチオカルブ(methiocarb)、メソミル(methomyl)、メトルカルブ(metolcarb)、オキサミル(oxamyl)、ピリミカルブ(pirimicarb)、プロボクスル(propoxur)、チオジカルブ(thiodicarb)、チオフアノックス(thiofanox)、トリメタカルブ(trimethacarb)、XMC、キシリルカルブ(xylylcarb)及びトリアザメート(triazamate);又はM.1B 有機リン酸類のクラスから、例えば、アセフェート(acephate)、アザメチホス(azamethiphos)、アジンホス-エチル(azinphos-ethyl)、アジンホスメチル(azinphosmethyl)、カズサホス(cadusafos)、クロルエトキシホス(chlorethoxyfos)、クロルフェンビンホス(chlorfenvinphos)、クロルメホス(chlormephos)、クロルピリホス(chlorpyrifos)、クロルピリホス-メチル(chlorpyrifos-methyl)、クマホス(coumaphos)、シアノホス(cyanophos)、デメトン-S-メチル(demeton-S-methyl)、ダイアジノン(diazinon)、ジクロルボス(dichlorvos)/DDVP、ジクロトホス(dicrotophos)、ジメトエート(dimethoate)、ジメチルビンホス(dimethylvinphos)、ジスルホトン(disulfoton)、EPN、エチオン(ethion)、エトプロホス(ethoprophos)、ファミフル(famphur)、フェナミホス(fenamiphos)、フェニトロチオン(fenitrothion)、フェンチオン(fenthion)、ホスチアゼート(fosthiazate)、ヘプテノホス(heptenophos)、イミシアホス(imicyafos)、イソフェンホス(isofenphos)、イソプロピル0-(メトキシアミノチオ-ホスホリル)サリチレート(isopropyl 0-(methoxyaminothio-phosphoryl)salicylate)、イソキサチオン(isoxathion)、馬拉チオン(malathion)、メカルバム(mecarbam)、メタミドホス(methamidophos)、メチダチオン(methidathion)、メビンホス(mevinphos)、モノクロトホス(monocrotophos)、ナレド(naled)、オメトエート(omethoate)、オキシデメトン-メチル(oxydemeton-methyl)、パラチオン(parathion)、パラチオン-メチル(parathion-methyl)、フェントエート(phenthoate)、フォレート(phorate)、フォサロン(phosalone)、フォスメット(phosmet)、フォスファミドン(phosphamidon)、フォキシム(phoxim)、ピリミホス-メチル(pirimiphos-methyl)、プロフェノホス(profenofos)、プロベタンホス(propetamphos)、プロチオホス(prothiofos)、ピラクロホス(pyraclofos)、ピリダフェンチオン(pyridaphenthion)、キナルホス(quinalphos)、スルホテップ(sulfotep)、テブピリムホス(tebupirimfos)、テムホス(temephos)、テルブホス(terbufos)、テトラクロルビンホス(tetrachlorvinphos)、チオメトン(thiometon)、トリアゾホス(triazophos)、トリクロルホン(trichlorfon)及びバミドチオン(vamidothion);

【0166】

M.2. GABA依存性クロライドチャネルアンタゴニスト、例えば、:M.2Aシクロジエン有機塩素化合物、例えば、エンドスルファン(endosulfan)又はクロルデン(chlordane);又はM.2B フィプロール類(fiproles)(フェニルピラゾール類(phenylpyrazoles))、例えば、エチプロール(ethiprole)、フィプロニル(fipronil)、フルフィプロール(flufiprole)、ピラフルプロール(pyrafluprole)及びピリプロール(pyriprole);

【0167】

M.3 ナトリウムチャネル調節因子、M.3A ピレスロイド類(pyrethroids)のクラスから、例えば、アクリナトリン(acrinathrin)、アレスリン(allethrin)、d-cis-transアレスリン(d-cis-trans allethrin)、d-transアレスリン(d-trans allethrin)、ビフェントリン(bifenthrin)、バイオアレスリン(bioallethrin)、バイオアレスリンS-シクロペンテニル(bioallethrin S-cyclopentenyl)、バイオレスメトリン(bioresmethrin)、シクロプロトリン(cycloprothrin)、シフルトリン(cyfluthrin)、ベータ-シフルトリン(beta-cyfluthrin)、シハロトリン(cyhalothrin)、ラムダ-シハロトリン(lambda-cyhalothrin)、ガンマ-シハロトリン(gamma-cyhalothrin)、シベルメトリン(cypermethrin)、アルファ-シベルメトリン(alpha-cypermethrin)、ベータ-シベルメトリン(beta-cypermethrin)、シータ-シベルメトリン(theta-cypermethrin)、ゼータ-シベルメトリン(zeta-cypermethrin)、シフェノトリン(cyphenothrin)、デルタメトリン(deltamethrin)、エンペントリン(empenthrin)、エスフェンバレレート(esfenvalerate)、エトフェンプロックス(etofenprox)、フェンプロパトリン(fenpropathrin)、フェンバレレート(fenvalerate)、フルシトリネート(flucy

thrinate)、フルメトリン(flumethrin)、タウ-フルバリネート(tau-fluvalinate)、ハルフエンプロックス(halfenprox)、ヘプタフルトリン(heptafluthrin)、イミプロトリン(imiprothrin)、メペルフルトリン(meperfluthrin)、メトフルトリン(metofluthrin)、モンフルオロトリン(momfluorothrin)、ペルメトリン(permethrin)、フェノトリン(phenothrin)、プラレトリン(prallethrin)、プロフルトリン(profluthrin)、ピレトリン(pyrethrin)(除虫菊(pyrethrum))、レスメトリン(resmethrin)、シラフルオフエン(silafluofen)、テフルトリン(tefluthrin)、テトラメチルフルトリン(tetramethylfluthrin)、テトラメトリン(tetramethrin)、トラロメトリン(tralomethrin)及びトランスフルトリン(transfluthrin)；又はM.3B ナトリウムチャンネル調節因子、例えば、DDT又はメトキシクロル(methoxychlor)；

10

【0168】

M.4 ニコチン性アセチルコリン受容体アゴニスト(nAChR)、M.4A ネオニコチノイド類(neonicotinoids)のクラスから、例えば、アセタミプリド(acetamiprid)、クロチアニジン(clothianidin)、シクロキサプリド(cycloxaprid)、ジノテフラン(dinotefuran)、イミダクロプリド(imidacloprid)、ニテンピラム(nitenpyram)、チアクロプリド(thiacloprid)及びチアメトキサム(thiamethoxam)；又は化合物M.4A.2：(2E-)-1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-N'-ニトロ-2-ペンチリデンヒドラジンカルボキシイミドアミド；又はM4.A.3：1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-7-メチル-8-ニトロ-5-プロポキシ-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジン；又はM.4B ニコチンのクラスから；

20

【0169】

M.5 ニコチン性アセチルコリン受容体アロステリック活性化剤、スピノシン類(spinosyns)のクラスから、
例えば、スピノサド(spinosad)又はスピネトラム(spinetoram)；

【0170】

M.6 クロライドチャンネル活性化剤、アベルメクチン類(ivermectins)及びミルベマイシン類(milbemycins)のクラスから、例えば、アバメクチン(abamectin)、エマメクチン安息香酸塩(emamectin benzoate)、イベルメクチン(ivermectin)、レピメクチン(lepimectin)又はミルベメクチン(milbemectin)；

【0171】

M.7 幼若ホルモン模倣物(Juvenile hormone mimics)、例えば、M.7A 幼若ホルモン類縁体(juvenile hormone analogues)、例えば、ハイドロプレネ(hydroprene)、キノプレネ(kinoprene)及びメトプレネ(methoprene)；又はその他のもの、例えば、M.7B フェノキシカルブ(fenoxycarb)又はM.7C ピリプロキシフェン(pyriproxyfen)；

30

【0172】

M.8 雑多な非特異的(多部位)阻害剤、例えば、M.8A アルキルハロゲン化物、例えば、臭化メチル及び他のアルキルハロゲン化物、又はM.8B クロロピクリン(chloropicrin)、又はM.8C フッ化スルフルル(sulfuryl fluoride)、又はM.8D ホウ砂(borax)、又はM.8E 吐酒石(tartar emetic)；

【0173】

M.9 選択的同翅類摂食遮断剤、例えば、M.9B ピメトロジン(pymetrozine)、又はM.9C フロニカミド(flonicamid)；

40

【0174】

M.10 ダニ成長阻害剤、例えば、M.10A クロフェンテジン(clofentezine)、ヘキシチアゾクス(hexythiazox)及びジフロビダジン(diflovidazin)、又はM.10B エトキサゾール(etoxazole)；

【0175】

M.11 昆虫の中腸膜に対する微生物攪乱剤、例えば、バチルス・チューリングゲンシス(bacillus thuringiensis)又はバチルス・スファエリクス(bacillus sphaericus)及びそれら
が作り出す殺虫性タンパク質、例えば、バチルス・チューリングゲンシス亜種イスラエレンシス(bacillus thuringiensis subsp. israelensis)、バチルス・スファエリクス(bacill

50

us sphaericus)、バチルス・チューリングゲンシス亜種アイザワイ(bacillus thuringiensis subsp. aizawai)、バチルス・チューリングゲンシス亜種クルスタキー(bacillus thuringiensis subsp. kurstaki)及びバチルス・チューリングゲンシス亜種テネブリオニス(bacillus thuringiensis subsp. tenebrionis)、又はBt産物タンパク質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry2Ab、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb及びCry34/35Ab1；

【0176】

M.12 ミトコンドリアATPシンターゼ阻害剤、例えば、M.12A ジアフェンチウロン(diafenthiuron)、又はM.12B 有機スズ殺ダニ剤、例えば、アゾシクロチン(azocyclotin)、シヘキサチン(cyhexatin)又はフェンブタチンオキシド(fenbutatin oxide)、又はM.12C プロパルギット(propargite)、又はM.12D テトラジホン(tetradifon)；

10

【0177】

M.13 プロトン勾配の攪乱による酸化的リン酸化の脱共役剤、例えば、クロルフェナピル(chlorfenapyr)、DNOC又はスルフルアミド(sulfluramid)；

【0178】

M.14 ニコチン性アセチルコリン受容体(nAChR)チャネル遮断剤、例えば、ネライストキシン類縁体(nereistoxin analogues)、例えば、ベンスルタップ(bensultap)、カルタップ塩酸塩(cartap hydrochloride)、チオシクラム(thiocyclam)又はチオスルタップナトリウム(thiosultap sodium)；

【0179】

M.15 キチン生合成阻害剤0型、例えば、ベンゾイルウレア類(benzoylureas)、例えば、ビストリフルロン(bistrifluron)、クロルフルアズロン(chlorfluazuron)、ジフルベンズロン(diflubenzuron)、フルシクロクスロン(flucycloxuron)、フルフェノクスロン(flufenoxuron)、ヘキサフルムロン(hexaflumuron)、ルフエヌロン(lufenuron)、ノバルロン(novaluron)、ノビフルムロン(noviflumuron)、テフルベンズロン(teflubenzuron)又はトリフルムロン(triflumuron)；

20

【0180】

M.16 キチン生合成阻害剤1型、例えば、ブプロフェジン(buprofezin)；

【0181】

M.17 脱皮攪乱剤、双翅類(Dipteran)、例えば、シロマジン(cyromazine)；

【0182】

30

M.18 エクジソン受容体アゴニスト、例えば、ジアシルヒドラジン類(diacylhydrazines)、例えば、メトキシフェノジド(methoxyfenozide)、テブフェノジド(tebufenozide)、ハロフェノジド(halofenozide)、フフェノジド(fufenozide)又はクロマフェノジド(chromafenozide)；

【0183】

M.19 オクトパミン受容体アゴニスト、例えば、アミトラズ(amtiraz)；

【0184】

M.20 ミトコンドリア複合体III電子伝達阻害剤、例えば、M.20A ヒドラメチルノン(hydr amethylnon)、又はM.20B アセキノシル(acequinocyl)、又はM.20C フルアクリピリム(flu acrypyrim)；

40

【0185】

M.21 ミトコンドリア複合体I電子伝達阻害剤、例えば、M.21A METI殺ダニ剤及び殺虫剤、例えば、フェナザキン(fenazaquin)、フェンピロキシメート(fenpyroximate)、ピリミジフェン(pyrimidifen)、ピリダベン(pyridaben)、テブフェンピラド(tebufenpyrad)又はトルフェンピラド(tolfenpyrad)、又はM.21B ロテノン(rotenone)；

【0186】

M.22 電位依存性ナトリウムチャネル遮断剤、例えば、M.22A インドキサカルブ(indoxacarb)、又はM.22B メタフルミゾン(metaflumizone)、又はM.22B.1： 2-[2-(4-シアノフェニル)-1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチリデン]-N-[4-(ジフルオロメトキシ)フェニル]-ヒドラジンカルボキサミド又はM.22B.2： N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-2-[(

50

4-クロロフェニル)[4-[メチル(メチルスルホニル)アミノ]フェニル]メチレン]-ヒドラジンカルボキサミド；

【0187】

M.23 アセチルCoAカルボキシラーゼの阻害剤、例えば、テトロロン酸及びテトラミン酸の誘導体、例えば、スピロジクロフェン(spirodiclofen)、スピロメシフェン(spiromesifen)又はスピロテトラマト(spirotetramat)；

【0188】

M.24 ミトコンドリア複合体IV電子伝達阻害剤、例えば、M.24A ホスフィン(phosphine)、例えば、リン化アルミニウム(aluminium phosphide)、リン化カルシウム(calcium phosphide)、ホスフィン(phosphine)又はリン化亜鉛(zinc phosphide)、又はM.24B シアニド(cyanide)；

10

【0189】

M.25 ミトコンドリア複合体II電子伝達阻害剤、例えば、ベータ-ケトニトリル誘導体、例えば、シエノピラフェン(cyenopyrafen)又はシフルメトフェン(cyflumetofen)；

【0190】

M.28 リアノジン受容体調節因子、ジアミド類(diamides)のクラスから、例えば、フルベンジアミド(flubendiamide)、クロラントラニリプロール(chlorantraniliprole)(rynaxypyr(登録商標))、シアントラニリプロール(cyantraniliprole)(cyazapyr(登録商標))、テトラニリプロール(tetraniliprole)、又はフタルアミド化合物(phthalamide compounds)M.28.1： (R)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド及びM.28.2： (S)-3-クロロ-N1-{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル}-N2-(1-メチル-2-メチルスルホニルエチル)フタルアミド、又は化合物M.28.3： 3-ブromo-N-{2-ブromo-4-クロロ-6-[(1-シクロプロピルエチル)カルバモイル]フェニル}-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド(提案されたISO名： シクラニリプロール(cyclaniliprole))、又は化合物M.28.4： メチル-2-[3,5-ジブromo-2-({[3-ブromo-1-(3-クロロピリジン-2-イル)-1H-ピラゾール-5-イル]カルボニル}アミノ)ベンゾイル]-1,2-ジメチルヒドラジンカルボキシレート；又はM.28.5a)～M.28.5d)及びM.28.5h)～M.28.5l)から選択される化合物： M.28.5a) N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド； M.28.5b) N-[4-クロロ-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド； M.28.5c) N-[4-クロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-6-メチル-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド； M.28.5d) N-[4,6-ジクロロ-2-[(ジ-2-プロピル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド； M.28.5h) N-[4,6-ジブromo-2-[(ジエチル-ラムダ-4-スルファニリデン)カルバモイル]-フェニル]-2-(3-クロロ-2-ピリジル)-5-(トリフルオロメチル)ピラゾール-3-カルボキサミド； M.28.5i) N-[2-(5-アミノ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-クロロ-6-メチルフェニル]-3-ブromo-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド； M.28.5j) 3-クロロ-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-N-[2,4-ジクロロ-6-[(1-シアノ-1-メチルエチル)アミノ]カルボニル]フェニル]-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド； M.28.5k) 3-ブromo-N-[2,4-ジクロロ-6-(メチルカルバモイル)フェニル]-1-(3,5-ジクロロ-2-ピリジル)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド； M.28.5l) N-[4-クロロ-2-[(1,1-ジメチルエチル)アミノ]カルボニル]-6-メチルフェニル]-1-(3-クロロ-2-ピリジニル)-3-(フルオロメトキシ)-1H-ピラゾール-5-カルボキサミド；又はM.28.6： N-(2-シアノプロパン-2-イル)-N-(2,4-ジメチルフェニル)-3-ヨードベンゼン-1,2-ジカルボキサミド；又はM.28.7： 3-クロロ-N-(2-シアノプロパン-2-イル)-N-(2,4-ジメチルフェニル)-ベンゼン-1,2-ジカルボキサミドから選択される化合物；

20

30

40

50

【0191】

M.29. 作用機序が未知又ははっきりしていない殺虫活性化合物、例えば、アフィドピロペン(afidopyropen)、アフォキサネル(afoxolaner)、アザジラクチン(azadirachtin)、アミドフルメット(amidoflumer)、ベンゾキシメート(benzoximate)、ビフェナゼート(bifenazate)、ブロフラニリド(broflanilide)、ブロモプロピレート(bromopropylate)、キノメチオネート(chinomethionat)、クリオライト(cryolite)、ジクロロメゾチアズ(dicloromezotiaz)、ジコホル(dicofol)、フルフェネリム(flufenerim)、フロメトキン(flometoquin)、フルエンシルホン(fluensulfone)、フルヘキサホン(fluhexafon)、フルオピラム(flupyrpyram)、フルピラジフロネ(flupyradifurone)、フルララネル(fluralaner)、メトキサジアゾン(metoxadiazon)、ピペロニルブトキシド(piperonyl butoxide)、ピフルブミド(pyflubumide)、ピリダリル(pyridalyl)、ピリフルキナゾン(pyrifluquinazon)、スルホキサフロル(sulfoxaflor)、チオキサザフェン(tioxazafen)、トリフルメゾピリム(triflumezopyrim)、又は化合物

10

【0192】

M.29.3: 11-(4-クロロ-2,6-ジメチルフェニル)-12-ヒドロキシ-1,4-ジオキサ-9-アザジスピロ[4.2.4.2]-テトラデカ-11-エン-10-オン、又は化合物

【0193】

M.29.4: 3-(4'-フルオロ-2,4-ジメチルビフェニル-3-イル)-4-ヒドロキシ-8-オキサ-1-アザスピロ[4.5]デカ-3-エン-2-オン、又は化合物

【0194】

M.29.5: 1-[2-フルオロ-4-メチル-5-[(2,2,2-トリフルオロエチル)スルフィニル]フェニル]-3-(トリフルオロメチル)-1H-1,2,4-トリアゾール-5-アミン、又はバチルス・フィルムス(Bacillus firmus)(Votivo、I-1582)に基づく活性剤；又は

20

【0195】

M.29.6の群から選択される化合物、ここで、化合物は、M.29.6a)～M.29.6k)から選択される： M.29.6a) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド； M.29.6b) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-5-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド； M.29.6c) (E/Z)-2,2,2-トリフルオロ-N-[1-[(6-フルオロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]アセトアミド； M.29.6d) (E/Z)-N-[1-[(6-ブromo-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド； M.29.6e) (E/Z)-N-[1-[1-(6-クロロ-3-ピリジル)エチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド； M.29.6f) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド； M.29.6g) (E/Z)-2-クロロ-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2-ジフルオロ-アセトアミド； M.29.6h) (E/Z)-N-[1-[(2-クロロピリミジン-5-イル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-アセトアミド； M.29.6i) (E/Z)-N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,3,3,3-ペンタフルオロ-プロパンアミド； M.29.6j) N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-チオアセトアミド；又はM.29.6k) N-[1-[(6-クロロ-3-ピリジル)メチル]-2-ピリジリデン]-2,2,2-トリフルオロ-N'-イソプロピル-アセトアミジン；又は化合物

30

40

【0196】

M.29.8: 8-クロロ-N-[2-クロロ-5-メトキシフェニル]スルホニル]-6-トリフルオロメチル)-イミダゾ[1,2-a]ピリジン-2-カルボキサミド；又は化合物

【0197】

M.29.9.a)： 4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-(トリフルオロメチル)-4H-イソオキサゾール-3-イル]-2-メチル-N-(1-オキサチエタン-3-イル)ベンズアミド；又はM.29.9.b)： 4-[5-(3,5-ジクロロフェニル)-5-トリフルオロメチル-4,5-ジヒドロイソオキサゾール-3-イル]-N-[(メトキシイミノ)メチル]-2-メチルベンズアミド；又は

【0198】

M.29.10: 5-[3-[2,6-ジクロロ-4-(3,3-ジクロロアリルオキシ)フェノキシ]プロポキシ]-

50

1H-ピラゾール；又は

【0199】

M.29.11の群から選択される化合物、ここで、化合物は、M.29.11b)～M.29.11p)から選択される： M.29.11.b) 3-(ベンゾイルメチルアミノ)-N-[2-ブromo-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド；M.29.11.c) 3-(ベンゾイルメチルアミノ)-2-フルオロ-N-[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベンズアミド；M.29.11.d) N-[3-[[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-N-メチル-ベンズアミド； M.29.11.e) N-[3-[[[2-ブromo-4-[1,2,2,2-テトラフル
10 オロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボ
ニル]-2-フルオロフェニル]-4-フルオロ-N-メチル-ベンズアミド； M.29.11.f) 4-フルオ
ロ-N-[2-フルオロ-3-[[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)
エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-N-メチル-ベン
ズアミド； M.29.11.g) 3-フルオロ-N-[2-フルオロ-3-[[[2-ヨード-4-[1,2,2,2-テトラフ
ルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェニル]アミノ]カル
ボニル]フェニル]-N-メチル-ベンズアミド； M.29.11.h) 2-クロロ-N-[3-[[[2-ヨード-4-
[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]-6-(トリフルオロメチル)フェ
ニル]アミノ]カルボニル]フェニル]-3-ピリジンカルボキサミド； M.29.11.i) 4-シアノ-
N-[2-シアノ-5-[[2,6-ジブromo-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)
20 プロピル]フェニル]カルバモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド； M.29.11.j) 4-
シアノ-3-[(4-シアノ-2-メチル-ベンゾイル)アミノ]-N-[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,3,3,3-
ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド
；M.29.11.k) N-[5-[[2-クロロ-6-シアノ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフル
オロメチル)プロピル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-
ベンズアミド； M.29.11.l) N-[5-[[2-ブromo-6-クロロ-4-[2,2,2-トリフルオロ-1-ヒド
ロキシ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-フェニル]-4-
シアノ-2-メチル-ベンズアミド； M.29.11.m) N-[5-[[2-ブromo-6-クロロ-4-[1,2,2,3,3,
3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル]カルバモイル]-2-シアノ-
フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド；M.29.11.n) 4-シアノ-N-[2-シアノ-5-[[2,
6-ジクロロ-4-[1,2,2,3,3,3-ヘキサフルオロ-1-(トリフルオロメチル)プロピル]フェニル
]カルバモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド； M.29.11.o) 4-シアノ-N-[2-シアノ-
5-[[2,6-ジクロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル
]カルバモイル]フェニル]-2-メチル-ベンズアミド； M.29.11.p) N-[5-[[2-ブromo-6-ク
ロロ-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]カルバモイ
ル]-2-シアノ-フェニル]-4-シアノ-2-メチル-ベンズアミド；又は

【0200】

M.29.12の群から選択される化合物、ここで、化合物は、M.29.12a)～M.29.12m)から選択
される： M.29.12.a) 2-(1,3-ジオキサソ-2-イル)-6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-
ピリジン； M.29.12.b) 2-[6-[2-(5-フルオロ-3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-2-ピリジニ
40 ル]-ピリミジン； M.29.12.c) 2-[6-[2-(3-ピリジニル)-5-チアゾリル]-2-ピリジニル]-
ピリミジン； M.29.12.d) N-メチルスルホニル-6-[2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]ピ
リジン-2-カルボキサミド； M.29.12.e) N-メチルスルホニル-6-[2-(3-ピリジル)チアゾ
ール-5-イル]ピリジン-2-カルボキサミド；M.29.12.f) N-エチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリ
ジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.g) N-メチル-N-[4-
メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.h)
N,2-ジメチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-3-メチルチオ-プロパン
アミド； M.29.12.i) N-エチル-2-メチル-N-[4-メチル-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イ
ル]-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.j) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾ
ール-5-イル]-N-エチル-2-メチル-3-メチルチオ-プロパンアミド； M.29.12.k) N-[4-クロ
50

ロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N,2-ジメチル-3-メチルチオ-プロパンアミド；M.29.12.1) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N-メチル-3-メチルチオ-プロパンアミド；M.29.12.m) N-[4-クロロ-2-(3-ピリジル)チアゾール-5-イル]-N-エチル-3-メチルチオ-プロパンアミド；又は化合物

【0201】

M.29.14a) 1-[(6-クロロ-3-ピリジニル)メチル]-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロ-5-メトキシ-7-メチル-8-ニトロ-イミダゾ[1,2-a]ピリジン；又はM.29.14b) 1-[(6-クロロピリジン-3-イル)メチル]-7-メチル-8-ニトロ-1,2,3,5,6,7-ヘキサヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジン-5-オール；又は化合物

【0202】

M.29.16a) 1-イソプロピル-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；又はM.29.16b) 1-(1,2-ジメチルプロピル)-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16c) N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-1-(2,2,2-トリフルオロ-1-メチル-エチル)ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16d) 1-[1-(1-シアノシクロプロピル)エチル]-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16e) N-エチル-1-(2-フルオロ-1-メチル-プロピル)-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16f) 1-(1,2-ジメチルプロピル)-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16g) 1-[1-(1-シアノシクロプロピル)エチル]-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16h) N-メチル-1-(2-フルオロ-1-メチル-プロピル)-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；M.29.16i) 1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-N-エチル-5-メチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド；又はM.29.16j) 1-(4,4-ジフルオロシクロヘキシル)-N,5-ジメチル-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド。

【0203】

上で一覧表示した群Mの市販の化合物は、他の刊行物の中でもThe Pesticide Manual、第16版、C. MacBean、British Crop Protection Council (2013)において見出し得る。オンラインのPesticide Manualは、定期的に更新され、<http://bcpdata.com/pesticide-manual.html>からアクセス可能である。

【0204】

ISOコモンネーム(一般名)を提供する殺有害生物剤についての別のオンラインデータベースは、<http://www.alanwood.net/pesticides>である。

【0205】

M.4 ネオニコチノイドのシクロキサプリド(cycloxaprid)は、WO 2010/069266及びWO 2011/069456から知られており、ネオニコチノイドM.4A.2は、グアジピル(guadipyr)と称されることもあり、WO 2013/003977から知られており、ネオニコチノイドM.4A.3(中国においてパイコンジン(paichongding)として認可)は、WO 2007/101369から公知である。メタフルミゾン類縁体(metaflumizone analogue)M.22B.1は、CN10171577に記載されており、類縁体M.22B.2は、CN102126994に記載されている。フタルアミドM.28.1及びM.28.2は、共にWO 2007/101540から公知である。アントラニルアミドM.28.3は、WO 2005/077934に記載されている。ヒドラジド化合物M.28.4は、WO 2007/043677に記載されている。アントラニルアミドM.28.5a)～M.28.5d)及びM.28.5h)は、WO 2007/006670、WO 2013/024009及びWO 2013/024010に記載されており、アントラニルアミドM.28.5i)は、WO 2011/085575に記載されており、M.28.5j)は、WO 2008/134969に記載されており、M.28.5k)は、US2011/046186に記載されており、M.28.5l)は、WO 2012/034403に記載されている。ジアミド化合物M.28.6及びM.28.7は、CN102613183に見出すことができる。スピロケタール-置換環状ケトエノール誘導体M.29.3は、WO 2006/089633から公知であり、ビフェニル-置換スピロ環式ケトエノール誘導体M.29.4は、WO 2008/067911から公知である。トリアゾイルフェニルスルフィドM.29.5は、WO 2006/043635に記載されており、バチルス・フィルムス(Bacillus firmus)に基づく生物学的制御剤は、WO 2009/124707に記載されている。M.29.6に一覧表示さ

10

20

30

40

50

れている化合物M.29.6a)～M.29.6i)は、WO 2012/029672に記載されており、M.29.6j)及びM.29.6k)は、WO 2013/129688に記載されている。殺線虫剤M.29.8は、WO 2013/055584から公知である。イソオキサゾリンM.29.9.a)は、WO 2013/050317に記載されている。イソオキサゾリンM.29.9.b)は、WO 2014/126208に記載されている。ピリダリル系類縁体(pyridalyl-type analogue)M.29.10は、WO 2010/060379から公知である。カルボキサミド類(carboxamides)ブロフラニリド(broflanilide)及びM.29.11.b)～M.29.11.h)は、WO 2010/018714に記載されており、カルボキサミド類(carboxamides)M.29.11.i)～M.29.11.p)は、WO 2010/127926に記載されている。ピリジルチアゾール類(pyridylthiazoles)M.29.12.a)～M.29.12.c)は、WO 2010/006713から公知であり、M.29.12.d)及びM.29.12.e)は、WO 2012/000896から公知であり、M.29.12.f)～M.29.12.m)は、WO 2010/129497から公知である。化合物M.29.14a)及びM.29.14b)は、WO 2007/101369から公知である。ピラゾールM.29.16.a)～M.29.16h)は、それぞれ、WO 2010/034737、WO 2012/084670及びWO 2012/143317に記載されており、ピラゾールM.29.16i)及びM.29.16j)は、US 61/891437に記載されている。

10

【0206】

本発明の化合物と一緒に使用することができる、殺菌剤の以下の一覧は、可能な組合せを例示することを意図するものであるが、それらを制限するものではない：

【0207】

A)呼吸阻害剤

-Qo部位における複合体III阻害剤(例えば、ストロビルリン類(strobilurins))： アゾキシストロビン(azoxystrobin)(A.1.1)、クメトキシストロビン(coumethoxystrobin)(A.1.2)、クモキシストロビン(coumoxystrobin)(A.1.3)、ジモキシストロビン(dimoxystrobin)(A.1.4)、エネストロブリン(enestroburin)(A.1.5)、フェナミンストロビン(fenaminstrobin)(A.1.6)、フェノキシストロビン(fenoxystrobin)/フルフェノキシストロビン(flufenoxystrobin)(A.1.7)、フルオキサストロビン(fluxastrobin)(A.1.8)、クレソキシム-メチル(kresoxim-methyl)(A.1.9)、マンデストロビン(mandestrobin)(A.1.10)、メトミノストロビン(metominostrobin)(A.1.11)、オリサストロビン(orysastrobin)(A.1.12)、ピコキシストロビン(picoxy.strobin)(A.1.13)、ピラクロストロビン(pyraclostrobin)(A.1.14)、ピラメトストロビン(pyrametostrobin)(A.1.15)、ピラオキシストロビン(pyraoxystrobin)(A.1.16)、トリフロキシストロビン(trifloxystrobin)(A.1.17)、2-(2-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-1-メチル-アリリデンアミノオキシメチル)-フェニル)-2-メトキシイミノ-N-メチル-アセトアミド(A.1.18)、ピリベンカルブ(pyribencarb)(A.1.19)、トリクロピリカルブ(triclopyricarb)/クロロジンカルブ(chlorodincarb)(A.1.20)、ファモキサドン(famoxadone)(A.1.21)、フェンアミドン(fenamidone)(A.1.21)、メチル-N-[2-[(1,4-ジメチル-5-フェニル-ピラゾール-3-イル)オキシメチル]フェニル]-N-メトキシ-カルバメート(A.1.22)、1-[3-クロロ-2-[[1-(4-クロロフェニル)-1H-ピラゾール-3-イル]オキシメチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.23)、1-[3-プロモ-2-[[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.24)、1-[2-[[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.25)、1-[2-[[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-フルオロ-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.26)、1-[2-[[1-(2,4-ジクロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシメチル]-3-フルオロ-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.27)、1-[2-[[4-(4-クロロフェニル)チアゾール-2-イル]オキシメチル]-3-メチル-フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.28)、1-[3-クロロ-2-[[4-(p-トリル)チアゾール-2-イル]オキシメチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.29)、1-[3-シクロプロピル-2-[[2-メチル-4-(1-メチルピラゾール-3-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.30)、1-[3-(ジフルオロメトキシ)-2-[[2-メチル-4-(1-メチルピラゾール-3-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]-4-メチル-テトラゾール-5-オン(A.1.31)、1-メチル-4-[3-メチル-2-[[2-メチル-4-(1-メチルピラゾール-3-イル)フェノキシ]メチル]フェニル]テトラゾール-5-オン(A.1.32)、1-メチル-4-[3-メチル-2-[[1-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-エチリデンアミ

20

30

40

50

ノ]オキシメチル]フェニル]テトラゾール-5-オン(A.1.33)、(Z,2E)-5-[1-(2,4-ジクロロフェニル)ピラゾール-3-イル]-オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド(A.1.34)、(Z,2E)-5-[1-(4-クロロフェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド(A.1.35)、(Z,2E)-5-[1-(4-クロロ-2-フルオロ-フェニル)ピラゾール-3-イル]オキシ-2-メトキシイミノ-N,3-ジメチル-ペンタ-3-エンアミド(A.1.36)、

【0208】

-Qi部位における複合体III阻害剤： シアゾファミド(cyazofamid)(A.2.1)、アミスルブロム(amisulbrom)(A.2.2)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-アセトキシ-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.3)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[[3-(アセトキシメトキシ)-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.4)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[(3-イソブトキシカルボニルオキシ-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル)アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.5)、[(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[[3-(1,3-ベンゾジオキソール-5-イルメトキシ)-4-メトキシ-ピリジン-2-カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル] 2-メチルプロパノエート(A.2.6)； (3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(ヒドロキシ-4-メトキシ-2-ピリジニル)カルボニル]アミノ]-6-メチル-4,9-ジオキソ-8-(フェニルメチル)-1,5-ジオキソナン-7-イル 2-メチルプロパノエート(A.2.7)、(3S,6S,7R,8R)-8-ベンジル-3-[3-[(イソブチリルオキシ)メトキシ]-4-メトキシピコリンアミド]-6-メチル-4,9-ジオキソ-1,5-ジオキソナン-7-イル イソブチレート(A.2.8)；

【0209】

-複合体II阻害剤(例えば、カルボキサミド類(carboxamides))： ベノダニル(benodanil)(A.3.1)、ベンゾビンジフルピル(benzovindiflupyr)(A.3.2)、ビキサフェン(bixafen)(A.3.3)、ボスカリド(boscalid)(A.3.4)、カルボキシシン(carboxin)(A.3.5)、フェンフラム(fenfuram)(A.3.6)、フルオピラム(fluopyram)(A.3.7)、フルトラニル(flutolanil)(A.3.8)、フルキサピロキサド(fluxapyroxad)(A.3.9)、フラメトピル(furametpyr)(A.3.10)、イソフェタミド(isofetamid)(A.3.11)、イソピラザム(isopyrazam)(A.3.12)、メプロニル(mepiconil)(A.3.13)、オキシカルボキシシン(oxycarboxin)(A.3.14)、ペンフルフェン(penflufen)(A.3.14)、ペンチオピラド(penthiopyrad)(A.3.15)、セダキサン(sedaxane)(A.3.16)、テクロフタラム(tecloftalam)(A.3.17)、チフルザミド(thifluzamide)(A.3.18)、N-(4'-トリフルオロメチルチオビフェニル-2-イル)-3-ジフルオロメチル-1-メチル-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.19)、N-(2-(1,3,3-トリメチル-ブチル)-フェニル)-1,3-ジメチル-5-フルオロ-1H-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.20)、3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.21)、3-(トリフルオロメチル)-1-メチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.22)、1,3-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.23)、3-(トリフルオロメチル)-1,5-ジメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.24)、1,3,5-トリメチル-N-(1,1,3-トリメチルインダン-4-イル)ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.25)、N-(7-フルオロ-1,1,3-トリメチル-インダン-4-イル)-1,3-ジメチル-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.26)、N-[2-(2,4-ジクロロフェニル)-2-メトキシ-1-メチル-エチル]-3-(ジフルオロメチル)-1-メチル-ピラゾール-4-カルボキサミド(A.3.27)；

【0210】

-他の呼吸阻害剤(例えば、複合体I、脱共役剤)： ジフルメトリム(diflumetorim)(A.4.1)、(5,8-ジフルオロキナゾリン-4-イル)-{2-[2-フルオロ-4-(4-トリフルオロメチルピリジン-2-イルオキシ)-フェニル]-エチル}-アミン(A.4.2)； ニトロフェニル誘導体： ビナパクリル(binapacryl)(A.4.3)、ジノブトン(dinobuton)(A.4.4)、ジノカップ(dinocap)(A.4.5)、フルアジナム(fluazinam)(A.4.6)； フェリムゾン(ferimzone)(A.4.7)； 有機金属

10

20

30

40

50

化合物： フェンチン塩(fentin salts)、例えば、フェンチン-アセテート(fentin-acetate)(A.4.8)、フェンチンクロライド(fentin chloride)(A.4.9)又はフェンチンヒドロキシド(fentin hydroxide)(A.4.10)； アメトクトラジン(ametoctradin)(A.4.11)； 及びシルチオフアム(silthiofam)(A.4.12)；

【0211】

B)ステロール生合成阻害剤(SBI殺菌剤)

-C14デメチラーゼ阻害剤(DMI殺菌剤)： トリアゾール類(triazoles)： アザコナゾール(azaconazole)(B.1.1)、ビテルタノール(bitertanol)(B.1.2)、ブロムコナゾール(bromuconazole)(B.1.3)、シプロコナゾール(cyproconazole)(B.1.4)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)(B.1.5)、ジニコナゾール(diniconazole)(B.1.6)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)(B.1.7)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)(B.1.8)、フェンブコナゾール(fenbuconazole)(B.1.9)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)(B.1.10)、フルシラゾール(flusilazole)(B.1.11)、フルトリアホル(flutriafol)(B.1.12)、ヘキサコナゾール(hexaconazole)(B.1.13)、イミベンコナゾール(imibenconazole)(B.1.14)、イブコナゾール(ipconazole)(B.1.15)、メトコナゾール(metconazole)(B.1.17)、ミクロブタニル(myclobutanil)(B.1.18)、オキシポコナゾール(oxpoconazole)(B.1.19)、パクロブトラゾール(paclobutrazole)(B.1.20)、ペンコナゾール(penconazole)(B.1.21)、プロピコナゾール(propiconazole)(B.1.22)、プロチオコナゾール(prothioconazole)(B.1.23)、シメコナゾール(simeconazole)(B.1.24)、テブコナゾール(tebuconazole)(B.1.25)、テトラコナゾール(tetraconazole)(B.1.26)、トリアジメホン(triadimefon)(B.1.27)、トリアジメノール(triadimenol)(B.1.28)、トリチコナゾール(triticonazole)(B.1.29)、ウニコナゾール(uniconazole)(B.1.30)、1-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-5-チオシアナト-1H-[1,2,4]トリアゾロ(B.1.31)、2-[rel-(2S;3R)-3-(2-クロロフェニル)-2-(2,4-ジフルオロフェニル)-オキシラニルメチル]-2H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール(B.1.32)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール(B.1.33)、1-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-シクロプロピル-2-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)エタノール(B.1.34)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.35)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.36)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-3-メチル-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.37)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール(B.1.38)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-3-メチル-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ブタン-2-オール(B.1.39)、2-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタン-2-オール(B.1.40)、2-[4-(4-フルオロフェノキシ)-2-(トリフルオロメチル)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロパン-2-オール(B.1.41)、2-[2-クロロ-4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]-1-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンタ-3-イン-2-オール(B.1.51)； イミダゾール類(imidazoles)： イマザリル(imazalil)(B.1.42)、ペフラゾエート(pefurazoate)(B.1.43)、プロクロラズ(prochloraz)(B.1.44)、トリフルミゾール(triflumizol)(B.1.45)； ピリミジン類(pyrimidines)、ピリジン類(pyridines)及びピペラジン類(piperazines)： フェナリモル(fenarimol)(B.1.46)、ヌアリモル(nuarimol)(B.1.47)、ピリフェノックス(pyrifenoxy)(B.1.48)、トリホリン(triforin)(B.1.49)、[3-(4-クロロ-2-フルオロ-フェニル)-5-(2,4-ジフルオロフェニル)イソオキサゾール-4-イル]-(3-ピリジル)メタノール(B.1.50)；

【0212】

-デルタ14-レダクターゼ阻害剤： アルジモルフ(alldimorph)(B.2.1)、ドデモルフ(dodemorph)(B.2.2)、酢酸ドデモルフ(dodemorph-acetate)(B.2.3)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)(B.2.4)、トリデモルフ(tridemorph)(B.2.5)、フェンプロピジン(fenpropidin)(B.2.6)、ピペラリン(piperalin)(B.2.7)、スピロキサミン(spiroxamine)(B.2.8)；

【0213】

-3-ケトレダクターゼ阻害剤： フェンヘキサミド(fenhexamid)(B.3.1)；

【0214】

C) 核酸合成阻害剤

-フェニルアミド類(phenylamides)又はアシルアミノ酸殺菌剤(acyl amino acid fungicides)： ベナラキシル(benlaxyl)(C.1.1)、ベナラキシル-M(benlaxyl-M)(C.1.2)、キララキシル(kiralaxyl)(C.1.3)、メタラキシル(metalaxyl)(C.1.4)、メタラキシル-M(metalaxyl-M)(メフェノキサム(mefenoxam)、C.1.5)、オフレース(ofurace)(C.1.6)、オキサジキシル(oxadixyl)(C.1.7)；

【0215】

10

-その他： ヒメキサゾール(hymexazole)(C.2.1)、オクチリノン(octhilinone)(C.2.2)、オキソリン酸(oxolinic acid)(C.2.3)、ブピリメート(bupirimate)(C.2.4)、5-フルオロシトシン(5-fluorocytosine)(C.2.5)、5-フルオロ-2-(p-トリルメトキシ)ピリミジン-4-アミン(C.2.6)、5-フルオロ-2-(4-フルオロフェニルメトキシ)ピリミジン-4-アミン(C.2.7)；

【0216】

D) 細胞分裂及び細胞骨格阻害剤

-チューブリン阻害剤、例えば、ベンゾイミダゾール類(benzimidazoles)、チオファネート類(thiophanates)： ベノミル(benomyl)(D1.1)、カルベンダジム(carbendazim)(D1.2)、フベリダゾール(fuberidazole)(D1.3)、チアベンダゾール(thiabendazole)(D1.4)、チ
20
オファネート-メチル(thiophanate-methyl)(D1.5)； チアゾロピリミジン類(triazolopyrimidines)： 5-クロロ-7-(4-メチルピペリジン-1-イル)-6-(2,4,6-トリフルオロフェニル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン(D1.6)；

【0217】

-他の細胞分裂阻害剤： ジエトフェンカルブ(diethofencarb)(D2.1)、エタボキサム(ethaboxam)(D2.2)、ペンシクロン(pencycuron)(D2.3)、フルオピコリド(fluopicolide)(D2.4)、ゾキサミド(zoxamide)(D2.5)、メトラフェノン(metrafenone)(D2.6)、ピリオフェノン(pyrioferone)(D2.7)；

【0218】

E) アミノ酸及びタンパク質合成阻害剤

30

-メチオニン合成阻害剤(アニリノピリミジン類(anilino-pyrimidines))： シプロジニル(cyprodinil)(E.1.1)、メパニピリム(mepanipyrim)(E.1.2)、ピリメタニル(pirimethanil)(E.1.3)；

【0219】

-タンパク質合成阻害剤： プラストサイジン-S(blasticidin-S)(E.2.1)、カスガマイシン(kasugamycin)(E.2.2)、カスガマイシン塩酸塩水和物(kasugamycin hydrochloride-hydrate)(E.2.3)、ミルジオマイシン(mildiomycin)(E.2.4)、ストレプトマイシン(streptomycin)(E.2.5)、オキシテトラサイクリン(oxytetracyclin)(E.2.6)、ポリオキシシン(polyoxine)(E.2.7)、バリダマイシンA(validamycin A)(E.2.8)；

【0220】

40

F) シグナル伝達阻害剤

-MAP/ヒスチジンキナーゼ阻害剤： フルオロイミド(fluoroimid)(F.1.1)、イプロジオン(iprodione)(F.1.2)、プロシミドン(procymidone)(F.1.3)、ビンクロゾリン(vinclozolin)(F.1.4)、フェンピクロニル(fenpiclonil)(F.1.5)、フルジオキサニル(fludioxonil)(F.1.6)；

【0221】

-Gタンパク質阻害剤： キノキシフェン(quinoxifen)(F.2.1)；

【0222】

G) 脂質及び膜合成阻害剤

-リン脂質生合成阻害剤： エディフェンホス(edifenphos)(G.1.1)、イプロベンホス(ipro
50

benfos)(G.1.2)、ピラゾホス(pyrazophos)(G.1.3)、イソプロチオラン(isoprothiolane)(G.1.4)；

【0223】

-脂質過酸化物(lipid peroxidation)：ジクロラン(dicloran)(G.2.1)、キントゼン(quin tozene)(G.2.2)、テクナゼン(tecnazene)(G.2.3)、トルクトホス-メチル(tolclofos-meth yl)(G.2.4)、ビフェニル(biphenyl)(G.2.5)、クロロネブ(chloroneb)(G.2.6)、エトリジ アゾール(etridiazole)(G.2.7)；

【0224】

-リン脂質生合成及び細胞壁沈着：ジメトモルフ(dimethomorph)(G.3.1)、フルモルフ(fl umorph)(G.3.2)、マンジプロパミド(mandipropamid)(G.3.3)、ピリモルフ(pyrimorph)(G. 3.4)、ベンチアバリカルブ(benthiavalicarb)(G.3.5)、イプロバリカルブ(iprovalicarb) (G.3.6)、バリフェナレート(valifenalate)(G.3.7)及びN-(1-(1-(4-シアノ-フェニル)エ タンスルホニル)-ブタ-2-イル)カルバミン酸-(4-フルオロフェニル)エステル(G.3.8)；

【0225】

-細胞膜浸透性及び脂肪酸に作用する化合物：プロパモカルブ(propamocarb)(G.4.1)；

【0226】

-脂肪酸アミド加水分解酵素阻害剤：オキサチアピプロリン(oxathiapiprolin)(G.5.1)、 2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル-1H-ピラゾール-1-イル]アセチル}ピペリジン- 4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-5-イル}フェニルメタ ンスルホネート(G.5.2)、2-{3-[2-(1-{[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1- 20 イル]アセチル}ピペリジン-4-イル)-1,3-チアゾール-4-イル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサ ズール-5-イル}-3-クロロフェニルメタンスルホネート(G.5.3)；

【0227】

H)多部位作用性の阻害剤

-無機活性物質：ボルドー混合液(Bordeaux mixture)(H.1.1)、酢酸銅(H.1.2)、水酸化銅 (H.1.3)、オキシ塩化銅(H.1.4)、塩基性硫酸銅(H.1.5)、硫黄(H.1.6)；

【0228】

-チオ-及びジチオカルバメート類(thio- and dithiocarbamates)：ファーバム(ferbam)(H.2.1)、マンコゼブ(mancozeb)(H.2.2)、マンネブ(maneb)(H.2.3)、メタム(metam)(H.2.4)、メチラム(metiram)(H.2.5)、プロピネブ(propineb)(H.2.6)、チラム(thiram)(H.2.7) 30 、ジネブ(zineb)(H.2.8)、ジラム(ziram)(H.2.9)；

【0229】

-有機塩素化合物(例えば、フタルイミド類(phthalimides)、スルファミド類(sulfamides)、クロロニトリル類(chloronitriles)：アニラジン(anilazine)(H.3.1)、クロロタロニ ル(chlorothalonil)(H.3.2)、カプタホール(captafol)(H.3.3)、キャプタン(captan)(H.3 .4)、フォルベット(folpet)(H.3.5)、ジクロフルアニド(dichlofluanid)(H.3.6)、ジクロ ロフェン(dichlorophen)(H.3.7)、ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)(H.3.8)、 ペンタクロロフェノール(pentachlorophenole)(H.3.9)及びその塩、フタリド(phthalide)(H.3.10)、トリルフルアニド(tolylfluanid)(H.3.11)、N-(4-クロロ-2-ニトロ-フェニル)- N-エチル-4-メチル-ベンゼンスルホンアミド(H.3.12)；

【0230】

-グアニジン類(guanidines)及びその他のもの：グアニジン(guanidine)(H.4.1)、ドジン (dodine)(H.4.2)、ドジン遊離塩基(dodine free base)(H.4.3)、グアザチン(guazatine)(H.4.4)、グアザチン-アセテート(guazatine-acetate)(H.4.5)、イミノクタジン(iminocta dine)(H.4.6)、イミノクタジン-トリアセテート(iminoctadine-triacetate)(H.4.7)、イ ミノクタジン-トリス(iminoctadine-tris)(アルベシレート(albesilate))(H.4.8)、ジチ アノン(dithianon)(H.4.9)、2,6-ジメチル-1H,5H-[1,4]ジチイノ[2,3-c:5,6-c']ジピロ ール-1,3,5,7(2H,6H)-テトラオン(H.4.10)；

【0231】

I)細胞壁合成阻害剤

10

20

30

40

50

-グルカン合成阻害剤：バリダマイシン(validamycin)(I.1.1)、ポリオキシシンB(polyoxin B)(I.1.2)；

【0232】

-メラニン合成阻害剤：ピロキノロン(pyroquilon)(I.2.1)、トリシクラゾール(tricyclazole)(I.2.2)、カルプロパミド(carpropamid)(I.2.3)、ジシクロメット(dicyclomet)(I.2.4)、フェノキサニル(fenoxanil)(I.2.5)；

【0233】

J)植物防御誘導剤

-アシベンゾラル-S-メチル(acibenzolar-S-methyl)(J.1.1)、プロベナゾール(probenazole)(J.1.2)、イソチアニル(isotianil)(J.1.3)、チアジニル(tiadinil)(J.1.4)、プロヘキサジオン-カルシウム(prohexadione-calcium)(J.1.5)；ホスホネート類(phosphonates)：ホセチル(fosetyl)(J.1.6)、ホセチル-アルミニウム(fosetyl-aluminum)(J.1.7)、亜リン酸(phosphorous acid)及びその塩(J.1.8)、重炭酸カリウム又はナトリウム(J.1.9)；

【0234】

K)作用機序不明のもの

-ブロナポール(bronopol)(K.1.1)、キノメチオネート(chinomethionat)(K.1.2)、シフルフェナミド(cyflufenamid)(K.1.3)、シモキサニル(cymoxanil)(K.1.4)、ダゾメット(dazomet)(K.1.5)、デバカルブ(debacarb)(K.1.6)、ジクロメジン(diclomezine)(K.1.7)、ジフェンゾコート(difenzoquat)(K.1.8)、ジフェンゾコート-メチル硫酸塩(difenzoquat-methylsulfate)(K.1.9)、ジフェニルアミン(diphenylamin)(K.1.10)、フェンピラザミン(fenpyrazamine)(K.1.11)、フルメトベル(flumetover)(K.1.12)、フルスルファミド(flusulfamide)(K.1.13)、フルチアニル(flutianil)(K.1.14)、メタスルホカルブ(methasulfocarb)(K.1.15)、ニトラピリン(nitrapyrin)(K.1.16)、ニトロタル-イソプロピル(nitrothal-isopropyl)(K.1.18)、オキサチアピプロリン(oxathiapiprolin)(K.1.19)、トルプロカルブ(tolprocarb)(K.1.20)、オキシシン銅(oxin-copper)(K.1.21)、プロキナジド(proquinazid)(K.1.22)、テブフロキン(tebufloquin)(K.1.23)、テクロフタラム(tecloftalam)(K.1.24)、トリアゾキシド(triazoxide)(K.1.25)、2-ブトキシ-6-ヨード-3-プロピルクロメン(propylchromen)-4-オン(K.1.26)、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン(K.1.27)、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-フルオロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン(K.1.28)、2-[3,5-ビス(ジフルオロメチル)-1H-ピラゾール-1-イル]-1-[4-(4-{5-[2-クロロ-6-(プロパ-2-イン-1-イルオキシ)フェニル]-4,5-ジヒドロ-1,2-オキサゾール-3-イル}-1,3-チアゾール-2-イル)ピペリジン-1-イル]エタノン(K.1.29)、N-(シクロプロピルメトキシイミノ-(6-ジフルオロ-メトキシ-2,3-ジフルオロフェニル)-メチル)-2-フェニルアセトアミド(K.1.30)、N'-(4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K.1.31)、N'-(4-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチル-フェノキシ)-2,5-ジメチル-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K.1.32)、N'-(2-メチル-5-トリフルオロメチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロボキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K.1.33)、N'-(5-ジフルオロメチル-2-メチル-4-(3-トリメチルシラニル-プロボキシ)-フェニル)-N-エチル-N-メチルホルムアミジン(K.1.34)、メトキシ-酢酸 6-tert-ブチル-8-フルオロ-2,3-ジメチル-キノリン-4-イルエステル(K.1.35)、3-[5-(4-メチルフェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(K.1.36)、3-[5-(4-クロロ-フェニル)-2,3-ジメチル-イソオキサゾリジン-3-イル]-ピリジン(ピリソオキサゾール(pyrisoxazole))(K.1.37)、N-(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)シクロプロパンカルボン酸アミド(K.1.38)、5-クロロ-1-(4,6-ジメトキシ-ピリミジン-2-イル)-2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール(K.1.39)、2-(4-クロロ-フェニル)-N-[4-(3,4-ジメトキシ-フェニル)-イソオキサゾール-5-イル]-2-プロパ-2-イニルオキシ-アセトアミド、エチル (Z)-3-アミノ-2-シアノ-3-フェニ

10

20

30

40

50

ル-プロパ-2-エノエート(K.1.40)、ピカルブトラゾクス(picarbutrazox)(K.1.41)、ペンチル N-[6-[[[(Z)-[(1-メチルテトラゾール-5-イル)-フェニル-メチレン]アミノ]オキシメチル]-2-ピリジル]カルバメート(K.1.42)、2-[2-[(7,8-ジフルオロ-2-メチル-3-キノリル)オキシ]-6-フルオロ-フェニル]プロパン-2-オール(K.1.43)、2-[2-フルオロ-6-[(8-フルオロ-2-メチル-3-キノリル)オキシ]フェニル]プロパン-2-オール(K.1.44)、3-(5-フルオロ-3,3,4,4-テトラメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(K.1.45)、3-(4,4-ジフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(K.1.46)、3-(4,4,5-トリフルオロ-3,3-ジメチル-3,4-ジヒドロイソキノリン-1-イル)キノリン(K.1.47)、9-フルオロ-2,2-ジメチル-5-(3-キノリル)-3H-1,4-ベンゾオキサゼピン(K.1.48)。

【0235】

10

一般名により記載されている殺菌剤、それらの調製法、及び例えば、有害な菌類に対するそれらの活性は知られており(<http://www.alanwood.net/pesticides/>を参照)；これらの物質は市販されている。

【0236】

IUPAC命名法により記載されている殺菌剤、それらの調製法、及びそれらの殺有害生物活性もまた、公知である(Can. J. Plant Sci. 48(6)、587-94、1968；EP-A 141 317；EP-A 152 031；EP-A 226 917；EP-A 243 970；EP-A 256 503；EP-A 428 941；EP-A 532 022；EP-A 1 028 125；EP-A 1 035 122；EP-A 1 201 648；EP-A 1 122 244、JP 2 002316902；DE 19650197；DE 10021412；DE 102005009458；US 3,296,272；US 3,325,503；WO 98/46608；WO 99/14187；WO 99/24413；WO 99/27783；WO 00/29404；WO 00/46148；WO 00/65913；WO 01/54501；WO 01/56358；WO 02/22583；WO 02/40431；WO 03/10149；WO 03/11853；WO 03/14103；WO 03/16286；WO 03/53145；WO 03/61388；WO 03/66609；WO 03/74491；WO 04/49804；WO 04/83193；WO 05/120234；WO 05/123689；WO 05/123690；WO 05/63721；WO 05/87772；WO 05/87773；WO 06/15866；WO 06/87325；WO 06/87343；WO 07/82098；WO 07/90624、WO 11/028657、WO 2012/168188、WO 2007/006670、WO 2011/77514；WO 13/047749、WO 10/069882、WO 13/047441、WO 03/16303、WO 09/90181、WO 13/007767、WO 13/010862、WO 13/127704、WO 13/024009、WO 13/024010及びWO 13/047441、WO 13/162072、WO 13/092224、WO 11/135833を参照)。

20

【0237】

30

本発明の化合物についての適切な混合パートナーはまた、バイオ殺有害生物剤を含む。

【0238】

バイオ殺有害生物剤は、微生物(細菌、菌類、ウイルス、線虫、など)又は天然物(化合物、例えば、代謝物、タンパク質、又は生物源若しくは他の天然源由来の抽出物)に基づく殺有害生物剤の形態として定義されている(アメリカ合衆国環境保護庁(U.S. Environmental Protection Agency)：<http://www.epa.gov/pesticides/biopesticides/>)。バイオ殺有害生物剤は、二つの主なクラス、微生物及び生化学の殺有害生物剤に分類される：

【0239】

(1)微生物殺有害生物剤は、細菌、菌類又はウイルスからなる(細菌及び菌類が生産する代謝物を含むことが多い)。昆虫病原性線虫はまた、それらが多細胞性であるとしても、微生物殺有害生物剤として分類される。

40

【0240】

(2)生化学殺有害生物剤は、天然物であるか、又は天然物と構造的に同等であり、且つ機能的に同等であり、有害生物を防除するか、又は以下で定義する他の作物保護の使用を提供する生物源からの抽出物であるが、非毒性の作用機序を有し(例えば、成長又は発生調節剤、誘引剤(attractant)、忌避剤又は防御活性剤(例えば、誘導抵抗性)、哺乳動物に対して比較的非毒性である。

【0241】

作物病害に対する使用のためのバイオ殺有害生物剤は、様々な作物において、それ自身既に確立されている。例えば、バイオ殺有害生物剤は、べと病(downy mildew diseases)

50

を防除する重要な役割を既に担う。それらの利点は、0日の収穫前間隔、中等度から重度の病気の圧力下で使用する能力、及び混合物で又は他の登録殺有害生物剤とのローテーションプログラムで使用する能力を含む。

【0242】

バイオ殺有害生物剤の主な発達分野は、種子処理剤及び土壌改良剤の分野である。バイオ殺有害生物剤による種子処理剤は、例えば、種子腐敗(seed rots)、立ち枯れ病(damping-off)、根腐敗(root rot)及び苗木胴枯れ病(seedling blights)の原因となる土壌伝染菌類病原体を防除するために使用される。それらは、種子表面に存在する菌類病原体と同様に内部の種子伝染菌類病原体を防除するためにも使用することができる。多くのバイオ殺有害生物剤製品はまた、植物寄主防御、並びに様々な生物的及び非生物的ストレスに対し

10

【0243】

本発明の化合物と一緒に使用することができる、バイオ殺有害生物剤の以下の一覧は、可能な組合せを例示することを意図するものであるが、それらを制限するものではない：

【0244】

L) バイオ殺有害生物剤

L1) 殺菌、殺細菌、殺ウイルス及び/又は植物防御活性剤の活性を有する微生物殺有害生物剤： アンペロマイセス・キスカリス(*Ampelomyces quisqualis*)、アスペルギルス・フラバス(*Aspergillus flavus*)、アウレオバシジウム・プルランス(*Aureobasidium pullulans*)、バチルス・アルチツジニス(*Bacillus altitudinis*)、B. アミルオリクェファシエンス(*B. amyloliquefaciens*)、B. メガテリウム(*B. megaterium*)、B. モジャベンシス(*B. mojaveensis*)、B. ミコイデス(*B. mycoides*)、B. プミルス(*B. pumilus*)、B. シンプレクス(*B. simplex*)、B. ソリサルシ(*B. solisalsi*)、B. サブチリス(*B. subtilis*)、B. サブチリス変種アミロリクェファシエンス(*B. subtilis* var. *amyloliquefaciens*)、カンジダ・オレフィラ(*Candida oleophila*)、C. サイトアナ(*C. saitoana*)、クラビバクター・ミシガネンシス(*Clavibacter michiganensis*) (バクテリオファージ(bacteriophages))、コニオチリウム・ミニタンス(*Coniothyrium minitans*)、クリフォネクトリア・パラシチカ(*Cryphonectria parasitica*)、クリプトコッカス・アルビダス(*Cryptococcus albidus*)、ジロホスホラ・アロベクリ(*Dilophosphora alopecuri*)、フザリウム・オキシスポルム(*Fusarium oxysporum*)、クロノスタキス・ロセアF. カテヌラタ(*Clonostachys rosea* f. *catenulate*) (グリオクラディウム・カテニユレータム(*Gliocladium catenulatum*)ともいう)、グリオクラディウム・ロゼウム(*Gliocladium roseum*)、リソバクター・アンチビオチカス(*Lysobacter antibioticus*)、L. エンザイモゲネス(*L. enzymogenes*)、メチニコウイア・フルクチコラ(*Metschnikowia fructicola*)、ミクロドキウム・ジメルム(*Microdochium dimerum*)、ミクロスフェロプシス・オクラセア(*Microsphaeropsis ochracea*)、ムスコドル・アルブス(*Muscodor albus*)、パエニバチルス・アルベイ(*Paenibacillus alvei*)、パエニバチルス・ポリミキサ(*Paenibacillus polymyxa*)、パントエア・バガンズ(*Pantoea vagans*)、ペニシリウム・ビライア(*Penicillium bilaiae*)、フレビオブシス・ギガンテア(*Phlebiopsis gigantea*)、シュードモナス属の種(*Pseudomonas* sp.)、シュードモナス・クロロラフィス(*Pseudomonas chloraphis*)、シュードザイマ・フロキュローサ(*Pseudozyma flocculosa*)、ピキア・アノマーラ(*Pichia anomala*)、ピシウム・オリガンドラム(*Pythium oligandrum*)、スフェロデス・ミコパラシチカ(*Sphaerodes mycoparasitica*)、ストレプトマイセス・グリセオビリディス(*Streptomyces griseoviridis*)、S. リディカス(*S. lydicus*)、S. ビオラセウスニガー(*S. violaceusniger*)、タラロマイセス・フラバス(*Talaromyces flavus*)、トリコデルマ・アスペレロイデス(*Trichoderma asperelloides*)、T. アスペレルム(*T. asperellum*)、T. アトロビリデ(*T. atroviride*)、T. フェルティレ(*T. fertile*)、T. ガムシー(*T. gamsii*)、T. ハルマツム(*T. harmatum*)、T. ハルジアナム(*T. harzianum*)、T. ポリスポラム(*T. polysporum*)、T. ストロマチカム(*T. stromaticum*)、T. ビレンス(*T. virens*)、T. ビリ

20

30

40

50

デ(*T. viride*)、ティフラ・ファコリーザ(*Typhula phacorrhiza*)、ウロクラディウム・オウデマンシ(*Ulocladium oudemansii*)、バーティシリウム・ダーリエ(*Verticillium dahlia*)、ズッキーニ黄色モザイクウイルス(*zucchini yellow mosaic virus*)(非毒性株)；

【0245】

L2) 殺菌、殺細菌、殺ウイルス及び/又は植物防御活性剤の活性を有する生化学殺有害生物剤：ハーピンタンパク質(harpin protein)、レイノウトリア・サカリネンシス(*Reynoutria sachalinensis*)抽出物；

【0246】

L3) 殺虫、殺ダニ、殺軟体動物及び/又は殺線虫の活性を有する微生物殺有害生物剤：アグロバクテリウム・ラジオバクテル(*Agrobacterium radiobacter*)、バチルス・セレウス(*Bacillus cereus*)、*B. firmus*、*B. thuringiensis*、*B. thuringiensis* 亜種アイザワイ(*B. thuringiensis* ssp. *aizawai*)、*B. t.* 亜種イスラエレンシス(*B. t.* ssp. *israelensis*)、*B. t.* 亜種ガレリアエ(*B. t.* ssp. *galleriae*)、*B. t.* 亜種クルスタキー(*B. t.* ssp. *kurstaki*)、*B. t.* 亜種テネブリオニス(*B. t.* ssp. *tenebrionis*)、ボーベリア・バシアーナ(*Beauveria bassiana*)、*B. brongniartii*、ブルコルデリア属の種(*Burkholderia* spp.)、クロモバクテリウム・サブツガエ(*Chromobacterium subtsugae*)、シディア・ポモネラ顆粒ウイルス(*Cydia pomonella* granulovirus)(CpGV)、クリプトフレビア・ロイコトレタ顆粒ウイルス(*Cryptophlebia leucotreta* granulovirus)(CrleGV)、フラボバクテリウム属の種(*Flavobacterium* spp.)、ヘリコベルパ・アルミゲラ核多角体病ウイルス(*Helicoverpa armigera* nucleopolyhedrovirus)(HearNPV)、ヘリコベルパ・ゼア核多角体病ウイルス(*Helicoverpa zea* nucleopolyhedrovirus)(HzNPV)、ヘリコベルパ・ゼア単一核カプシド核多角体病ウイルス(*Helicoverpa zea* single capsid nucleopolyhedrovirus)(HzSNPV)、ヘテロラブジチス・バクテリオホラ(*Heterorhabditis bacteriophora*)、イサリア・フモソロセア(*Isaria fumosorosea*)、レカニシリウム・ロンギスポラム(*Lecanicillium longisporum*)、*L. muscarium*、メタリジウム・アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae*)、メタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエ(*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*)、*M. anisopliae* 変種アクリダム(*M. anisopliae* var. *acridum*)、ノムラエア・リレイ(*Nomuraea rileyi*)、ペキロマイセス・フモソロセウス(*Paecilomyces fumosoroseus*)、*P. lilacinus*、パエニバチルス・ポピリア(*Paenibacillus popilliae*)、パスツリア属の種(*Pasteuria* spp.)、*P. nishizawae*、*P. penetrans*、*P. ramosa*、*P. thornea*、*P. usgae*、シュードモナス・フルオレッセンス(*Pseudomonas fluorescens*)、スポドプテラ・リトラリス核多角体病ウイルス(*Spodoptera littoralis* nucleopolyhedrovirus)(SpliNPV)、ステイネルネマ・カルポカプサ(*Steinernema carpocapsae*)、*S. feltiae*、*S. kraussei*、ストレプトミセス・ガルブス(*Streptomyces galbus*)、*S. microflavus*；

【0247】

L4) 殺虫、殺ダニ、殺軟体動物、フェロモン及び/又は殺線虫の活性を有する生化学殺有害生物剤：L-カルボン(L-carvone)、シトラール(citral)、(E,Z)-7,9-ドデカジエン-1-イルアセテート、ギ酸エチル、(E,Z)-2,4-エチルデカジエノエート(ナシエステル(pear ester))、(Z,Z,E)-7,11,13-ヘキサデカトリエナール、ヘプチルブチレート、ミリスチン酸イソプロピル、ラバンズリルセネシオエート(lavanulyl senecioate)、cis-ジャスモン、2-メチル1-ブタノール、メチルオイゲノール(methyl eugenol)、ジャスモン酸メチル(methyl jasmonate)、(E,Z)-2,13-オクタデカジエン-1-オール、(E,Z)-2,13-オクタデカジエン-1-オールアセテート、(E,Z)-3,13-オクタデカジエン-1-オール、R-1-オクテン-3-オール、ペンタテルマノン(pentatermanone)、(E,Z,Z)-3,8,11-テトラデカトリエニルアセテート、(Z,E)-9,12-テトラデカジエン-1-イルアセテート、Z-7-テトラデセン-2-オン、Z-9-テトラデセン-1-イルアセテート、Z-11-テトラデセナール、Z-11-テトラデセン-1-オール、ケノポジウム・アンブロシオデス(*Chenopodium ambrosioides*)の抽出物、ニーム油(Neem

10

20

30

40

50

oil)、キレイ抽出物(Quillay extract)；

【0248】

L5)植物ストレス低減、植物成長調節、植物成長促進及び/又は収量増進の活性を有する微生物殺有害生物剤：アゾスピリラム・アマゾンネン(Azospirillum amazonense)、A.ブラシレンス(A. brasilense)、A.リポフェルム(A. lipoferum)、A.イラケンセ(A. irakense)、A.ハロプラエフェランス(A. halopraeferens)、ブラディリゾビウム属の種(Bradyrhizobium spp.)、B.エルカニ(B. elkanii)、B.ジャポニクム(B. japonicum)、B.リアオニンゲンス(B. liaoningense)、B.ルピニ(B. lupini)、デルフティア・アシドボランス(Delftia acidovorans)、グロムス・イントララディセス(Glomus intraradices)、メソリゾビウム亜種(Mesorhizobium spp.)、リゾビウム・レグミノサルム次亜種ファセオリ(Rhizobium leguminosarum bv. phaseolii)、R.l.bv.トリフォリ(R. l. bv. trifolii)、R.l.bv.ビシアエ(R. l. bv. viciae)、R.トロピシ(R. tropici)、シノリゾビウム・メリロチ(Sinorhizobium meliloti)。

【0249】

群L1)及び/又はL2)からのバイオ殺有害生物剤はまた、殺虫、殺ダニ、殺軟体動物、フェロモン、殺線虫、植物ストレス低減、植物成長調節、植物成長促進及び/又は収量増進の活性を有し得る。群L3)及び/又はL4)からのバイオ殺有害生物剤はまた、殺菌、殺細菌、殺ウイルス、植物防御活性剤、植物ストレス低減、植物成長調節、植物成長促進及び/又は収量増進の活性を有し得る。群L5)からのバイオ殺有害生物剤はまた、殺菌、殺細菌、殺ウイルス、植物防御活性剤、殺虫、殺ダニ、殺軟体動物、フェロモン、及び/又は殺線虫の活性を有し得る。

【0250】

これらのバイオ殺有害生物剤の多くは、本明細書において記載される受託番号の下、寄託され(接頭辞、例えば、ATCC又はDSMは、それぞれの保存機関の頭字語を示し、詳細は、例えば、http://www.wfcc.info/ccinfo/collection/by_acronym/を参照されたい)、文献に示され、登録され、及び/又は市販されている：1989年、Konstanz、Germanyで単離されたアウレオバシジウム・プルランス(Aureobasidium pullulans)DSM 14940及びDSM 14941の混合物(例えば、bio-ferm GmbH、Austria製のBlossomProtect(登録商標)の分芽孢子)、少なくとも1980年前にSouth Brazil(Passo Fundo)の小麦レアギン(reagon)で最初に単離されたアゾスピリルム・ブラシレンス(Azospirillum brasilense)Sp245(BR 11005；例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd.、Brazil製GELFIX(登録商標)グラミネアス(Gramineas))、A.ブラシレンス(A. brasilense)株Ab-V5及びAb-V6(例えば、Novozymes BioAg Produtos papra Agricultura Ltda.、Quattro Barras、Brazil製のAzoMax又はSimbiose-Agro、Brazil製のSimbiose-Maiz(登録商標)；Plant Soil 331、413-425、2010)、バチルス・アミロリケファシエンス(Bacillus amyloliquefaciens)株AP-188(NRRL B-50615及びB-50331；US 8,445,255)；Kikugawa-shi、Japan中の空気から単離されたB.アミロリケファシエンス亜種プランタルム(B. amyloliquefaciens spp. plantarum)D747(US 20130236522 A1；FERM BP-8234；例えば、Certis LLC、USA製のDouble Nickel(商標)55 WDG)、Brandenburg、Germanyの土壌から単離されたB.アミロリケファシエンス亜種プランタルムFZB24(SB3615；DSM 96-2ともいう；J. Plant Dis. Prot. 105、181-197、1998；例えば、Novozyme Biologicals、Inc.、USA製のTaegro(登録商標))、Brandenburg、Germanyの土壌から単離されたB.アミロリケファシエンス亜種プランタルム(B. amyloliquefaciens spp. plantarum)FZB42(DSM 23117；J. Plant Dis. Prot. 105、181-197、1998；例えば、AbiTEP GmbH、Germany製のRhizoVital(登録商標)42)、少なくとも1988年の前に、Sutton Bonington、Nottinghamshire、U.K.のソラマメ(faba bean)から単離されたB.アミロリケファシエンス亜種プランタルムMBI600(1430；NRRL B-50595ともいう；US 2012/0149571 A1；例えば、BASF Corp.、USA製のIntegral(登録商標))、1995年に、California、U.S.A.の桃園において単離されたB.アミロリケファシエンス属の種プランタルムQST-713(NRRL B-21661；例えば、Bayer Crop Science LP、USA製のSerenade(登録商標)MAX)、1992年に、South Dakota、U.S.A.で単離されたB.アミロリケファシ

エンス属の種 *Planctomycetaceae* TJ1000(1BE ; ATCC BAA-390ともいう ; CA 2471555 A1 ; 例えば、TJ Technologies、Watertown、SD、USA製のQuickRoots(商標))、*B. firmus*(CNCM I-1582、Israel中央の平野部の土壌から単離された親株EIP-N1(CNCM I-1556)の変種(WO 2009/126473、US 6,406,690 ; 例えば、Bayer CropScience LP、USA製のVotivo(登録商標))、Mexicoのリンゴの木の根圏から単離された*B. pumilus*(*B. pumilus*)GHA 180(IDAC 260707-01 ; 例えば、Premier Horticulture、Quebec、Canada製のPRO-MIX(登録商標)BX)、少なくとも1993年の前に、エルウィニア・トラケイフィラ(*Erwinia tracheiphila*)により寄生されたキュウリから単離された*B. pumilus*(*B. pumilus*)INR-7、その他では、BU-F22及びBU-F33ともいう(NRRL B-50185、NRRL B-50153 ; US 8,445,255)、少なくとも2008年の前に、South Africaの草の根圏から単離された*B. pumilus*(*B. pumilus*)KFP9F(NRRL B-50754 ; WO 2014/029697 ; 例えば、BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.、South Africa製のBAC-UP又はFUSION-P)、*B. pumilus*(*B. pumilus*)QST 2808は、1998年に、Pohnpei、Federated States of Micronesiaで収集された土壌から単離された(NRRL B-30087 ; 例えば、Bayer Crop Science LP、USA製のSonata(登録商標)又はBallad(登録商標)Plus)、*B. simplex*(*B. simplex*)ABU 288(NRRL B-50304 ; US 8,445,255)、North Americaのレッドビートの根から単離された*B. subtilis*(*B. subtilis*)FB17、UD 1022又はUD 10-22ともいう(ATCC PTA-11857 ; System. Appl. Microbiol. 27、372-379、2004 ; US 2010/0260735 ; WO 2011/109395) ; 1987年に、Ephraim、Wisconsin、U.S.A.のローンから採取された土壌から単離された*B.チューリングゲンシス*亜種アイザワイABTS-1857(ABG-6346 ; ATCC SD-1372ともいう ; 例えば、BioFa AG、Muensingen、Germany製のXenTari(登録商標))、1967年に、Brownsville、Texas、U.S.A.の病害のワタアカミムシ(Pink Bollworm)の黒色の幼虫から単離されたHD-1と同等の*B.t.*亜種クルスタキー(*B. t. ssp. kurstaki*)A BTS-351(ATCC SD-1275 ; 例えば、Valent BioSciences、IL、USA製のDipel(登録商標)DF)、*E. サッカリナ*(*E. saccharina*)の幼虫の死骸から単離された*B.t.*亜種クルスタキー(*B. t. ssp. kurstaki*)SB4(NRRL B-50753 ; 例えば、BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.、South Africa製のBeta Pro(登録商標))、*B.t.*亜種テネブリオニスNB-176-1、株NB-125の突然変異体、1982年に、甲虫テネブリオ・モリター(*Tenebrio molitor*)の死んでいるさなぎからの野生株(DSM 5480 ; EP 585 215 B1 ; 例えば、Valent BioSciences、Switzerland製のNovodor(登録商標))、ボーベリア・バシアーナ(*Beauveria bassiana*)GHA(ATCC 74250 ; 例えば、Laverlam Int. Corp.、USA製のBotaniGard(登録商標)22WGP)、*B. バシアーナ*(*B. bassiana*)JW-1(ATCC 74040 ; 例えば、CBC(Europe)S.r.l.、Italy製のNaturalis(登録商標))、トータスビートル(tortoise beetle)のコンキルククテニア・プンクタタ(*Conchyloctenia punctata*)の幼虫から単離された*B. バシアーナ*PPRI 5339(NRRL 50757 ; 例えば、BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.、South Africa製のBroadBand(登録商標))、Rio de Janeiro、Brazilで単離されたブラジリゾビウム・エルカニイ(*Bradyrhizobium elkanii*)株SEMIA 5019(29Wともいう)及び1967年に、State of Rio Grande do Sulで、North Americaの培養菌(isolate)を以前に接種した領域から単離され、1968年以来市販の接種剤に使用されたSEMIA 587(Appl. Environ. Microbiol. 73(8)、2635、2007 ; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd.、Brazil製のGELFIX 5)、U.S.A.のWisconsin fieldから単離された*B. ジャポニクム*532c(Nitragin 61A152 ; Can. J. Plant. Sci. 70、661-666、1990 ; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd.、Canada製のRhizoflo(登録商標)、Histick(登録商標)、Hicoat(登録商標)Super)、株USDA 138の*B. ジャポニクム*E-109変種(INTA E109、SEMIA 5085 ; Eur. J. Soil Biol. 45、28-35、2009 ; Biol. Fertil. Soils 47、81-89、2011) ; Appl. Environ. Microbiol. 73(8)、2635、2007から公知のSEMIAに受託された*B. ジャポニクム*株 : 1992年以来、Embrapa-Cerradosにより、市販の接種剤に使用された、Cerrados地方、Brazilの土壌から単離されたSEMIA 5079(CPAC 15 ; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd.、Brazil製のGELFIX 5又はADHERE 60)、BrazilのEmbrapa-Cerradosにより実験室条件の下得られ、1992年以来、市販の接種剤に使用され、U.S.A.で最初に単離されたSEMIA 586(CB1809)の自然変種である、*B. ジャポニクム*SEMIA 5080(CPAC 7 ; 例えば、BASF Agricultural Specialties Ltd.、Brazil製のGELFIX 5又はADHERE

60) ; 2008年に、Nikko、Japanの土壌から単離されたバークホルデリア属の種(*Burkholderia* sp.)A396(NRRL B-50319 ; WO 2013/032693 ; Marrone Bio Innovations、Inc.、USA)、ナタネから単離されたコニオチリウム・ミニタンス(*Coniothyrium minitans*)CON/M/91-08(WO 1996/021358 ; DSM 9660 ; 例えば、Bayer CropScience AG、Germany製のContans(登録商標)WG、Intercept(登録商標)WG)、ハービン(アルファ-ベータ)タンパク質(Science 257、85-88、1992 ; 例えば、Plant Health Care plc、U.K.製のMessenger(商標)又はHAR P-N-Tek)、ヘリコベルバ・アルミゲラ核多角体病ウイルス(HearNPV)(J. Invertebrate Pathol. 107、112-126、2011 ; 例えば、Adermatt Biocontrol、Switzerland製のHelicovex(登録商標) ; Koppert、Brazil製のDiplomata(登録商標) ; AgBiTech Pty Ltd.、Queensland、Australia製のVivus(登録商標)Max)、ヘリコベルバ・ゼア単カブシド核多角体病ウイルス(HzSNPV)(例えば、Certis LLC、USA製のGemstar(登録商標))、ヘリコベルバ・ゼア核多角体病ウイルスABA-NPV-U(例えば、AgBiTech Pty Ltd.、Queensland、Australia製のHeli gen(登録商標))、ヘテロラブジチス・バクテリオホラ(例えば、BASF Agricultural Specialities Limited、UK製のNemasys(登録商標)G)、Apopka、Florida、U.S.A.のサンシチソウ(*gynura*)上のコナカイガラムシ(mealy bug)から単離されたイサリア・フモソロセア(*Isaria fumosorosea*)Apopka-97(ATCC 20874 ; Biocontrol Science Technol. 22(7)、747-761、2012 ; 例えば、Certis LLC、USA製のPFR-97(商標)又はPreFeRal(登録商標))、Austriaのコドリリング(*codling moth*)から単離されたメタリジウム・アニソプリエ変種アニソプリエF52、275又はV275ともいう(DSM 3884、ATCC 90448 ; 例えば、Met52(登録商標)Novozymes Biologicals BioAg Group、Canada)、Israelの中央部のブドウから単離されたメチニコウィア・フルクチコラ(*Metschnikowia fructicola*)277(US 6,994,849 ; NRRL Y-30752 ; 例えば、Agrogreen、Israel製の以前のShemer(登録商標))、Philippinesの感染線虫の卵から単離されたパエシロミセス・イラシヌス(*Paecilomyces ilacinus*)251(AGAL 89/030550 ; WO 1991/02051 ; Crop Protection 27、352-361、2008 ; 例えば、Bayer CropScience AG、Germany製のBioAct(登録商標)及びCertis、USA製のMeloCon(登録商標))、少なくとも2008年の前に、South Africaの草の根圏から単離されたパエニバチルス・アルベイNA S6G6(WO 2014/029697 ; NRRL B-50755 ; 例えば、BASF Agricultural Specialities(Pty) Ltd.、South Africa製のBAC-UP)、2000年半ばに、Illinois、U.S.A.のダイズ畑から単離されたパストリア・ニシザワ(*Pasteuria nishizawae*)Pnl(ATCC SD-5833 ; Federal Register 76(22)、5808、February 2、2011 ; 例えば、Syngenta Crop Protection、LLC、USA製のClariva(商標)PN)、Alberta、Canadaの土壌から最初に単離されたペニシリウム・ビライア(*P. bilaii*ともいう)株ATCC 18309(=ATCC 74319)、ATCC 20851及び/又はATCC 22348(=ATCC 74318)(Fertilizer Res. 39、97-103、1994 ; Can. J. Plant Sci. 78(1)、91-102、1998 ; US 5,026,417、WO 1995/017806 ; 例えば、Novozymes Biologicals BioAg Group、Canada製のJump Start(登録商標)、Provide(登録商標))、レイノウトリア・サカリネンシス抽出物(EP 0307510 B1 ; 例えば、Marrone BioInnovations、Davis、CA、USA製のRegalia(登録商標)SC又はBioFa AG、Germany製のMilsana(登録商標))、ステイネルネマ・カルボカプサ(例えば、BASF Agricultural Specialities Limited、UK製のMillenium(登録商標))、S.フェルチア(例えば、BioWorks、Inc.、USA製のNemashield(登録商標) ; BASF Agricultural Specialities Limited、UK製のNemasys(登録商標))、ストレプトミセス・ミクロフラブス(*Streptomyces microflavus*)NRRL B-50550(WO 2014/124369 ; Bayer Crop Science、Germany)、South Africaで単離されたトリコデルマ・アスペレロイデスJM41R(NRRL 50759 ; T.フェルティレ(*T. fertile*)ともいう ; 例えば、BASF Agricultural Specialities(Pty)Ltd.、South Africa製のTrichoplus(登録商標))、T.ハルジアナム(*T. harzianum*)T-22、KRL-AG2ともいう(ATCC 20847 ; BioControl 57、687-696、2012 ; 例えば、BioWorks Inc.、USA製のPlantshield(登録商標)又はAdvanced Biological Marketing Inc.、Van Wert、OH、USA製のSabrEx(商標))。

【0251】

本発明によると、バイオ殺有害生物剤(油、例えば、ニーム油(*Neem oil*)などを例外として)の固体材料(乾燥物)は、活性成分と考えられる(例えば、微生物殺有害生物剤の液体

製剤の場合、抽出培地又は懸濁培地の乾燥又は蒸発の後に得られる)。

【0252】

本発明によれば、生物学的抽出物、例えば、キラヤ抽出物(Quillay extract)のために本明細書において使用される重量比及び百分率は、それぞれの抽出物(1種又は複数種)の乾燥した内容物(固体材料)の総重量に基づく。

【0253】

少なくとも1種の微生物殺有害生物剤を休止期形態を含む生存している微生物細胞の形態で含む組成物の総重量の割合は、各微生物のCFUの値を使用して決定して、以下の等式 $[1 \times 10^{10} \text{CFU}]$ は、各活性成分の総重量のうちの1グラムに等しい]により各活性成分の総重量を計算することができる。コロニー形成単位は、生存している微生物細胞、特に、菌類細胞及び細菌細胞の尺度である。さらに、ここで、CFUはまた、(昆虫病原性の)線虫バイオ殺有害生物剤、例えば、ステイネルネマ・フェルティアエ(*Steinernema feltiae*)の場合、(幼若の)個々の線虫の数と理解し得る。

【0254】

微生物殺有害生物剤を含む混合物を作物保護に使用する場合、施用量は、好ましくは、約 $1 \times 10^6 \sim 5 \times 10^{15}$ (又はそれ超)CFU/ha、好ましくは約 $1 \times 10^8 \sim 1 \times 10^{13}$ CFU/ha、さらに好ましくは約 $1 \times 10^9 \sim 1 \times 10^{12}$ CFU/haの範囲である。微生物殺有害生物剤としての(昆虫病原性)線虫(例えば、ステイネルネマ・フェルチアエ(*Steinernema feltiae*))の場合、施用量は好ましくは、約 $1 \times 10^5 \sim 1 \times 10^{12}$ (又はそれ超)、より好ましくは、 $1 \times 10^8 \sim 1 \times 10^{11}$ 、さらにより好ましくは、 $5 \times 10^8 \sim 1 \times 10^{10}$ (例えば、卵の形態、幼若又は任意の他の生体の段階、好ましくは、感染性の幼若段階の)個体/haの範囲である。

【0255】

微生物殺有害生物剤を含む混合物を種子処理に使用する場合、植物繁殖材料に関する施用量は、好ましくは、約 $1 \times 10^6 \sim 1 \times 10^{12}$ (又はそれ超)CFU/種子の範囲である。好ましくは、濃度は、約 $1 \times 10^6 \sim 1 \times 10^9$ CFU/種子である。微生物殺有害生物剤の場合、植物繁殖材料に関する施用量はまた好ましくは、100kgの種子当たり約 $1 \times 10^7 \sim 1 \times 10^{14}$ (又はそれ超)CFU、好ましくは、100kgの種子当たり $1 \times 10^9 \sim 1 \times 10^{12}$ CFUの範囲である。

【0256】

本発明は、助剤、及び少なくとも1種の本発明の化合物又はそれらの混合物を含む農薬組成物にも関する。

【0257】

農薬組成物は、殺有害生物有効量の本発明の化合物又はそれらの混合物を含む。用語「殺有害生物有効量」は、以下で定義される。

【0258】

本発明の化合物又はそれらの混合物は、例えば、液剤(solutions)、エマルジョン剤(emulsions)、懸濁剤(suspensions)、粉剤(dusts)、散剤(powders)、ペースト剤(pastes)、粒剤(gramules)、圧縮剤(pressings)、カプセル剤(capsules)及びそれらの混合物などの、従来の型の農薬組成物に転換可能である。組成物の型の例は、懸濁剤(例えば、SC、OD、FS)、乳化剤(emulsifiable concentrate)(例えば、EC)、エマルジョン剤(例えば、EW、EO、ES、ME)、カプセル剤(例えば、CS、ZC)、ペースト剤、パステル剤(pastilles)、水和剤(wettable powders)又は水和粉剤(wettable dusts)(例えば、WP、SP、WS、DP、DS)、圧縮剤(例えば、BR、TB、DT)、粒剤(例えば、WG、SG、GR、FG、GG、MG)、殺虫用品(insecticidal article)(例えば、LN)、及び植物繁殖材料、例えば、種子の処理のためのゲル製剤(gel formulations)(例えば、GF)である。これらの、及びさらなる組成物の型は、「Catalogue of pesticide formulation types and international coding system」、Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008、CropLife Internationalで定義される。

【0259】

組成物は、例えば、Mollet及びGrubemann、Formulation technology、Wiley VCH、Weinheim、2001、又はKnowles、New developments in crop protection product formulation、Agrow Reports DS243、T&F Informa、London、2005に記載される公知の方法で調製され

る。

【0260】

好適な助剤の例は溶媒、液体担体、固体担体又は充填剤、界面活性剤、分散剤、乳化剤、湿潤剤(wetter)、補助剤、可溶化剤、浸透促進剤、保護コロイド、結着剤(adhesion agent)、増粘剤、保湿剤、忌避剤、誘引剤、摂食促進剤、相溶化剤、殺細菌剤、凍結防止剤、消泡剤、着色剤、粘着剤及び結合剤である。

【0261】

好適な溶媒及び液体担体は、水及び有機溶媒、例えば、ケロシン、ディーゼル油などの中～高沸点の鉱物油画分、植物又は動物由来の油、トルエン、パラフィン、テトラヒドロナフタレン、アルキル化ナフタレンなどの脂肪族、環状及び芳香族炭化水素、エタノール、プロパノール、ブタノール、ベンジルアルコール、シクロヘキサノールなどのアルコール類、グリコール類、DMSO、シクロヘキサノンなどのケトン類、乳酸エステル、炭酸エステル、脂肪酸エステル、ガンマ-ブチロラクトンなどのエステル類、脂肪酸類、ホスホネート類、アミン類、N-メチルピロリドン、脂肪酸ジメチルアミドなどのアミド類、及びそれらの混合物である。

10

【0262】

好適な固体担体又は充填剤は、例えば、シリケート、シリカゲル、タルク、カオリン、石灰石、石灰、胡粉、粘土、ドロマイト、珪藻土、ベントナイト、硫酸カルシウム、硫酸マグネシウム、酸化マグネシウムなどの鉱物土、セルロース、デンプンなどのポリサッカライド粉体、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、尿素などの肥料、穀類粉、樹皮粉、木粉、堅果殻粉などの植物由来産物、及びそれらの混合物である。

20

【0263】

好適な界面活性剤は、アニオン性、カチオン性、非イオン性及び両性の界面活性剤、ブロックポリマー、高分子電解質、並びにそれらの混合物などの界面活性化合物である。このような界面活性剤は、乳化剤、分散剤、可溶化剤、湿潤剤、浸透促進剤、保護コロイド又は補助剤として使用可能である。界面活性剤の例は、McCutcheon's, Vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008(International Ed.又はNorth American Ed.)に列挙されている。

【0264】

好適なアニオン性界面活性剤は、スルホネート、スルフェート、ホスフェート、カルボキシレートのアルカリ、アルカリ土類又はアンモニウムの塩、及びそれらの混合物である。スルホネートの例は、アルキルアリールスルホネート、ジフェニルスルホネート、アルファ-オレフィンスルホネート、リグニンスルホネート、脂肪酸及び脂肪油のスルホネート、エトキシ化アルキルフェノールのスルホネート、アルコキシ化アリールフェノールのスルホネート、縮合ナフタレンのスルホネート、ドデシル-及びトリデシルベンゼンのスルホネート、ナフタレン及びアルキルナフタレンのスルホネート、スルホスクシネート又はスルホスクシナメート(sulfosuccinamate)である。スルフェートの例は、脂肪酸及び脂肪油のスルフェート、エトキシ化アルキルフェノールのスルフェート、アルコールのスルフェート、エトキシ化アルコールのスルフェート又は脂肪酸エステルのスルフェートである。ホスフェートの例は、リン酸エステルである。カルボキシレートの例は、カルボン酸アルキル、及びカルボキシ化アルコール又はアルキルフェノールエトキシレートである。

30

40

【0265】

好適な非イオン性界面活性剤は、アルコキシレート、N-置換脂肪酸アミド、アミノオキシド、エステル、糖ベースの界面活性剤、高分子界面活性剤、及びそれらの混合物である。アルコキシレートの例は、1～50個の均等物でアルコキシ化された、アルコール、アルキルフェノール、アミン、アミド、アリールフェノール、脂肪酸又は脂肪酸エステルなどの化合物である。エチレンオキシド及び/又はプロピレンオキシド、好ましくはエチレンオキシドが、アルコキシ化に使用されうる。N-置換脂肪酸アミドの例は、脂肪酸グルカミド又は脂肪酸アルカノールアミドである。エステルの例は脂肪酸エステル、グリセロールエステル又はモノグリセリドである。糖ベースの界面活性剤の例はソルビタン、エトキシ

50

化ソルビタン、スクロース及びグルコースエステル、又はアルキルポリグルコシドである。高分子界面活性剤の例は、ビニルピロリドン、ビニルアルコール又は酢酸ビニルのホモ又はコポリマーである。

【0266】

好適なカチオン性界面活性剤は、例えば、1つ若しくは2つの疎水基を有する第四級アンモニウム化合物などの第四級界面活性剤、又は長鎖第一級アミン塩である。好適な両性界面活性剤はアルキルベタイン及びイミダゾリンである。好適なブロックポリマーは、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドのブロックを含むA-B若しくはA-B-A型、又はアルカノール、ポリエチレンオキシド及びポリプロピレンオキシドを含むA-B-C型のブロックポリマーである。好適な高分子電解質はポリ酸又はポリ塩基である。ポリ酸の例は10
ポリアクリル酸又はポリ酸楕形ポリマーのアルカリ塩である。ポリ塩基の例はポリビニルアミン又はポリエチレンアミンである。

【0267】

好適な補助剤は、それ自体はごくわずかな殺有害生物活性を有するか、又は殺有害生物活性を全く有しておらず、標的に対する本発明の化合物の生物的な働きを改善する化合物である。例は界面活性剤、鉱物油又は植物油、及びその他の助剤である。さらなる例はKnowles、Adjuvants and additives、Agrow Reports DS256、T&F Informa UK、2006、chapter 5に列挙されている。

【0268】

好適な増粘剤は、ポリサッカライド(例えば、キサンタンガム、カルボキシメチルセルロース)、無機粘土(有機修飾された又は修飾されない)、ポリカルボキシレート、及びシリケートである。20

【0269】

好適な殺細菌剤は、プロノポール、並びにアルキルイソチアゾリノン及びベンズイソチアゾリノンなどのイソチアゾリノン誘導体である。

【0270】

好適な凍結防止剤は、エチレングリコール、プロピレングリコール、尿素及びグリセリンである。

【0271】

好適な消泡剤は、シリコーン、長鎖アルコール及び脂肪酸塩である。30

【0272】

好適な着色剤(例えば、赤、青又は緑)は、低水溶性の顔料及び水溶性の染料である。例は無機着色剤(例えば、酸化鉄、酸化チタン、ヘキサシアノ鉄酸鉄)並びに有機着色剤(例えば、アリザリン-、アゾ-、及びフタロシアニン着色剤)である。

【0273】

好適な粘着剤又は結合剤は、ポリビニルピロリドン、ポリ酢酸ビニル、ポリビニルアルコール、ポリアクリレート、生物又は合成のワックス、及びセルロースエーテルである。

【0274】

農薬組成物は、一般に、活性物質を0.01~95重量%、好ましくは0.1~90重量%、最も好ましくは0.5~75重量%で含む。活性物質は90%~100%、好ましくは95%~100%の純度(NMRスペクトルによる)で使用される。40

【0275】

多様な種類の油、湿潤剤、補助剤、肥料又は微量栄養素、及びさらに殺有害生物剤(例えば、除草剤、殺虫剤、殺菌剤、成長調節剤、毒性緩和剤)を、プレミックスとして又は適切であれば使用直前に(タンク混合)、活性物質、又はそれらを含む組成物に添加することができる。これらの薬剤は、本発明による組成物と1:100~100:1、好ましくは1:10~10:1の重量比で混合可能である。

【0276】

使用者は通常、プレ投与装置、背負い型噴霧器、噴霧タンク、噴霧飛行機又は灌漑システムから、本発明による組成物を施用する。通常、農薬組成物は水、緩衝液及び/又はさ50

らに助剤を用いて望ましい施用濃度に調製され、本発明による即時使用可能な噴霧液又は農薬組成物がこのようにして得られる。通常、農業用地1ヘクタールあたり20～2000リットル、好ましくは50～400リットルの即時使用可能な噴霧液が施用される。

【0277】

一実施形態により、本発明による組成物の個々の成分、例えば、キットの一部又は二成分若しくは三成分の混合物の一部を、使用者それ自身が噴霧タンク内で混合でき、適切な場合、さらなる助剤を添加できる。

【0278】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の各成分、又は一部が事前に混合された成分、例えば、本発明の化合物及び/又は前記で定義した混合パートナーを含む成分が、使用者によって噴霧タンク中で混合されてよく、適切であればさらなる助剤及び添加剤が添加されてもよい。

【0279】

さらなる実施形態では、本発明による組成物の各成分、又は一部が事前に混合された成分、例えば、本発明の化合物及び/又は前記で定義した混合パートナーを含む成分が、(例えば、タンク混合後に)一緒に、又は連続で施用されてよい。

【0280】

本発明の化合物は、作物、植物、植物繁殖材料、例えば、種子、又は植物が生育している土壌若しくは水を、動物有害生物による攻撃又は寄生から保護するための使用に適している。したがって、本発明はまた、動物有害生物による攻撃又は寄生から保護すべき、作物、植物、植物繁殖材料、例えば、種子、又は植物が生育している土壌若しくは水を、殺有害生物有効量の本発明の化合物と接触させるステップを含む、植物を保護する方法にも関する。

【0281】

本発明の化合物はまた、動物有害生物を駆除又は防除するための使用にも適している。したがって、本発明はまた、動物有害生物、それらの生息地、繁殖場所、又は食糧供給源、又は動物有害生物が生育している又は生育し得る、作物、植物、植物繁殖材料、例えば、種子、又は土壌、又は領域、材料又は環境を、殺有害生物有効量の本発明の化合物と接触させるステップを含む、動物有害生物を駆除又は防除する方法にも関する。

【0282】

本発明の化合物は、接触及び摂取の両方において有効である。さらに、本発明の化合物は、任意及び全ての発育段階、例えば、卵、幼虫、さなぎ、及び成虫に施用することができる。

【0283】

本発明の化合物は、それ自体で、又は前記で定義したそれらを含む組成物の形態で施用することができる。さらに、本発明の化合物は、前記で定義した混合パートナーと一緒に、又は前記で定義した前記混合物を含む組成物の形態で施用することができる。前記混合物の成分は、同時に、一緒に又は別々に、又は連続して(これは、即時に次々と施用することで、所望の場所、例えば、植物において「その場(in situ)」で混合物が生成される)、施用することができ、別々の施用の場合の順序は、一般に、防除手段の結果に対してなんら効果を与えない。

【0284】

施用は、作物、植物、植物繁殖材料、例えば、種子、土壌、又は領域、材料又は環境の有害生物による寄生の前及び後の両方において実施することができる。

【0285】

適切な施用方法は、特に、土壌処理、種子処理、畝間(in-furrow)施用、及び葉面(foliar)施用を含む。土壌処理方法は、土壌灌注、点滴灌漑(土壌上への点滴施用)、根、塊茎又は球根の浸漬、又は土壌注入を含む。種子処理技術は、種子粉衣法、種子コーティング法、種子散粉法、種子浸漬法、及び種子ペレット化法を含む。畝間施用では、通常、耕地中に畝をつくるステップ、畝に種子をまくステップ、畝に殺有害生物的に活性な化合物を

施用するステップ、及び畝を閉じるステップを含む。葉面施用は、例えば、噴霧装置による、植物の葉面への殺有害生物的に活性な化合物の施用に関する。葉面施用では、本発明の化合物と組み合わせて、フェロモンを使用することにより、有害生物の挙動を変更することが有利になり得る。特定の作物及び有害生物についての適切なフェロモンは、当業者により知られており、フェロモン及び情報化学物質のデータベースから公然に入手可能である(例えば、<http://www.pherobase.com>)。

【0286】

本明細書で使用される場合、用語「接触」は、直接接触(化合物/組成物を直接、動物有害生物又は植物、通常、植物の葉面、茎又は根に施用する)、及び間接接触(化合物/組成物を、動物有害生物又は植物の、居場所、すなわち、有害生物が生育している又は生育し得る、生息地、繁殖場所、植物、種子、土壌、領域、材料又は環境に施用する)。

10

【0287】

用語「動物有害生物」は、節足動物、腹足類、及び線虫を含む。本発明による好ましい動物有害生物は、節足動物であり、好ましくは、昆虫及びクモ形類(arachnids)であり、特に、昆虫である。昆虫、特に作物に関連のある昆虫は、通常、作物昆虫有害生物という。

【0288】

用語「作物」は、生育している作物及び収穫した作物の両方を示す。

【0289】

用語「植物」は、穀類、例えば、デュラム及び他の小麦、ライムギ、オオムギ、トリテ
ィケーレ、カラスムギ(oats)、イネ、又はトウモロコシ(飼料用トウモロコシ及びシュガ
ートウモロコシ/スウィートコーン及びフィールドコーン)；ビート、例えば、サトウダイ
コン又は飼料用ビート；果実、例えば、仁果類、核果類、又は柔果類、例えば、リンゴ
、セイヨウナシ、プラム、モモ、ネクタリン、アーモンド、サクランボ、パパイヤ、イチ
ゴ、ラズベリー、ブラックベリー、又はグーズベリー；マメ科植物、例えば、マメ、ヒラ
マメ、エンドウ、アルファルファ、又はダイズ；油糧植物、例えば、セイヨウアブラナ(r
apeseed)(ナタネ(oilseed rape))、アブラナ(turnip rape)、カラシナ、オリーブ、ヒマ
ワリ、ヤシ、カカオ豆、トウゴマ、アブラヤシ、ラッカセイ、又はダイズ；ウリ科植物、
例えば、トウナス、カボチャ、キュウリ、又はメロン；繊維植物、例えば、ワタ、アマ、
アサ、又はジュート；柑橘類、例えば、オレンジ、レモン、グレープフルーツ、又はマン
ダリン；野菜、例えば、ナス、ハウレンソウ、レタス(例えば、玉レタス)、チコリー、キ
ャベツ、アスパラガス、キャベツ、ニンジン、タマネギ、ニンニク、リーキ、トマト、ジ
ャガイモ、ウリ、又はアマトウガラシ；クスノキ科植物、例えば、アボカド、シナモン、
又はカンファー；エネルギー植物及び原料植物、例えば、トウモロコシ、ダイズ、セイヨ
ウアブラナ、サトウキビ、又はアブラヤシ；タバコ；ナッツ、例えば、クルミ；ピスタチ
オ；コーヒー；チャ；バナナ；蔓植物(生食用ブドウノキ及びグレープジュース用ブドウ
ノキ)；ホップ；スウィート・リーフ(ステビアともいう)；天然ゴム植物、又は観賞植物
及び森林植物、例えば、花(例えば、カーネーション、ペチュニア、ゼラニウム/テンジク
アオイ、パンジー及びツリフネソウ、)、低木、広葉樹(例えば、ポプラ)、又は常緑樹、
例えば、針葉樹；ユーカリ；芝；ローン；イネ科草本、例えば、動物の飼料又は観賞使用
のためのイネ科草本を含む。好ましい植物は、ジャガイモ、サトウダイコン、タバコ、小
麦、ライムギ、オオムギ、カラスムギ、イネ、トウモロコシ、綿、ダイズ、セイヨウアブ
ラナ、マメ科植物、ヒマワリ、コーヒー又はサトウキビ；果実；蔓植物；観賞植物；又は
野菜、例えば、キュウリ、トマト、マメ又はトウナスを含む。

20

30

40

【0290】

用語「植物」は、野生型植物、並びに従来の育種又は突然変異誘発若しくは遺伝子工学のいずれかにより、又はそれらの組み合わせにより改変されている植物を含むものとして理解される。

【0291】

突然変異誘発又は遺伝子工学により改変されており、特に商業上重要な植物は、アルフ

50

アルファ、セイヨウアブラナ(例えば、ナタネ)、マメ、カーネーション、チコリー、綿、ナス、ユーカリ、アマ、ヒラマメ、トウモロコシ、メロン、パパイヤ、ペチュニア、プラム、ポプラ、ジャガイモ、イネ、ダイズ、カボチャ、サトウダイコン、サトウキビ、ヒマワリ、アマトウガラシ、タバコ、トマト、及び穀類(例えば、小麦)、特に、トウモロコシ、ダイズ、綿、小麦、及びイネを含む。突然変異誘発又は遺伝子工学により改変されている植物では、1個又は複数の遺伝子が、植物の遺伝物質中に変異誘発、又は組み込まれている。1個又は複数の変異誘発又は組み込まれている遺伝子は、好ましくは、pat、epsps、cry1Ab、bar、cry1Fa2、cry1Ac、cry34Ab1、cry35AB1、cry3A、cryF、cry1F、mcry3a、cry2Ab2、cry3Bb1、cry1A.105、dfr、barnase、vip3Aa20、barstar、als、bxn、bp40、asn1、及びppo5から選択される。1個又は複数の遺伝子の変異誘発又は組み込みは、植物の特定の特性を改善するために実施される。形質としても知られるこのような特性は、非生物学的ストレス耐性、変更された生育/収量、病害抵抗性、除草剤耐性、昆虫抵抗性、改変された製品の質、及び授粉制御を含む。これらの特性のうち、除草剤耐性、例えば、イミダゾリノン耐性、グリホセート耐性、又はグルホシネート耐性は特に重要である。いくつかの植物は、変異誘発により除草剤に対して耐性を与えられており、例えば、Clearfield(登録商標)ナタネは、イミダゾリノン、例えば、イマザモックス(imazamox)に対して耐性である。あるいは、遺伝子工学方法は、植物、例えば、ダイズ、綿、トウモロコシ、ビート及びナタネに、除草剤、例えば、グリホセート及びグルホシネートに対する耐性を与えるために使用され、それらのいくつかは、RoundupReady(登録商標)(グリホセート)及びLibertyLink(登録商標)(グルホシネート)という商標名の下市販されている。さらに、昆虫抵抗性、特に、鱗翅類(lepidopteran)昆虫抵抗性及び鞘翅目(coleopteran)昆虫抵抗性は重要である。昆虫抵抗性は、通常、cry及び/又はvip遺伝子(これらは、バチルス・チューリンゲンシス(bacillus thuringiensis)(Bt)、及び各Bt毒素のコードから単離された)を組み込んで、植物を改変することにより達成される。遺伝学的に改変された昆虫抵抗性を有する植物は、WideStrike(登録商標)、Bollgard(登録商標)、Agrisure(登録商標)、Herculex(登録商標)、YieldGard(登録商標)、Genuity(登録商標)、及びIntacta(登録商標)を含む商標の下、市販されている。植物は、1つの特性に関して(単数の形質)、又は複数の特性の組み合わせに関して(複数の形質)、変異誘発又は遺伝子工学により改変され得る。複数の形質、例えば、除草剤耐性及び昆虫抵抗性の組み合わせは、重要性が増している。一般に、単数の形質又は複数の形質に関連する全ての関連改変植物、並びに変異誘発又は組み込まれた遺伝子及び各事象に関する詳細な情報は、「International Service for the Acquisition of Agri-biotech Applications(ISAAA)」(<http://www.isaaa.org/gmappr>ovaldatabase)及び「Center for Environmental Risk Assessment(CERA)」(<http://cera-gmc.org/GMCropDatabase>)の団体のウェブサイトから入手することができる。

【0292】

驚くべきことに、本発明の化合物の殺有害生物活性は、改変された植物の殺虫性の形質により増大されることが見出された。さらに、本発明の化合物は、昆虫が殺虫性の形質に対して抵抗性になることを防ぐ、又は改変された植物の殺虫性の形質に対して既に抵抗性になっている有害生物を駆除するのに適切であることが見出された。さらに、本発明の化合物は、殺虫性の形質が有効ではない有害生物を駆除するのに適切であり、そのため、補足的な殺虫活性を有利に使用することができる。

【0293】

用語「植物繁殖材料」は、植物の繁殖に使用し得る、全ての植物の繁殖部分、例えば、種子及び発育植物材料(vegetative plant material)、例えば、切り枝及び塊茎(例えば、ジャガイモ)を示す。これは、種子、根、果実、塊茎、球根、根茎、苗条(shoots)、芽及び他の植物の部分を含む。発芽後又は土壌からの出現後に移植される苗及び若い植物もまた含み得る。これらの植物繁殖材料は、植栽又は移植の時、又はその前に、植物保護化合物により予防的に処理され得る。

【0294】

用語「種子」は、あらゆる種類の種子及び植物栄養繁殖体(例えば、限定するものでは

ないが、真正種子、種子の小片、吸枝、球茎、球根、果実、塊茎、穀粒、挿し木、切断された苗条など)を包含し、好ましい実施形態においては、真正種子を意味する。

【0295】

一般に、「殺有害生物有効量」は、生育に観察可能な効果(例えば、標的生物の、壊死、死滅、遅延、予防、及び除去、破壊、あるいは出現及び活性を低減させる効果など)を達成するために必要とされる活性成分の量を意味する。殺有害生物有効量は、本発明において使用される様々な化合物/組成物によって異なり得る。本組成物の殺有害生物有効量はまた、一般的条件(例えば、所望の殺有害生物効果及び持続時間、天候、標的種、居場所、施用様式など)によっても変化するであろう。

【0296】

畝間施用における土壌処理、又は有害生物の居所又は巣への施用の場合、活性成分の量は、100m²当たり、0.0001~500g、好ましくは100m²当たり0.001~20gの範囲にわたる。

【0297】

作物植物を、例えば、葉面施用により処理するために使用する場合、本発明の活性成分の施用量は1ヘクタール当たり0.0001g~4000g、例えば、1ヘクタール当たり1g~2kg、又は1ヘクタール当たり1g~750g、望ましくは1ヘクタール当たり1g~100g、より望ましくは1ヘクタール当たり10g~50g、例えば、1ヘクタール当たり10~20g、1ヘクタール当たり20~30g、1ヘクタール当たり30~40g、又は1ヘクタール当たり40~50gの範囲になり得る。

【0298】

本発明の化合物は、種子を、昆虫有害生物から、特に、土壌に生息する昆虫有害生物から保護し、生じる苗木の根及び苗条を、土壌有害生物及び葉面昆虫から、保護するための種子処理における使用に、特に適切である。したがって、本発明は、種子を、昆虫から、特に、土壌昆虫から、並びに苗木の根及び苗条を、昆虫から、特に、土壌及び葉面の昆虫から保護するための方法であって、播種前及び/又は発芽前処理後の種子を本発明の化合物で処理するステップを含む、前記方法にも関する。苗木の根及び苗条の保護が好ましい。より好ましくは、刺吸性昆虫(piercing and sucking insects)、咀嚼昆虫(chewing insects)及び線虫からの苗木の苗条の保護である。

【0299】

用語「種子処理」は、当該技術分野において知られるあらゆる適切な種子処理技術、例えば、種子粉衣法、種子コーティング法、種子散粉法、種子浸漬法、種子ペレット化法、及び畝間施用法を含む。好ましくは、活性化合物の種子処理施用は、植物の播種前及び植物の出芽前に、種子に、噴霧又は散粉することにより実施される。

【0300】

本発明はまた、活性化合物でコーティングされた又はそれを含有する種子を含む。用語「~でコーティングされた、及び/又は~を含有する」は、一般に、施用時に活性成分の大部分が、繁殖製品の表面上にあることを意味するが、施用方法に応じて、成分の一部が多かれ少なかれ繁殖製品に浸透していてもよい。前記繁殖製品が(再び)植えられた場合、当該繁殖製品は活性成分を吸収し得る。

【0301】

好適な種子は、穀類、根菜作物、油料作物、野菜、香辛料、観葉植物の種子、例えば、デュラム及び他の小麦、オオムギ、カラスムギ、ライムギ、トウモロコシ(飼料用トウモロコシ及びシュガートウモロコシ/スイートコーン及びフィールドコーン)、ダイズ、油料作物、アブラナ科植物、ワタ、ヒマワリ、バナナ、イネ、ナタネ、アブラナ、テンサイ、飼料用ビート、ナス、ジャガイモ、イネ科草本、ローン、芝、飼料用イネ科草本、トマト、リーキ、カボチャ/トウナス、キャベツ、アイスバーグレタス、コショウ、キュウリ、メロン、アブラナ属種(*Brassica species*)、メロン、マメ、エンドウマメ、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/テンジクアオイ、パンジー及びツリフネソウ属の種子である。

【0302】

加えて、活性化合物はまた、突然変異誘発又は遺伝子工学により改変されており、例え

10

20

30

40

50

ば、除草剤又は殺菌剤又は殺虫剤の作用に耐性がある植物からの種子の処理のために使用され得る。このような改変された植物については、上に詳細が記載されている。

【0303】

従来の種子処理製剤は、例えば、流動性剤(flowable concentrates)FS、液剤(solution s)LS、サスポエマルジョン剤(Suspoemulsions)(SE)、乾燥処理用散剤(powders for dry treatment)DS、スラリー処理用水分散性散剤(water dispersible powders for slurry treatment)WS、水溶性散剤(water-soluble powders)SS及びエマルジョン剤(emulsions)ES及びEC及びゲル製剤(gel formulation)GFを含む。これらの製剤は、種子に、希釈して又は希釈しないで施用され得る。種子への施用は、播種前に種子に直接、又は種子を前発芽させた後に行う。好ましくは、製剤は、発芽を含まないように施用される。

10

【0304】

2~10倍希釈後に得られ得る、即時使用可能製剤の活性物質濃度は、好ましくは0.01~60重量%、より好ましくは0.1~40重量%である。

【0305】

好ましい実施形態では、FS製剤は、種子処理に使用される。通常、FS製剤は、1~800g/lの活性成分、1~200g/lの界面活性剤、0~200g/lの凍結防止剤、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。

【0306】

種子処理のためのとりわけ好ましい本発明の化合物のFS製剤は、通常、0.1~80重量%(1~800g/l)の活性成分、0.1~20重量%(1~200g/l)の少なくとも1種の界面活性剤、例えば、0.05~5重量%の湿潤剤及び0.5~15重量%の分散剤、最大20重量%、例えば、5~20%の凍結防止剤、0~15重量%、例えば、1~15重量%の顔料及び/又は染料、0~40重量%、例えば、1~40重量%の結合剤(展着剤/粘着剤)、場合により最大5重量%、例えば、0.1~5重量%の増粘剤、場合により0.1~2%の消泡剤、及び場合により防腐剤、例えば、殺生物剤、酸化防止剤などを、例えば、0.01~1重量%の量で、及び充填剤/ビヒクルを100重量%まで含む。

20

【0307】

種子の処理では、本発明の化合物の施用量は、一般に、100kgの種子当たり0.1g~10kg、好ましくは100kgの種子当たり1g~5kg、より好ましくは100kgの種子当たり1g~1000g、特に、100kgの種子当たり1g~200g、例えば、100kgの種子当たり1g~100g又は5g~100gである。

30

【0308】

したがって、本発明はまた、本明細書で定義した本発明の化合物又はそれらの農業的に有用な塩を含む種子にも関する。本発明の化合物又はそれらの農業的に有用な塩の量は、一般に、100kgの種子当たり0.1g~10kg、好ましくは100kgの種子当たり1g~5kg、特に、100kgの種子当たり1g~1000gで異なり得る。特定の作物、例えば、レタスでは、その量はより多くなり得る。

【0309】

本発明の化合物はまた、植物の健康を改善するために使用され得る。したがって、本発明はまた、植物、植物繁殖材料、及び/又は植物が生育している又は生育するであろう居場所を、有効及び植物毒性のない量の本発明の化合物で処理することによって植物の健康を改善する方法に関する。

40

【0310】

本明細書において使用される場合、「有効及び植物毒性のない量」は、処理植物又は処理栄養繁殖体若しくは処理土壌から生育した植物において、所望の効果が得られるが、植物毒性の兆候が全く生じないことを可能にする量で、化合物が使用されることを意味する。

【0311】

用語「植物」及び「植物繁殖材料」は、上記に定義されている。

【0312】

50

「植物の健康」は、収穫(例えば、増大したバイオマス及び/又は増大した有用な成分の含有量)、質(例えば、改良した特定成分の含有量又は組成、又は貯蔵寿命)、植物の勢い(例えば、改良した植物の生育及び/又はより緑色の葉(「緑化効果」))、非生物学的ストレス(例えば、干ばつ)及び/又は生物学的ストレス(例えば、病害)に対する耐性、及び生産効率(例えば、収穫率、加工性)などのいくつかの態様を単独又はそれぞれを組み合わせることによって決定される、植物及び/又はその生産物の状態として定義される。

【0313】

前記の植物の健康状態についての特定した指標は、相互依存であり、それらは互いから生じ得る。それぞれの指標は、当該技術分野において定義され、当業者に知られる方法により決定され得る。

10

【0314】

本発明の化合物はまた、非作物昆虫有害生物に対する使用に適切である。前記非作物有害生物に対する使用では、本発明の化合物は、餌組成物、ゲル、一般的な昆虫スプレー、エアロゾルとして、超微量施用及び蚊帳(含浸又は表面塗布)として、使用され得る。さらに、灌注法及びロッキング法を使用することができる。

【0315】

本明細書において使用される場合、用語「非作物昆虫有害生物」は、特に、非作物の標的に関連する有害生物、例えば、アリ(ants)、シロアリ(termites)、スズメバチ(wasps)、ハエ(flies)、マダニ(ticks)、カ(mosquitos)、コオロギ(crickets)、又はゴキブリ(cockroaches)を示す。

20

【0316】

餌は、液体、固体、又は半固体の調製物(例えば、ゲル)であり得る。組成物中で用いられる餌は、昆虫(例えば、アリ、シロアリ、スズメバチ、ハエ、カ、コオロギなど、又はゴキブリ)がそれを食べるように刺激するのに十分に誘引性のある製品である。誘引性は、摂食刺激剤又は性フェロモンを使用することによって操作することができる。食物刺激剤は、例えば、動物及び/又は植物のタンパク質(肉粉、魚粉又は血粉、昆虫部分、卵黄)から、動物及び/又は植物の由来の脂肪及び油から、又は単糖類、オリゴ糖類若しくはポリ有機糖類から、とりわけスクロース、ラクトース、フルクトース、デキストロース、グルコース、デンプン、ペクチン、又は糖蜜若しくは蜂蜜からも選択されるが、これらだけに限らない。果実、作物、植物、動物、昆虫又はそれらの特定の部分の新鮮な部分若しくは腐りかけの部分もまた、摂食刺激剤として役立ち得る。性フェロモンは、より昆虫特異的であることが知られている。特異的フェロモンは文献(例えば、<http://www.pherobase.com>)に記載されており、当業者に公知である。

30

【0317】

餌組成物における使用について、活性成分の典型的な含量は、0.001重量%~15重量%、望ましくは0.001重量%~5%重量%の活性化合物である。

【0318】

エアゾール剤(例えば、スプレー缶中の)、オイルスプレー剤又はポンプスプレー剤としての本発明の化合物の製剤は、専門家ではない使用者が、有害生物(例えば、ハエ、ノミ、ダニ、カ又はゴキブリ)を防除するために極めて適している。エアゾール処方剤は、活性化合物、溶媒、さらなる助剤、例えば、乳化剤、香油、適切であれば安定剤、必要であれば、噴霧剤で構成されることが好ましい。

40

【0319】

オイルスプレー製剤は、噴霧剤が使用されないという点においてエアゾール処方剤とは異なる。

【0320】

スプレー組成物における使用では、活性成分の含量は、0.001~80重量%、好ましくは0.01~50重量%、最も好ましくは0.01~15重量%である。

【0321】

本発明の化合物及びその各組成物はまた、蚊取線香及び燻蒸線香、煙カートリッジ、気

50

化器プレート又は長時間気化器において、さらに、蛾取り紙、蛾取りパッド又は他の熱非依存性気化器系で使用することもできる。

【0322】

本発明の化合物及びその各組成物により、昆虫により伝達される感染性疾患(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症、及びリーシュマニア症)を抑制する方法はまた、小屋及び家屋の表面を処理すること、カーテン、テント、衣料品、蚊帳、ツェツェバエトラップなどの空気噴霧及び含浸も含む。繊維、織物、ニット製品、不織布、網材料又はフォイル及び防水布への施用のための殺虫組成物は、好ましくは、殺虫剤、場合により忌避剤及び少なくとも1種の結合剤を含有する混合物を含む。

【0323】

本発明の化合物及びその組成物は、木製材料(例えば、木、板塀、枕木、骨組み、芸術的な人工物等)及び建築物のみならず、建設資材、家具、皮革、繊維、ビニル製品、電線及びケーブルなどをアリ及び/又はシロアリから保護するため、さらにアリ及びシロアリが作物又はヒトに損害を与えること(例えば、有害生物が家屋及び公共施設に侵入した場合)を抑制するために使用することができる。

【0324】

資材の保護における慣用の施用量は、例えば、処理対象の資材1m²当たり活性化合物0.01g~2000g、又は0.01g~1000gであり、望ましくは1m²当たり0.1g~50gである。

【0325】

資材の含浸において使用するための殺虫組成物は、典型的には、0.001~95重量%、好ましくは0.1~45重量%、より好ましくは1~25重量%の少なくとも1種の忌避剤及び/又は殺虫剤を含有する

【0326】

本発明の化合物は、動物有害生物、例えば、節足動物、腹足類、及び線虫(例えば、限定されないが、以下に示すもの)を効率的に駆除するために、とりわけ適切である：

【0327】

鱗翅目(Lepidoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アクロイア・グリセラ(*Achroia grisella*)、アクレリス属の種(*Accleris* spp.)、例えば、*A. フィンブリアーナ*(*A. fimbriana*)、*A. グロベラナ*(*A. gloverana*)、*A. バリアナ*(*A. variana*)； アクロレピオプシス・アッセクテラ(*Acrolepiopsis assectella*)、アクロニクタ・メジャー(*Acronicta major*)、アドキソファイエス属の種(*Adoxophyes* spp.)、例えば、*A. シルトセマ*(*A. cyrtosema*)、*A. オラーナ*(*A. orana*)； アエディア・リユーコメラス(*Aedia leucomelas*)、アグロチス属の種(*Agrotis* spp.)、例えば、*A. エキスクラマチオニス*(*A. exclamationis*)、*A. フコサ*(*A. fucosa*)、*A. イプシロン*(*A. ipsilon*)、*A. オルトゴマ*(*A. orthogoma*)、*A. セゲツム*(*A. segetum*)、*A. スブテラネア*(*A. subterranea*)； アラバマ・アルギラセア(*Alabama argillacea*)、アレウロジクス・ジスペルスス(*Aleurodicus dispersus*)、アルソフィラ・ポメタリア(*Alsophila pometaria*)、アンペロファーガ・ルビギノサ(*Ampelophaga rubiginosa*)、アミエロイス・トランシテラ(*Amyelois transitella*)、アナカンブシス・サルシテラ(*Anacamptis sarcitella*)、アナガスタ・クエーニエラ(*Anagasta kuehniella*)、アナルシア・リネアテラ(*Anarsia lineatella*)、アニソータ・セナトリア(*Anisota senatoria*)、アンテラエア・ペルニイ(*Antheraea pernyi*)、アンチカルシア(=テルメシア)属の種(*Anticarsia* (=Thermesia) spp.)、例えば、*A. ゲンマタリス*(*A. gemmatalis*)； アパメア属の種(*Apamea* spp.)、アプロアエレマ・モジセラ(*Aproaerema modicella*)、アルキプス属の種(*Archips* spp.)、例えば、*A. アルギロスピラ*(*A. argyrospila*)、*A. フスコクプレアヌス*(*A. fuscocupreanus*)、*A. ロサナ*(*A. rosana*)、*A. キシロセアヌス*(*A. xyloseanus*)； リンゴヒメシンクイ(*Argyresthia conjugella*)、アルギロプロス属の種(*Argyroproctis* spp.)、アルギロタエニア属の種(*Argyrotaenia* spp.)、例えば、*A. ベルチナナ*(*A. velutinana*)； アテチス・ミンダラ(*Athetis mindara*)、アウストロアスカ・ヴィリジグリセア(*Austroasca viridigrisea*)、ガンマキンウワバ(*Autographa gamma*)、アウトグラファ・ニグリシグナ(*Autographa nigrisigna*)、バラスラ・ブラッシカエ(*Barathra brassicae*)、ベデリア属

10

20

30

40

50

の種(*Bedellia* spp.)、ボナゴタ・サルブリコラ(*Bonagota salubricola*)、ボルボ・キン
 ナラ(*Borbo cinnara*)、ブキュラトリクス・スルベリエラ(*Bucculatrix thurberiella*)、
 ブパルス・ピニアリウス(*Bupalus piniarius*)、ブッセオラ属の種(*Busseola* spp.)、カコ
 エシア属の種(*Cacoecia* spp.)、例えば、*C. ムリナナ*(*C. murinana*)、*C. ポダナ*(*C. podana*)
)；カクトブラスチス・カクトルム(*Cactoblastis cactorum*)、カドラ・カウテラ(*Cadra*
cautella)、カリngo・ブラジリエンシス(*Calingo braziliensis*)、カロプチリス・テイ
 ボラ(*Caloptilis theivora*)、カプア・レティクラーナ(*Capua reticulana*)、カルボシナ
 属の種(*Carposina* spp.)、例えば、*C. ニポネンシス*(*C. niponensis*)、*C. ササキイ*(*C. sas*
akii)；セフス属の種(*Cephus* spp.)、カエトクネマ・アリヅラ(*Chaetocnema aridula*)、
 ケイマトビア・ブルマータ(*Cheimatobia brumata*)、キロ属の種(*Chilo* spp.)、例えば、*C.* 10
インジクス(*C. Indicus*)、*C. スップレッサリス*(*C. suppressalis*)、*C. パルテルス*(*C. pa*
rtellus)；コロイチス・パリアナ(*Choreutis pariana*)、コリストネウラ属の種(*Chorist*
oneura spp.)、例えば、*C. コンフリクタナ*(*C. conflictana*)、*C. フミフェラナ*(*C. fumife*
rana)、*C. ロンギセラナ*(*C. longicellana*)、*C. ムリナナ*(*C. murinana*)、*C. オッシデンタ*
リス(*C. occidentalis*)、*C. ロサセアナ*(*C. rosaceana*)；クリソデイキシス(=プソイド
 プルシア)属の種(*Chrysodeixis* (=Pseudoplusia) spp.)、例えば、*C. エリオソマ*(*C. erioso*
ma)、*C. インクルデンス*(*C. includens*)；シルフィス・ウニプンクタ(*Cirphis unipuncta*)
)、クリシア・アンビグエラ(*Clysia ambiguella*)、クナファロセルス属の種(*Cnaphalocer*
us spp.)、クナファロクロシス・メジナリス(*Cnaphalocrocis medinalis*)、クネファシア
 属の種(*Cnephasia* spp.)、コキルイス・ホスペス(*Cochylis hospes*)、コレオホラ属の種(*Coleophora* spp.)、
 オオアメリカモンキチョウ(*Colias eurytheme*)、コノッポモルファ属
 の種(*Conopomorpha* spp.)、コノツラチェラス属の種(*Conotrachelus* spp.)、コピタルシ
 ア属の種(*Copitarsia* spp.)、コルシラ・セファロニカ(*Corcyra cephalonica*)、クランプ
 ス・カリギノセルス(*Crambus caliginosellus*)、クランプス・トテルレルス(*Crambus tet*
errellus)、クロシドセマ(=エピノチア)・アポレマ(*Crociosema* (=Epinotia) aporema)
 、シダリマ(=ジアファニア)・ペルスベクタリス(*Cydalima* (=Diaphania) perspectalis)
 、シジア(=カルポカプサ)属の種(*Cydia* (=Carpocapsa) spp.)、例えば、*C. ポモネラ*(*C. p*
omonella)、*C. ラチフェレアナ*(*C. latiferreana*)；ダラカ・ノクツイデス(*Dalaca noctu*
ides)、ダタナ・インテゲリマ(*Datana integerrima*)、ダシキラ・ピニコラ(*Dasychira pi*
nicola)、デンドロリムス属の種(*Dendrolimus* spp.)、例えば、*D. ピニ*(*D. pini*)、*D. スペ* 30
クタビリス(*D. spectabilis*)、*D. シビリクス*(*D. sibiricus*)；デスマ・フネラリス(*De*
smia funeralis)、ダイアファニア属の種(*Diaphania* spp.)、例えば、*D. ニチダリス*(*D. n*
itidalis)、*D. ヒアリナタ*(*D. hyalinata*)；ジアトラエア・グランジオセラ(*Diatraea gr*
andiosella)、ダイアトラエア・サッカラリス(*Diatraea saccharalis*)、ジフテラ・フェ
 スチバ(*Diphthera festiva*)、エアリアス属の種(*Earias* spp.)、例えば、*E. インストラナ*(*E.*
insulana)、*E. ビッテラ*(*E. vittella*)；エクジトロファ・アウランチアヌ(*Ecdytoloph*
a aurantianu)、エギラ(=キシロミゲス)・クリアリス(*Egira* (=Xylomyges) curialis)、
 エラウモバルパス・リクノセーラス(*Elasmopalpus lignosellus*)、エルダナ・サッカリナ
 (*Eldana saccharina*)、エンドピザ・ビテアナ(*Endopiza viteana*)、エンノモス・スブシ
 グナリア(*Ennomos subsignaria*)、エオロイマ・ロフチニ(*Eoreuma loftini*)、エフェスチ
 ア属の種(*Ephestia* spp.)、例えば、*E. カウテラ*(*E. cautella*)、*E. エルテラ*(*E. elutella*)
)、*E. クエーニエラ*(*E. kuehniella*)；エピノチア・アポレマ(*Epinotia aporema*)、エピ
 フィアス・ポストビッタナ(*Epiphyas postvittana*)、エランニス・チリアリア(*Erannis t*
iliaria)、エリオノタ・トラキス(*Erionota thrax*)、エチエラ属の種(*Etiella* spp.)、ユ
 ーリア属の種(*Eulia* spp.)、ユーポエシリア・アムギュッラ(*Eupoecilia ambiguella*)、
 ユープロクティス・クリソロエア(*Euproctis chrysorrhoea*)、ユークソア属の種(*Euxoa s*
pp.)、エベトリア・ボウリアナ(*Evetria bouliana*)、ファロンタ・アルビリネア(*Faronta*
albilinea)、フェルティア属の種(*Feltia* spp.)、例えば、*F. スブテラネアン*(*F. subter*
ranean)；ガレリア・メロネラ(*Galleria mellonella*)、グラシラリア属の種(*Gracillari*
a spp.)、グラホリタ属の種(*Grapholita* spp.)、例えば、*G. フネブラナ*(*G. funebrana*)、 50

G.モレスタ(*G. molesta*)、G.イノピナタ(*G. inopinata*)；ハリシドタ属の種(*Halysidota* spp.)、ハリシナ・アメリカナ(*Harrisina americana*)、ヘジレプタ属の種(*Hedylepta* sp. p.)、ヘリコベルパ属の種(*Helicoverpa* spp.)、例えば、H.アルミゲラ(*H. armigera*) (=ヘリオティス・アルミゲラ(*Heliothis armigera*))、H.ゼア(*H. zea*) (=ヘリオティス・ゼア(*Heliothis zea*))；ヘリオティス属の種(*Heliothis* spp.)、例えば、H.アッスルタ(*H. assulta*)、H.スブフレキサ(*H. subflexa*)、H.ビレセンス(*H. virescens*)；ヘルラ属の種(*Hellula* spp.)、例えば、H.ウンダリス(*H. undalis*)、H.ロガタリス(*H. rogatalis*)；ヘロコベルパ・ゲロトポエオン(*Helocoverpa gelotopoeon*)、ヘミロイカ・オリビア(*Hemileuca oliviae*)、ヘルペトグランマ・リカルシサリス(*Herpetogramma licarsisalis*)、ヒベルニア・デホリアリア(*Hibernia defoliaria*)、ホフマノフィラ・シュードスプレテラ(*Hofmannophila pseudospretella*)、ホモエオソマ・エレクトェルム(*Homoeosoma electellum*)、チャハマキ(*Homona magnanima*)、ヒベナ・スカブラ(*Hypena scabra*)、アメリカシロヒトリ(*Hyphantria cunea*)、ヒポノメウタ・パデラ(*Hyponomeuta padella*)、ヒポノメウタ・マリネルス(*Hyponomeuta malinellus*)、カキヴォリア・フラヴォファスシアタ(*Kakivoria flavofasciata*)、ケイフェリア・リコベルシケラ(*Keiferia lycopersicella*)、ランブジナ・フィセラリア・フィセラリア(*Lambdina fiscellaria fiscellaria*)、ランブジナ・フィセラリア・ルグブロサ(*Lambdina fiscellaria lugubrosa*)、ランブロセマ・インジカタ(*Lamprosema indicata*)、ラスペイレシア・モレスタ(*Laspeyresia molesta*)、レグミニボラ・グリシニボレラ(*Leguminivora glycinivorella*)、レロデア・オイファラ(*Lerodea eufala*)、ロイシノデス・オーボナリス(*Leucinodes orbonalis*)、ロイコマ・サリシス(*Leucoma salicis*)、ロイコプテラ属の種(*Leucoptera* spp.)、例えば、L.コフエエラ(*L. coffeella*)、L.シテラ(*L. scitella*)；ロイミニボラ・リシニボレラ(*Leuminivora lycinivorella*)、リトコレチス・ブランカルデラ(*Lithocolletis blancardella*)、リトファン・アンテナータ(*Lithophane antennata*)、ラッチア・オクト(*Llattia octo*) (=アミナ・アキシス(*Amyna axis*))、ロベシア・ボトラナ(*Lobesia botrana*)、ロホカンパ属の種(*Lophocampa* spp.)、ロキサグロチス・アルビコスタ(*Loxagrotis albicosta*)、ロキソステグ属の種(*Loxostege* spp.)、例えば、L.スチクチカリス(*L. sticticalis*)、L.セララリス(*L. cereralis*)；リマントリア属の種(*Lymantria* spp.)、例えば、L.ジスパル(*L. dispar*)、L.モナカ(*L. monacha*)；モモハモグリガ(*Lyonetia clerkella*)、リオネチア・ブルニホリエラ(*Lyonetia prunifoliella*)、マラコソマ属の種(*Malacosoma* spp.)、例えば、M.アメリカナム(*M. americanum*)、M.カリホルニクム(*M. californicum*)、M.コンストリクツム(*M. constrictum*)、M.ノイストリア(*M. neustria*)；マメストラ属の種(*Mamestra* spp.)、例えば、M.ブラッシカ(*M. brassicae*)、M.コンフィグラタ(*M. configurata*)；マムストラ・ブラッシカ(*Mamstra brassicae*)、マンズカ属の種(*Manduca* spp.)、例えば、M.キンクマクラタ(*M. quinquemaculata*)、M.セキスタ(*M. sexta*)；マラスミア属の種(*Marasmia* spp.)、マルマラ属の種(*Marmara* spp.)、マルカ・テスチュラリス(*Maruca testulalis*)、メガロピグ・ラナタ(*Megalopyge lanata*)、メランクラ・ピクタ(*Melanchra picta*)、メラニチス・レダ(*Melanitis leda*)、モキス属の種(*Mocis* spp.)、例えば、M.ラピテス(*M. lapides*)、M.レパンダ(*M. repanda*)；モシス・ラチペス(*Mocis latipes*)、モノクロア・フラガリア(*Monochroa fragariae*)、ミチムナ・セバラータ(*Mythimna separata*)、ネマポゴン・クロアセラ(*Nemapogon cloacella*)、ネオロイシノデス・エレガンタリス(*Neoleucinodes elegantalis*)、ネピチア属の種(*Nepytia* spp.)、ニムフラ属の種(*Nymphula* spp.)、オイケチクス属の種(*Oiketeticus* spp.)、オミオデス・インジカタ(*Omiodes indicata*)、オンフィサ・アナストモサリス(*Omphisa anastomosalis*)、オペロフテラ・ブルマタ(*Operophtera brumata*)、オルギア・プソイドツガタ(*Orgyia pseudotsugata*)、オリア属の種(*Oria* spp.)、オルタガ・チリサリス(*Orthaga thyrisalis*)、オストリニア属の種(*Ostrinia* spp.)、例えば、O.ヌビラリス(*O. nubilalis*)；オウレマ・オリゼエ(*Oulema oryzae*)、パレアカリタ・ベルナタ(*Paleacrita vernata*)、パノリス・フランメア(*Panolis flammea*)、パルナラ属の種(*Parnara* spp.)、パパイペマ・ネブリス(*Papaipema nebris*)、パピリオ・クレスホンテス(*Papilio cressphontes*)、パラミエロイス・トランスイテラ(*Paramyelois*

transitella)、パラントレン・レガリス(*Paranthrene regalis*)、パイサンジシア・アルコン(*Paysandisia archon*)、ペクチノフォラ属の種(*Pectinophora* spp.)、例えば、*P.ゴッシピエラ*(*P. gossypiella*)；ニセタマナヤガ(*Peridroma saucia*)、ペリロイコブテラ属の種(*Perileucoptera* spp.)、例えば、*P.コフエエラ*(*P. coffeella*)；ファレラ・ブセファラ(*Phalera bucephala*)、フリガニジア・カリホルニカ(*Phryganidia californica*)、フソリマエア属の種(*Phthorimaea* spp.)、例えば、*P.オペルクレラ*(*P. operculella*)；フィロクニスティス・シトレラ(*Phyllocnistis citrella*)、フィロノリクテル属の種(*Phyllonorycter* spp.)、例えば、*P.ブランカルデラ*(*P. blancardella*)、*P.クラタエゲラ*(*P. crataegella*)、*P.イッシキイ*(*P. issikii*)、*P.リングニエラ*(*P. ringoniella*)；ピエリス属の種(*Pieris* spp.)、例えば、*P.ブラッシカ*(*P. brassicae*)、*P.ラパ*(*P. rapae*)、*P.ナピ*(*P. napi*)；ピロクロシス・トリプンクタタ(*Pilocrocis tripunctata*)、プラチペナ・スカブラ(*Plathypena scabra*)、プラチノタ属の種(*Platynota* spp.)、例えば、*P.フラベダナ*(*P. flavedana*)、*P.イダオイサリス*(*P. idaeusalis*)、*P.スツルタナ*(*P. stultana*)；プラチプチリア・カルズイダクチルア(*Platyptilia carduidactyla*)、プレベジュス・アルグス(*Plebejus argus*)、プロジア・インテルプンクテラ(*Plodia interpunctella*)、プルシア属の種(*Plusia* spp.)、プルテッラ・マクリペンニス(*Plutella maculipennis*)、プルテラ・キシロステラ(*Plutella xylostella*)、ボンチア・プロトジカ(*Pontia protodica*)、プライス属の種(*Prays* spp.)、プロデニア属の種(*Prodenia* spp.)、プロキセヌス・レピゴン(*Proxenus lepigone*)、シュードアレティア属の種(*Pseudaletia* spp.)、例えば、*P.セクアキス*(*P. sequax*)、*P.ユニプンクタ*(*P. unipuncta*)；ピラウスタ・ヌビラリス(*Pyrausta nubilalis*)、ラキブルシア・ヌ(*Rachiplusia nu*)、リキア・アルビコスタ(*Richia albicosta*)、リゾビウス・ヴェントラリス(*Rhizobius ventralis*)、リアキオニア・フルストラナ(*Rhyacionia frustrana*)、サブロデス・アエグロタタ(*Sabulodes aegrotata*)、スキズラ・コンシンナ(*Schizura concinna*)、スコエノビウス属の種(*Schoenobius* spp.)、スクレッケンステイニア・フェスタリエラ(*Schreckensteinia festaliella*)、スキルポファガ属の種(*Scirpophaga* spp.)、例えば、*S.インセルツラス*(*S. incertulas*)、*S.インノタタ*(*S. innotata*)；スコティア・セゲツム(*Scotia segetum*)、セサミア属の種(*Sesamia* spp.)、例えば、*S.インフェレンス*(*S. inferens*)、ソイジラ・スブフラバ(*Seudyra subflava*)、バクガ(*Sitotroga cerealella*)、テングハマキ(*Sparganothis pilleriana*)、スピロノタ・レクリアスピス(*Spilonota lechriaspis*)、*S.オセラナ*(*S. ocellana*)、スポドプテラ(=ランフィグマ)属の種(*Spodoptera* (=Lamphygma) spp.)、例えば、*S.エリダニア*(*S. eridania*)、*S.エキシグア*(*S. exigua*)、*S.フルギペルダ*(*S. frugiperda*)、*S.ラチスファシア*(*S. latisfascia*)、*S.リットラリス*(*S. littoralis*)、*S.リツラ*(*S. litura*)、*S.オミトガリ*(*S. omithogalli*)；スチグメラ属の種(*Stigmella* spp.)、ストモプテリクス・サブセシヴェラ(*Stomopteryx subsecivella*)、ストリモン・バゾキイ(*Strymon bazoc hii*)、シレプタ・デロガタ(*Sylepta derogata*)、シナンセドン属の種(*Synanthedon* spp.)、例えば、*S.エキシチオサ*(*S. exitiosa*)、テシア・ソラニヴォラ(*Tecia solanivora*)、テレヒン・リクス(*Telehin licus*)、タウマトポエア・ピチオカンパ(*Thaumetopoea pityocampa*)、タウマトチビア(=クリプトフレビア)・ロイコトレタ(*Thaumatotibia* (=Cryptophlebia) leucotreta)、タウメトポエア・ピチオカンパ(*Thaumetopoea pityocampa*)、テクラ属の種(*Thecla* spp.)、テレシミマ・アンペロファガ(*Theresimima ampelophaga*)、チリンテイナ属の種(*Thyrintina* spp.)、チルデニア・インコンスピクエラ(*Tildenia inconspicuell*)、チネア属の種(*Tinea* spp.)、例えば、*T.クロアセラ*(*T. cloacella*)、*T.ペリオネラ*(*T. pellionella*)；ティネオラ・ビセリエラ(*Tineola bisselliella*)、トルトリクス属の種(*Tortrix* spp.)、例えば、*T.ビリダナ*(*T. viridana*)；トリコファガ・タペツセラ(*Trichophaga tapetzella*)、トリコプルシア属の種(*Trichoplusia* spp.)、例えば、*T.ニ*(*T. ni*)；ツタ(=スクロビパルブラ)・アブソルタ(*Tuta* (=Scrobipalpula) absoluta)、ウデア属の種(*Udea* spp.)、例えば、*U.ルビガリス*(*U. rubigalis*)、*U.ルビガリス*(*U. rubigalis*)；ピラコラ属の種(*Virachola* spp.)、イポノモイタ・パデラ(*Yponomeuta padella*)、及びゼイラフェラ・カナデンシス(*Zeiraphera canadensis*)；

【0328】

鞘翅目(Coleoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アカリンマ・ビタタム(*Acalymma vittatum*)、インゲンマメゾウムシ(*Acanthoscehdes obtectus*)、アドレタス属の種(*Adoretus* spp.)、アゲラスティカ・アルニ(*Agelastica alni*)、アグリルス属の種(*Agrilus* spp.)、例えば、*A. アンキシウス*(*A. anxius*)、*A. プラニペンニス*(*A. planipennis*)、*A. シヌアツス*(*A. sinuatus*)；アグリオテス属の種(*Agriotes* spp.)、例えば、*A. フシコリス*(*A. fuscicollis*)、*A. リネアツス*(*A. lineatus*)、*A. オブスクルス*(*A. obscurus*)；アルフィトビウス・ジアペリヌス(*Alphitobius diaperinus*)、アンフィマルス・ソルスチチアリス(*Ampimallus solstitialis*)、アニサンドルス・ジスパル(*Anisandrus dispar*)、アニソプリア・アウストリアカ(*Anisoplia austriaca*)、アノビウム・プンクタツム(*Anobium punctatum*)、アノマラ・コルプレンタ(*Anomala corpulenta*)、ヒメコガネ(*Anomala rufocuprea*)、アノプロフォラ属の種(*Anoplophora* spp.)、例えば、*A. グラブリペンニス*(*A. glabriennis*)；アンソノマス属の種(*Anthonomus* spp.)、例えば、*A. オイゲニイ*(*A. eugenii*)、*A. グランジス*(*A. grandis*)、*A. ポモルム*(*A. pomorum*)；アンスレナス属の種(*Anthrenus* spp.)、アフトナ・ユーホリダエ(*Aphthona euphoridae*)、アピオン属の種(*Apion* spp.)、アポゴニア属の種(*Apogonia* spp.)、アソウス・ハエモロイダリス(*Athous haemorrhoidalis*)、アトマリア属の種(*Atomaria* spp.)、例えば、*A. リネアリス*(*A. linearis*)；アタゲナス属の種(*Attagenus* spp.)、ウリハムシ(*Aulacophora femoralis*)、ブラストファガス・ピニベルダ(*Blastophagus piniperda*)、ブリトファガ・ウンダタ(*Blitophaga undata*)、ブルキディウス・オブテクタス(*Bruchidius obtectus*)、ブルーカス属の種(*Bruchus* spp.)、例えば、*B. レンチス*(*B. lentis*)、*B. ピソルム*(*B. pisorum*)、*B. ルフィマヌス*(*B. rufimanus*)；ビクチスクス・ベツラ(*Byctiscus betulae*)、カリジエルム・ルフィペン(*Callidiellum rufipenne*)、カロピストリア・フロリデンシス(*Callopietria floridensis*)、アズキマメゾウムシ(*Callosobruchus chinensis*)、カメラリア・オーリデラ(*Cameraria ohridella*)、カメノコハムシ(*Cassida nebulosa*)、セロトマ・トリフルカタ(*Cerotoma trifurcata*)、セトニア・アウラタ(*Cetonia aurata*)、ケウトリンクス属の種(*Ceuthorrhynchus* spp.)、例えば、*C. アッシミリス*(*C. assimilis*)、*C. ナピ*(*C. napi*)；ケトクネマ・ティビアリス(*Chaetocnema tibialis*)、クレオヌス・メンディクス(*Cleonus mendicus*)、コノデルス属の種(*Conoderus* spp.)、例えば、*C. ベスペルチヌス*(*C. vespertinus*)；コノトラケルス・ネヌファル(*Conotrachelus nenuphar*)、コスモポリテス属の種(*Cosmopolites* spp.)、コステリトラ・ジーランディカ(*Costelytra zealandica*)、クリオセリス・アスパラギ(*Crioceris asparagi*)、クリプトレステス・フェルギノイス(*Cryptolestes ferrugineus*)、クリプトリンカス・ラパチ(*Cryptorhynchus lapathi*)、クテニセラ属の種(*Ctenicera* spp.)、例えば、*C. デストルクトル*(*C. destructor*)；クルクリオ属の種(*Curculio* spp.)、シリンドロコプツルス属の種(*Cylindrocopturus* spp.)、シクロセファラ属の種(*Cyclocephala* spp.)、ダクチルイスバ・バリイ(*Dactylispa balyi*)、デクテス・テキサヌス(*Dectes texanus*)、デルメステス属の種(*Dermestes* spp.)、ジアプロティカ属の種(*Diabrotica* spp.)、例えば、*D. ウンデシンプンクタタ*(*D. undecimpunctata*)、*D. スペシオサ*(*D. speciosa*)、*D. ロンギコルニス*(*D. longicornis*)、*D. セミプンクタタ*(*D. semipunctata*)、*D. ビルギフェラ*(*D. virgifera*)；ジアブレペス・アッブレピアテス(*Diaprepes abbreviata*)、ディコクロシス属の種(*Dichocrocis* spp.)、ディクラディスバ・アルミゲラ(*Dicladispa armigera*)、アブデルスツノカブト(*Diloboderus abderus*)、ジオカランドラ・フルメンチ(*Diocalandra frumenti*) (ジオカランドラ・スチグマチコリス(*Diocalandra stigmaticollis*))、エナファロデス・ルフルス(*Enaphalodes rufulus*)、エピラクナ属の種(*Epilachna* spp.)、例えば、*E. バリベスチス*(*E. varivestis*)、*E. ビギンチオクトマクラタ*(*E. vigintioctomaculata*)；エピトリックス属の種(*Epitrix* spp.)、例えば、*E. ヒルチペンニス*(*E. hirtipennis*)、*E. シミラリス*(*E. similaris*)；オイテオラ・フミリス(*Eutheola humilis*)、ユーチノボトルス・ブラシリエンシス(*Eutinobothrus brasiliensis*)、ファウスチヌス・クバエ(*Faustinus cubae*)、ギビウム・プシロイデス(*Gibbium psyllioides*)、グナトセルス・コルヌツス(*Gnathocerus cornutus*)、ヘルラ・ウンダリス(*Hellu*

la undalis)、ヘテロニカス・アラトル(*Heteronychus arator*)、ヒラモルファ・エレガン
 ス(*Hylamorpha elegans*)、ヒロビウス・アビエチス(*Hylobius abietis*)、ヒロトルペス・
 バユルス(*Hylotrupes bajulus*)、ヒペラ属の種(*Hypera* spp.)、例えば、*H. ブルンネイペ*
ンニス(*H. brunneipennis*)、*H. ポスチカ*(*H. postica*)； ヒポメセス・スクアモス(*Hypo*
meces squamosus)、ハイボセネムス属の種(*Hypothenemus* spp.)、ヤツバキクイムシ(*Ips*
typographus)、ラクノステルナ・コンサンガイネア(*Lachnosterna consanguinea*)、ラシ
 オデルマ・セリコルン(*Lasioderma serricorne*)、ラテチクス・オリザ(*Latheticus oryza*
e)、ラトリジウス属の種(*Lathridius* spp.)、レマ属の種(*Lema* spp.)、例えば、*L. ビリネ*
アタ(*L. bilineata*)、*L. メラノプス*(*L. melanopus*)； レプチノタルサ属の種(*Leptinotar*
sa spp.)、例えば、*L. デセムリネアタ*(*L. decemlineata*)； レプチスバ・ピグマエア(*Lep*
tispa pygmaea)、リモニウス・カリホルニカス(*Limonius californicus*)、リソロプトル
 ス・オリゾフィルス(*Lissorhoptrus oryzophilus*)、リクサス属の種(*Lixus* spp.)、ルペ
 ロデス属の種(*Luperodes* spp.)、リクタス属の種(*Lyctus* spp.)、例えば、*L. ブルノイス*(
L. bruneus)； リオゲニス・フスクス(*Liogenys fuscus*)、マクロダクチルウス属の種(*Ma*
croductylus spp.)、例えば、*M. スブスピノス*(*M. subspinosus*)； マラデラ・マトリダ
 (*Maladera matrida*)、メガプラチプス・ムタテス(*Megaplatypus mutates*)、メガスセリス
 属の種(*Megascelis* spp.)、メラノツス・コムニス(*Melanotus communis*)、メリゲテス
 属の種(*Meligethes* spp.)、例えば、*M. アエノイス*(*M. aeneus*)； メロロンタ属の種(*Melo*
lontha spp.)、例えば、*M. ヒッポカスタニ*(*M. hippocastani*)、*M. メロロンタ*(*M. melolon*
tha)； メタマシウス・ヘミプテルス(*Metamasius hemipterus*)、ミクロテカ属の種(*Micro*
theca spp.)、ミグドルス属の種(*Migdolus* spp.)、例えば、*M. フリアヌス*(*M. fryanus*)、
 モノカムス属の種(*Monochamus* spp.)、例えば、*M. アルテルナツス*(*M. alternatus*)； ナ
 ウパクツス・キサソグラフス(*Naupactus xanthographus*)、ニプトゥス・ホロレウクス(
Niptus hololeucus)、オベリア・ブレビス(*Oberia brevis*)、オエモナ・ヒルタ(*Oemona h*
irta)、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*)、オリザファガス・オリザエ(*Oryzaphagus oryzae*)、
 オチオリンクス・スルカタス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オチオリンクス・オパタス(*Oti*
orrhynchus ovatus)、オチオリンクス・スルカタス(*Otiorrhynchus sulcatus*)、オウレマ
 ・メラノプス(*Oulema melanopus*)、オウレマ・オリゼエ(*Oulema oryzae*)、オキシセトニ
 ア・ジュクンダ(*Oxycetonia jucunda*)、ファエドン属の種(*Phaedon* spp.)、例えば、*P. ブ*
ラッシカ(*P. brassicae*)、*P. コクレアリア*(*P. cochleariae*)； ホラカンタ・レクルバ(*Ph*
oracantha recurva)、フィロビウス・ピリ(*Phyllobius pyri*)、フィロペルタ・ホルチコ
 ラ(*Phyllopertha horticola*)、フィロファガ属の種(*Phyllophaga* spp.)、例えば、*P. ヘレ*
リ(*P. helleri*)； フィロトレタ属の種(*Phyllotreta* spp.)、例えば、*P. クリソセファラ*(
P. chrysocephala)、*P. ネモルム*(*P. nemorum*)、*P. ストリオラタ*(*P. striolata*)、*P. ビッ*
ツラ(*P. vittula*)； フィロペルタ・ホルチコラ(*Phyllopertha horticola*)、ポピリア・
 ジャポニカ(*Popillia japonica*)、プレムノトリペス属の種(*Premnotrypes* spp.)、プサコ
 テア・ヒラリス(*Psacothaea hilaris*)、プシリオデス・クリンセファラ(*Psylliodes chrys*
ocephala)、プロステファヌス・トルンカテス(*Prostephanus truncates*)、プシリオデス
 属の種(*Psylliodes* spp.)、プチナス属の種(*Ptinus* spp.)、ブルガ・サルトナ(*Pulga sal*
tona)、リゾペルタ・ドミニカ(*Rhizopertha dominica*)、リンコホルス属の種(*Rhynchopho*
rus spp.)、例えば、*R. ビリネアツス*(*R. billineatus*)、*R. フェルギノイス*(*R. ferrugine*
us)、*R. パルマルム*(*R. palmarum*)、*R. ホエニシス*(*R. phoenicis*)、*R. ブルネラツス*(*R. vu*
lneratus)； サベルダ・カンジダ(*Saperda candida*)、スコリツス・スケビレウイ(*Scolyt*
us schevyrewi)、シホホルス・アクブンクタツス(*Scyphophorus acupunctatus*)、アカア
 シチビコフキゾウムシ(*Sitona lineatus*)、シトフィラス属の種(*Sitophilus* spp.)、例え
 ば、*S. グラナリア*(*S. granaria*)、*S. オリザ*(*S. oryzae*)、*S. ゼアマイス*(*S. zeamais*)；
 スフェノフォラス属の種(*Sphenophorus* spp.)、例えば、*S. レビス*(*S. levis*)； ステゴビ
 ウム・パニコイム(*Stegobium paniceum*)、ステルネクス属の種(*Sternechus* spp.)、例え
 ば、*S. スブシグナツス*(*S. subsignatus*)； ストロホモルフス・クテノツス(*Strophomorph*

us ctenotus)、シンフィレテス属の種(Symphyletes spp.)、タニメカス属の種(Tanymecus spp.)、テネブリオ・モリター(Tenebrio molitor)、テネブリオイデス・マウレタニクス(Tenebrioides mauretanicus)、トリボリウム属の種(Tribolium spp.)、例えば、T.カス
タノイム(T. castaneum)； トロゴデルマ属の種(Trogoderma spp.)、チキアス属の種(Tychius spp.)、キシロトレカス属の種(Xylotrechus spp.)、例えば、X.ピロデルス(X. pyrrhoderus)；及び、ザブルス属の種(Zabrus spp.)、例えば、Z.テネブリオイデス(Z. tenebrioides)；

【0329】

双翅目(Diptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アエデス属の種(Aedes spp.)、例えば、A.アエギプチ(A. aegypti)、A.アルボピクツス(A. albopictus)、A.ベキサンス(A. vexans)；メキシコミバエ(Anastrepha ludens)、アノフェレス属の種(Anopheles spp.)、例えば、A.アルビマヌス(A. albimanus)、A.クルシアンス(A. crucians)、A.フレイボルニ(A. freeborni)、A.ガンビア(A. gambiae)、A.ロイコスフィルス(A. leucosphyrus)、A.マクリペンニス(A. maculipennis)、A.ミニムス(A. minimus)、A.クアドリマクラツス(A. quadrimaculatus)、A.シネンシス(A. sinensis)；バクトロセラ・インバデンス(Bactrocer invadens)、ビビオ・ホルツラヌス(Bibio hortulanus)、カリフォラ・エリスロセファラ(Calliphora erythrocephala)、カリフォラ・ビシナ(Calliphora vicina)、セラティティス・キャピタータ(Ceratitis capitata)、クリソミア属の種(Chrysomyia spp.)、例えば、C.ベッジアナ(C. bezziana)、C.ホミニボラキス(C. hominivorax)、C.マセラリア(C. macellaria)；クリソプス・アトランチクス(Chrysops atlanticus)、クリソプス・ディスカリス(Chrysops discalis)、クリソプス・シラセア(Chrysops silacea)、コクリオミイア属の種(Cochliomyia spp.)、例えば、C.ホミニボラキス(C. hominivorax)；コンタリニア属の種(Contarinia spp.)、例えば、C.ソルギコラ(C. sorghicola)；コルディオピア・アンスロポファガ(Cordylobia anthropophaga)、クレックス属の種(Culex spp.)、例えば、C.ニグリパルプス(C. nigripalpus)、C.ピピエンス(C. pipiens)、C.キンクファシアツス(C. quinquefasciatus)、C.タルサリス(C. tarsalis)、C.トリタエニオリンクス(C. tritaeniorhynchus)；クリコイデス・フレンス(Culicoides furens)、クリセタ・イノルナタ(Culiseta inornata)、クリセタ・メラヌラ(Culiseta melanura)、クテレブラ属の種(Cuterebra spp.)、ウリミバエ(Dacus cucurbitae)、ダカス・オレアエ(Dacus oleae)、ダイコンタマバエ(Dasineura brassicae)、ダシノイラ・オキシコッカナ(Dasineura oxycoccana)、デリア属の種(Delia spp.)、例えば、D.アンチク(D. antique)、D.コアルクタタ(D. coarctata)、D.プラツラ(D. platura)、D.ラジクム(D. radicum)；デルマトビア・ホミニス(Dermatobia hominis)、ドロソフィラ属の種(Drosophila spp.)、例えば、D.スズキイ(D. suzukii)、ファニア属の種(Fannia spp.)、例えば、F.カニクラリス(F. canicularis)；ガステロフィルス属の種(Gastrophilus spp.)、例えば、G.インテスチナリス(G. intestinalis)；ゲオミザ・チプンクタタ(Geomyza tipunctata)、グロッシナ属の種(Glossina spp.)、例えば、G.フシペス(G. fuscipes)、G.モルシタンス(G. morsitans)、G.パルパリス(G. palpalis)、G.タキノイデス(G. tachinoides)；ノサシバエ(Haematobia irritans)、ハプロジプロシス・エクエストリス(Haplodiplosis equestris)、ヒッペラテス属の種(Hippelates spp.)、ヒレミア属の種(Hylemyia spp.)、例えば、H.プラツラ(H. platura)；ヒポデルマ属の種(Hypoderma spp.)、例えば、H.リネアタ(H. lineata)；ヒッポボスカ属の種(Hyppobosca spp.)、トウヨウイネクキミギワバエ(Hydrellia philippina)、レプトコノプス・トレンス(Leptoconops torrens)、リリオミザ属の種(Liriomyza spp.)、例えば、L.サチバ(L. sativae)、L.トリホリイ(L. trifolii)；ルシリア属の種(Lucilia spp.)、例えば、L.カブリナ(L. caprina)、L.クブリナ(L. cuprina)、L.セリカタ(L. sericata)；リコリア・ペクトラリス(Lycoria pectoralis)、マンソニア・ティティラヌス(Mansonia titillanus)、マイエチオラ属の種(Mayetiola spp.)、例えば、M.デストルクトル(M. destructor)；ムスカ属の種(Musca spp.)、例えば、M.アウツムナリス(M. autumnalis)、M.ドメスチカ(M. domestica)；オオイエバエ(Muscina stabulans)、オエストルス属の種(Oestrus spp.)、例えば、O.オビス(O. ovis)；オボミザ・フロ

10

20

30

40

50

ルム(*Opomyza florum*)、オシネラ属の種(*Oscinella* spp.)、例えば、*O. フリット* (*O. frit*) ; オルセオリア・オリゼ(*Orseolia oryzae*)、ペゴミア・ヒソシアミ(*Pegomya hysocyami*)、フェレボトムス・アルゲンチペス(*Phlebotomus argentipes*)、ホルビア属の種(*Phorb* *ia* spp.)、例えば、*P. アンチクア* (*P. antiqua*)、*P. ブラッシカ* (*P. brassicae*)、*P. コアル* *クタタ* (*P. coarctata*) ; フィトミザ・ギムノストマ(*Phytomyza gymnostoma*)、プロシム
 リウム・ミクスタム(*Prosimulium mixtum*)、プシラ・ロザエ(*Psila rosae*)、プソロフォ
 ラ・コロムビアエ(*Psorophora columbiae*)、プソロフォラ・ディスカラ(*Psorophora disc* *olor*)、ラゴレチス属の種(*Rhagoletis* spp.)、例えば、*R. セラシ* (*R. cerasi*)、*R. シング* *ラート* (*R. cingulate*)、*R. インジフェレンス* (*R. indifferens*)、*R. メンダキス* (*R. mendax*)、*R. ポモネラ* (*R. pomonella*) ; リベリア・クアドリファシアタ(*Rivellia quadrifascia* *ta*)、サルコファガ属の種(*Sarcophaga* spp.)、例えば、*S. ハエモロイダリス* (*S. haemorrh* *oidalis*) ; シムリウム・ウィッタツム(*Simulium vittatum*)、シトジプロシス・モセラナ
 (*Sitodiplosis mosellana*)、ストモキシス属の種(*Stomoxys* spp.)、例えば、*S. カルシト* *ランス* (*S. calcitrans*) ; タバヌス属の種(*Tabanus* spp.)、例えば、*T. アトラツス* (*T. at* *ratus*)、*T. ボビヌス* (*T. bovinus*)、*T. リネオラ* (*T. lineola*)、*T. シミリス* (*T. similis*) ;
 タンニア属の種(*Tannia* spp.)、テコジプロシス・ジャポネンシス(*Thecodiplosis japon* *ensis*)、チブラ・オレラセア(*Tipula oleracea*)、チブラ・パルドサ(*Tipula paludosa*)、
 及びウォールファールチア属の種(*Wohlfahrtia* spp.) ;

【0330】

総翅目(Thysanoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、バリオトリプス・ビフォルミス(*Baliothrips biformis*)、ジクロモトリプス・コルベッチ(*Dichromothrips corbetti*)、ジ
 クロモトリプス亜種(*Dichromothrips* spp.)、エキノトリプス・アメリカヌス(*Echinothri* *ps americanus*)、エネオトリプス・フラベンス(*Enneothrips flavens*)、フランクリニエ
 ラ属の種(*Frankliniella* spp.)、例えば、*F. フスカ* (*F. fusca*)、*F. オッシデンタリス* (*F.* *occidentalis*)、*F. トリチシ* (*F. tritici*) ; ヘリオスリップス属の種(*Heliothrips* spp.)
 、ヘルシノスリップス・フェモラリス(*Hercinothrips femoralis*)、カコスリップス属の
 種(*Kakothrips* spp.)、ミクロセファロトリプス・アブドミナリス(*Microcephalothrips a* *bdominalis*)、ネオヒダトトリプス・サマユンクル(*Neohydatothrips samayunkur*)、ペゾ
 トリプス・ケリアヌス(*Pezothrips kellyanus*)、リピフォロスリップス・クルエンタツ
 ツス(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、スキルトスリップス属の種(*Scirtothrips* spp.)、例
 えば、*S. シトリ* (*S. citri*)、*S. ドルサリス* (*S. dorsalis*)、*S. ペルセア* (*S. perseae*) ; ス
 テンカエトリプス属の種(*Stenchaetothrips* spp.)、タエニオスリップス・カルダモニ(*T* *aeniothrips cardamoni*)、タエニオトリプス・インコンセクエンス(*Taeniothrips incons* *equens*)、スリップス属の種(*Thrips* spp.)、例えば、*T. イマギネス* (*T. imagines*)、*T. ハ* *ワイイエンシス* (*T. hawaiiensis*)、*T. オリザ* (*T. oryzae*)、*T. パルミ* (*T. palmi*)、*T. パル* *ビスピヌス* (*T. parvispinus*)、*T. タバシ* (*T. tabaci*) ;

【0331】

半翅目(Hemiptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アシジリア・ジャマトニカ(*Acizzia* *jamatonica*)、アクロステルヌム属の種(*Acrosternum* spp.)、例えば、*A. ヒラル* (*A. hila* *re*) ; アシルトシポン属の種(*Acyrtosipon* spp.)、例えば、*A. オノブリキス* (*A. onobryc* *his*)、*A. ピスム* (*A. pisum*) ; カラマツカサアブラムシ(*Adelges laricis*)、アデルゲス・
 ツガ(*Adelges tsugae*)、アデルホコリス属の種(*Adelphocoris* spp.)、例えば、*A. ラピズ* *ス* (*A. rapidus*)、*A. スペルブス* (*A. superbus*) ; アエネオラミア属の種(*Aeneolamia* spp.)
 、アゴノセナ属の種(*Agonosцена* spp.)、アウラコルサム・ソラニ(*Aulacorthum solani*)
 、アレウロカンツス・ウォグルミ(*Aleurocanthus woglumi*)、アレウローデス属の種(*Aleu* *rodes* spp.)、アレウロジクス・ジスペルセス(*Aleurodicus disperses*)、アレウロボス
 ・バロデンシス(*Aleurolobus barodensis*)、アレウロスリンクス属の種(*Aleurothrixus s* *pp.*)、アムラスカ属の種(*Amrasca* spp.)、アナサ・トリスティス(*Anasa tristis*)、アン
 テスティオプシス属の種(*Antestiopsis* spp.)、アヌラフィス・カルドゥイ(*Anuraphis ca* *rdui*)、アオニディエラ属の種(*Aonidiella* spp.)、アフアノスティグマ・ピリ(*Aphanosti*

60
40
20
0

a spp.)、ユーリガステル属の種(*Eurygaster* spp.)、例えば、*E. インテグリセプス*(*E. integriceps*)；ユーセリス・ビロバタス(*Euscelis bilobatus*)、ユースキスツス属の種(*Euschistus* spp.)、例えば、*E. ヘロース*(*E. heros*)、*E. インピクチベントリス*(*E. impictiventris*)、*E. セルプス*(*E. servus*)；フィオリニア・テア(*Fiorinia theae*)、ゲオコックス・コッフエアエ(*Geococcus coffeae*)、グリカスピス・ブリンブレコンベイ(*Glycaspis brimblecombei*)、ハリオモルファ属の種(*Halyomorpha* spp.)、例えば、*H. ハリス*(*H. halyis*)；ヘリオベルティス属の種(*Heliopeltis* spp.)、ホマロジスカ・ビトリペンニス(=*H. コアグラタ*)(*Homalodisca vitripennis*(=*H. coagulata*))、ホルキアス・ノビレルス(*Horcias nobilellus*)、モモコフキアブラムシ(*Hyalopterus pruni*)、チシャミドリアブラムシ(*Hyperomyzus lactucae*)、イセリヤ属の種(*Icerya* spp.)、例えば、*I. プルカーゼ*(*I. purchase*)；イディオケルス属の種(*Idiocerus* spp.)、イディオスコプス属の種(*Idioscopus* spp.)、ラオデルファクス・ストリアテルス(*Laodelphax striatellus*)、レカニウム属の種(*Lecanium* spp.)、レカノイドイス・フロッシッシムス(*Lecanoides floccissimus*)、レピドサフェス属の種(*Lepidosaphes* spp.)、例えば、*L. ウルミ*(*L. ulmi*)；レプトコリス属の種(*Leptocoris* spp.)、レプトグロサス・フィロプス(*Leptoglossus phyllopus*)、リパフィス・エリシミ(*Lipaphis erysimi*)、リグス属の種(*Lygus* spp.)、例えば、*L. ヘスペルス*(*L. hesperus*)、*L. リネオラリス*(*L. lineolaris*)、*L. プラテンシス*(*L. pratensis*)；マコネリコックス・ヒルスツス(*Maconelllicoccus hirsutus*)、マルカリナ・ヘレニカ(*Marchalina hellenica*)、マクロペス・エクスカバツス(*Macropes excavatus*)、マクロシフム属の種(*Macrosiphum* spp.)、例えば、*M. ロサ*(*M. rosae*)、*M. アベナ*(*M. avenae*)、*M. オイホルビア*(*M. euphorbiae*)；マクロステレス・クアドリリネアツス(*Macrosteles quadrilineatus*)、マハナルバ・フィムブリオラタ(*Mahanarva fimbriolata*)、タイワンマルカメムシ(*Megacopta cribraria*)、ソラマメヒゲナガアブラムシ(*Megoura viciae*)、メラナフィス・ピラリウス(*Melanaphis pyrae*)、メラナフィス・サッカリ(*Melanaphis sacchari*)、メラノカリス(=*チノカリス*)・カリアエホリア(*Melanocallis*(=*Tinocallis*) *caryaefoliae*)、メトカルフィエラ属の種(*Metcalfiella* spp.)、メトポロフィウム・ジルホヅム(*Metopolophium dirhodum*)、モネリア・コスタリス(*Monellia costalis*)、モネリオプシス・ペカニス(*Monelliopsis pecanis*)、ミゾカリス・コリルイ(*Myzocallis coryli*)、ムルガンチア属の種(*Murgantia* spp.)、ミズス属の種(*Myzus* spp.)、例えば、*M. アスカロニクス*(*M. ascalonicus*)、*M. セラシ*(*M. cerasi*)、*M. ニコチアナ*(*M. nicotianae*)、*M. ペルシカ*(*M. persicae*)、*M. バリアンス*(*M. varians*)；ナソノビア・リビスニグリ(*Nasonovia ribis-nigri*)、ネオトキソプテラ・ホルモサナ(*Neotoxoptera formosana*)、ネオメガロトムス属の種(*Neomegalotomus* spp.)、ネホテティクス属の種(*Nephotettix* spp.)、例えば、*N. マラヤヌス*(*N. malayanus*)、*N. ニグロピクツス*(*N. nigropictus*)、*N. パルプス*(*N. parvus*)、*N. ビレセンス*(*N. virescens*)；ネザラ属の種(*Nezara* spp.)、例えば、*N. ビリズラ*(*N. viridula*)；ニラパルバータ・ルゲンス(*Nilaparvata lugens*)、ニシウス・フットニ(*Nysius huttoni*)、オエバルス属の種(*Oebalus* spp.)、例えば、*O. プグナキス*(*O. pugnax*)；オンコメトピア属の種(*Oncometopia* spp.)、オルテジア・ブラエロンガ(*Orthezia praelonga*)、オキシカラエヌス・ヒアリニペンニス(*Oxycaraenus hyalinipennis*)、パラベミシア・ミリカエ(*Parabemisia myricae*)、パルラトリア属の種(*Parlatoria* spp.)、パルテノレカニウム属の種(*Parthenolecanium* spp.)、例えば、*P. コルニ*(*P. corni*)、*P. ペルシカ*(*P. persicae*)；ペムフィグス属の種(*Pemphigus* spp.)、例えば、*P. ブルサリウス*(*P. bursarius*)、*P. ポプリベナ*(*P. populivenae*)；ペレグリヌス・マイディス(*Peregrinus maidis*)、クロフツノウンカ(*Perkinsiella saccharicida*)、フェナコッカス属の種(*Phenacoccus* spp.)、例えば、*P. アセリス*(*P. aceris*)、*P. ゴッシパイ*(*P. gossypii*)；プロエオミズス・パセリニイ(*Phloeomyzus passerinii*)、フォロドン・フミリ(*Phorodon humuli*)、フィロクセラ属の種(*Phylloxera* spp.)、例えば、*P. デバスタトリキス*(*P. devastatrix*)、ピエスマ・クアドラタ(*Piesma quadrata*)、ピエゾドラス属の種(*Piezodorus* spp.)、例えば、*P. ギイルジニイ*(*P. guildinii*)；ピナスピス・アスピディストラエ(*Pinnaspis aspidistrae*)、プラノコッカス属の種(*Planococcus* spp.)、例えば、*P. シトリ*(*P. citri*)

i)、*P. フィクス*(*P. ficus*) ; *プロサピア・ビシンクタ*(*Prosapia bicincta*)、*プロトパル
ピナリア・ピリフォルミス*(*Protopulvinaria pyriformis*)、*プサルス・セリアツス*(*Psall
us seriatus*)、*シューダシスタ・ペルセア*(*Pseudacysta perseae*)、*シュードオーラカスピ
ス・ペンタゴナ*(*Pseudaulacaspis pentagona*)、*シュードコッカス*属の種(*Pseudococcus s
pp.*)、例えば、*P. コムストック*(*P. comstocki*) ; *プシラ*属の種(*Psylla spp.*)、例えば、
P. マリ(*P. mali*) ; *プテロマルス*属の種(*Pteromalus spp.*)、*プルピナリア・アミグダリ*(
Pulvinaria amygdali)、*ピリラ*属の種(*Pyrilla spp.*)、*クアドラスピディオツス*属の種(*Q
uadraspidiotus spp.*)、例えば、*Q. ペルニシオス*(*Q. perniciosus*) ; *クエサダ・ギガ
ス*(*Quesada gigas*)、*ラストロコッカス*属の種(*Rastrococcus spp.*)、*レデュビウス・セニ
リス*(*Reduvius senilis*)、*リゾエクス・アメリカヌス*(*Rhizoecus americanus*)、*ロドニウ
ス*属の種(*Rhodnius spp.*)、*ロパロミズス・アスカロニクス*(*Rhopalomyzus ascalonicus*)
、*ロパロシファム*属の種(*Rhopalosiphum spp.*)、例えば、*R. プソイドブラッシカス*(*R. ps
eudobrassicas*)、*R. インセルツム*(*R. insertum*)、*R. マイジス*(*R. maidis*)、*R. パジ*(*R. pa
di*) ; *ソガトデス*属の種(*Sagatodes spp.*)、*サールベルゲラ・シンギュラリス*(*Sahlberge
lla singularis*)、*サイセティア*属の種(*Saissetia spp.*)、*サッパフィス・マラ*(*Sappaphi
s mala*)、*サッパフィス・マリ*(*Sappaphis mali*)、*スカプトコリス*属の種(*Scaptocoris sp
p.*)、*スカホイデス・ティタヌス*(*Scaphoides titanus*)、*スキザフィス・グラミナム*(*Schi
zaphis graminum*)、*シゾネウラ・ラヌギノサ*(*Schizoneura lanuginosa*)、*スコチノフォラ
属*の種(*Scotinophora spp.*)、*セレナスピズス・アルティキュラツス*(*Selenaspidus artic
ulatus*)、*シトビオン・アベナエ*(*Sitobion avenae*)、*ソガタ*属の種(*Sogata spp.*)、*ソガ
テラ・フリシフェラ*(*Sogatella furcifera*)、*ソルベア・インスラリス*(*Solubea insulari
s*)、*スピッシスチルス・フェスチヌス*(=*スティクトセファラ・フェスティナ*)(*Spissistil
us festinus*(=*Stictocephala festina*))、*ステファニティス・ナシ*(*Stephanitis nashi*)
、*ステファニチス・ピリオイデス*(*Stephanitis pyrioides*)、*ステファニチス・タケヤイ*(
Stephanitis takeyai)、*テナラファラ・マレイエンシス*(*Tenalaphara malayensis*)、*テト
ラロイロデス・ペルセア*(*Tetraleurodes perseae*)、*テリオアフィス・マクラート*(*Therio
aphis maculate*)、*チアンタ*属の種(*Thyanta spp.*)、例えば、*T. アッセラ*(*T. accerra*)、*T
. ペルジトル*(*T. perditor*) ; *ティブラカ*属の種(*Tibraca spp.*)、*トマスピス*属の種(*Toma
spis spp.*)、*トキソプテラ*属の種(*Toxoptera spp.*)、例えば、*T. アウランチイ*(*T. aurant
ii*) ; *トリアレウロデス*属の種(*Trialeurodes spp.*)、例えば、*T. アブチロネア*(*T. abuti
lonea*)、*T. リシニ*(*T. ricini*)、*T. バボラリオルム*(*T. vaporariorum*) ; *トリアトマ*属の
種(*Triatoma spp.*)、*トリオーザ*属の種(*Trioza spp.*)、*チフロシバ*属の種(*Typhlocyba sp
p.*)、*ウナスピス*属の種(*Unaspis spp.*)、例えば、*U. シトリ*(*U. citri*)、*U. ヤノネンシス*(
U. yanonensis) ; 及び *ビテウス・ビティフォリ*(*Viteus vitifolii*)、

【0332】

膜翅目(Hymenoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、*アカントミオプス・インテルジェ
クツス*(*Acanthomyops interjectus*)、*アタリア・ロサエ*(*Athalia rosae*)、*アッタ*属の種(
Atta spp.)、例えば、*A. カピグアラ*(*A. capiguara*)、*A. セファロテス*(*A. cephalotes*)、*A
. セファロテス*(*A. cephalotes*)、*A. ラエビガタ*(*A. laevigata*)、*A. ロブスタ*(*A. robusta*)
、*A. セキスデンス*(*A. sexdens*)、*A. テキサナ*(*A. texana*)、*ボンブス*属の種(*Bombus spp.*)
、*ブラキミルメキス*属の種(*Brachymyrmex spp.*)、*カンボノツス*属の種(*Camponotus spp.*)
、例えば、*C. フロリダヌス*(*C. floridanus*)、*C. ペンシルバニクス*(*C. pennsylvanicus*)、
C. モドク(*C. modoc*) ; *カルジオコンジルア・ヌダ*(*Cardiocondyla nuda*)、*カリビオン*属
の種(*Chalibion sp*)、*クレマトガスター*属の種(*Crematogaster spp.*)、*ダシムチラ・オッ
シデンタリス*(*Dasymutilla occidentalis*)、*ディプリオン*属の種(*Diprion spp.*)、*ドリコ
ベスプラ・マクラータ*(*Dolichovespula maculata*)、*ドリミルメキス*属の種(*Dorymyrmex s
pp.*)、*ドリオコスムス・クリフィルス*(*Dryocosmus kuriphilus*)、*ホルミカ*属の種(*Formic
a spp.*)、*ホプロカンパ*属の種(*Hoplocampa spp.*)、例えば、*H. ミヌタ*(*H. minuta*)、*H. テ
スツジネア*(*H. testudinea*) ; *イリドミルメキス・フミリス*(*Iridomyrmex humilis*)、*ラ
シウス*属の種(*Lasius spp.*)、例えば、*L. ニゲル*(*L. niger*)、*アルゼンチンアリ*(*Linepith*

ema humile)、リオメトプム属の種(Liometopum spp.)、レプトシブ・インバサ(Leptocybe invasa)、モノモリウム属の種(Monomorium spp.)、例えば、M.ファラオニス(M. pharaonis)、モノモリウム(Monomorium)、ニルアンドリア・フルバ(Nylandria fulva)、パキコンジリア・キネンシス(Pachycondyla chinensis)、パラトレキナ・ロンギコルニス(Paratrechina longicornis)、パラベスブラ属の種(Paravespula spp.)、例えば、P.ゲルマニカ(P. germanica)、P.ペンシルバニカ(P. pennsylvanica)、P.ブルガリス(P. vulgaris)；フェイドール属の種(Pheidole spp.)、例えば、P.メガセファラ(P. megacephala)；ポゴノミルメキス属の種(Pogonomyrmex spp.)、例えば、P.バルバツス(P. barbatus)、P.カリホルニクス(P. californicus)、ポリステス・ルビギノサ(Polistes rubiginosa)、プレノレピス・インパイルス(Prenolepis imparis)、プソイドミルメキス・グラシリス(Pseudomyrmex gracilis)、スケリプロン属の種(Schelipron spp.)、シレキス・シアノイス(Sirex cyanus)、ソレノプシス属の種(Solenopsis spp.)、例えば、S.ゲミナタ(S. geminata)、S.インビクタ(S. invicta)、S.モレスタ(S. molesta)、S.リクテリ(S. richteri)、S.キシロニ(S. xyloni)、スフェシウス・スペシオスス(Sphex speciosus)、スフェキス属の種(Sphex spp.)、タピノマ属の種(Tapinoma spp.)、例えば、T.メラノセファラム(T. melanocephalum)、T.セッシル(T. sessile)；テトラモリウム属の種(Tetramorium spp.)、例えば、T.カエスピウム(T. caespitum)、T.ビカリナツム(T. bicarinatum)、ベスパ属の種(Vespa spp.)、例えば、V.クラブロ(V. crabro)；ベスブラ属の種(Vespula spp.)、例えば、V.スクアモサル(V. squamosa)；ワスマンニア・アウロブククタタ(Wasmannia auropunctata)、キシロコパ属の種(Xylocopa sp)；

10

20

【0333】

直翅目(Orthoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、アチェタ・ドメスティカス(Acheta domesticus)、カリプタマス・イタリカス(Calliptamus italicus)、コルトイケテス・テルミニフェラ(Chortoicetes terminifera)、コイトフィルス属の種(Ceuthophilus spp.)、ジアストランメナ・アシナモラ(Diastrammena asynamora)、ドシオスタウラス・マロッカナス(Dociostaurus maroccanus)、グリロタルパ属の種(Gryllotalpa spp.)、例えば、G.アフリカナ(G. africana)、G.グリロタルパ(G. gryllotalpa)；グリルルス属の種(Gryllus spp.)、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)、ロクスタ属の種(Locusta spp.)、例えば、L.ミグラトリア(L. migratoria)、L.パルダリナ(L. pardalina)；メラノプルス属の種(Melanoplus spp.)、例えば、M.ビビッタツス(M. bivittatus)、M.フェムルブルム(M. femurrubrum)、M.メキシカヌス(M. mexicanus)、M.サンゲイニペス(M. sanguinipes)、M.スプレツス(M. spretus)；アカトビバッタ(Nomadacris septemfasciata)、オエダレウス・セネガレンシス(Oedaleus senegalensis)、スカプテリスクス属の種(Scapteriscus spp.)、スキストセルカ属の種(Schistocerca spp.)、例えば、S.アメリカナ(S. americana)、S.グレガリア(S. gregaria)、ステモペルマツス属の種(Stemopelmatus spp.)、クラズミウマ(Tachycines asynamorus)、及びゾノゼラス・バリエガタス(Zonozerus variegatus)；

30

【0334】

蛛形綱(Arachnida)の綱(Class)からの有害生物、例えば、ダニ類(Acari)、例えば、以下の科(family)、ヒメダニ科(Argasidae)、マダニ科(Ixodidae)及びヒゼンダニ科(Sarcoptidae)、例えば、アンブリオンマ属の種(Amblyomma spp.) (例えば、A.アメリカヌム(A. americanum)、A.バリエガタム(A. variegatum)、A.マクラツム(A. maculatum))、アルガス属の種(Argas spp.)、例えば、A.ペルシク(A. persicu)、ボーフィラス属の種(Boophilus spp.)、例えば、B.アンヌラツス(B. annulatus)、B.デコロラツス(B. decoloratus)、B.ミクロプルス(B. microplus)、デルマセントル属の種(Dermacentor spp.)、例えば、D.シルバルム(D. silvarum)、D.アンデルソニ(D. andersoni)、D.バリアビリス(D. variabilis)、ヒアロンマ属の種(Hyalomma spp.)、例えば、H.トルンカツム(H. truncatum)、イクソデス属の種(Ixodes spp.)、例えば、I.リシヌス(I. ricinus)、I.ルビクンズス(I. rubicundus)、I.スカプラリス(I. scapularis)、I.ホロシクルス(I. holocyclus)、I.パシフィック(I. pacificus)、クリイロコイタマダニ(Rhipicephalus sanguineus)、オルニトドル

40

50

ス属の種(*Ornithodoros* spp.)、例えば、*O. モウバタ* (*O. moubata*)、*O. ヘルムシ* (*O. hermsi*)、*O. ツリカタ* (*O. turicata*)、*イエダニ* (*Ornithonyssus bacoti*)、*オトビウス・メグニニ* (*Otobius megnini*)、*デルマニサス・ガリナエ* (*Dermanyssus gallinae*)、*プソロプテス* 属の種(*Psoroptes* spp.)、例えば、*P. オビス* (*P. ovis*)、*リピセファルス* 属の種(*Rhipicephalus* spp.)、例えば、*R. サングイノイス* (*R. sanguineus*)、*R. アッペンジクラツス* (*R. appendiculatus*)、*リピセファラス・エベルトシ* (*Rhipicephalus evertsi*)、*リゾグリフス* 属の種(*Rhizoglyphus* spp.)、*サルコプテス* 属の種(*Sarcoptes* spp.)、例えば、*S. スカビエイ* (*S. Scabiei*)；及び科(Family) フシダニ科(*Eriophyidae*)、例えば、*アセリア* 属の種(*Aceria* spp.)、例えば、*A. シェルドニ* (*A. sheldoni*)、*A. アントコプテス* (*A. anthocoptes*)、*アカリツス* 属の種(*Acallitus* spp.)、*アクロプス* 属の種(*Aculops* spp.)、例えば、*A. リコペルシシ* (*A. lycopersici*)、*A. ペレカッシ* (*A. pelekassi*)；*アクルス* 属の種(*Aculus* spp.)、例えば、*A. スクレクテンダリ* (*A. schlechtendali*)；*コロメルス・ビチス* (*Colomerus vitis*)、*エピトリメルス・ピリ* (*Epitrimerus pyri*)、*フィロコプトルタ・オレイボラ* (*Phyllocoptruta oleivora*)；*エリオフィテス・リビス* (*Eriophytes ribis*) 及び *エリオフィエス* 属の種(*Eriophyes* spp.)、例えば、*エリオフィエス・シェルドニ* (*Eriophyes sheldoni*)；科(Family) ホコリダニ科(*Tarsonemidae*)、例えば、*ヘミタルソネムス* 属の種(*Hemitarsonemus* spp.)、*シクラメンホコリダニ* (*Phytonemus pallidus*) 及び *ポリファゴタルソネムス・ラタス* (*Polyphagotarsonemus latus*)、*ステノタルソネムス* 属の種(*Stenotarsonemus* spp.)、*ステネオタルソネムス・スピンキ* (*Steneotarsonemus spinki*)；科(Family) ヒメハダニ科(*Tenuipalpidae*)、例えば、*ブレビパルプス* 属の種(*Brevipalpus* spp.)、例えば、*B. ホエニシス* (*B. phoenicis*)；科(Family) ハダニ科(*Tetranychidae*)、例えば、*エオテトラニクス* 属の種(*Eotetranychus* spp.)、*エウテトラニクス* 属の種(*Eutetranychus* spp.)、*オリゴニクス* 属の種(*Oligonychus* spp.)、*ペトロビア・ラテンス* (*Petrobia late ns*)、*テトラニカス* 属の種(*Tetranychus* spp.)、例えば、*T. シンナバリヌス* (*T. cinnabarinus*)、*T. エバンシ* (*T. evansi*)、*T. カンザワイ* (*T. kanzawai*)、*T. パシフィクス* (*T. pacificus*)、*T. ファソイルス* (*T. phaseolus*)、*T. テラリウス* (*T. telarius*) 及び *T. ウルチカ* (*T. urticae*)；*ブリオビア・プラエティオサ* (*Bryobia praetiosa*)；*パノニカス* 属の種(*Panonychus* spp.)、例えば、*P. ウルミ* (*P. ulmi*)、*P. シトリ* (*P. citri*)；*メタテトラニクス* 属の種(*Metatetranychus* spp.) 及び *オリゴニクス* 属の種(*Oligonychus* spp.)、例えば、*O. プラテンシス* (*O. pratensis*)、*O. ペルセア* (*O. perseae*)、*ヴァサテス・リコペルシキ* (*Vasates lycopersici*)；*ラオイエラ・インジカ* (*Raoiella indica*)、科(Family) サトウダニ科(*Carpoglyphidae*)、例えば、*カルポグリフス* 属の種(*Carpoglyphus* spp.)；*ペンタレイダ* 属の種(*Penthaleidae* spp.)、例えば、*ハロチデウス・デストルクトル* (*Halotydeus destructor*)；科(Family) ニキビダニ科(*Demodicidae*) 及び その種、例えば、*デモデクス* 属の種(*Demodex* spp.)；科(Family) トロンビシデア(*Trombicidea*)、例えば、*トロムビクラ* 属の種(*Trombicula* spp.)；科(Family) オオサシダニ科(*Macronyssidae*)、例えば、*オルノトニッス* 属の種(*Ornithonyssus* spp.)；科(Family) シラミダニ科(*Pyemotidae*)、例えば、*ピエモテス・トリチシ* (*Pyemotes tritici*)；*チロファグス・プトレセンチア* (*Tyrophagus putrescentiae*)；科(Family) コナダニ科(*Acaridae*)、例えば、*アシフトコナダニ* (*Acarus siro*)；科(Family) 真正クモ目(*Araneida*)、例えば、*ラトロデクツス・マクタン* (*Latrodectus mactans*)、*テゲナリア・アグレスチス* (*Tegenaria agrestis*)、*キラカンチウム* 属の種(*Chiracanthium* sp.)、*リコサ* 属の種(*Lycosa* sp.)、*アカエアラネア・テピダリオルム* (*Achaearanea tepidariorum*) 及び *ドクイトグモ* (*Loxosceles reclusa*)；

【0335】

線形動物門(*Nematoda*)の門(*Phylum*)からの有害生物、例えば、植物寄生線虫、例えば、*ネコブセンチュウ* (*root-knot nematodes*)、*メロイドギン* 属の種(*Meloidogyne* spp.)、例えば、*M. ハブラ* (*M. hapla*)、*M. インコグニタ* (*M. incognita*)、*M. ジャバニカ* (*M. javanica*)；*嚢腫形成線虫* (*cyst-forming nematodes*)、*グロボデラ* 属の種(*Globodera* spp.)、例えば、*G. ロストキエンシス* (*G. rostochiensis*)；*ヘテロデラ* 属の種(*Heterodera* spp.)、例えば、*H. アベナ* (*H. avenae*)、*H. グリシネス* (*H. glycines*)、*H. スカクチイ* (*H. schachtii*)

10

20

30

40

50

、H.トリホリイ(H. trifolii)； タネコブセンチュウ(Seed gall nematodes)、アングイナ属の種(Anguina spp.)； 茎及び葉線虫(Stem and foliar nematodes)、アフエレンコイデス属の種(Aphelenchoides spp.)、例えば、A.ベッセイ(A. besseyi)； 刺毛線虫(Sting nematodes)、ベロノライムス属の種(Belonolaimus spp.)、例えば、B.ロンギカウダツス(B. longicaudatus)； マツの線虫(Pine nematodes)、ブルサフェレンクス属の種(Bursaphelenchus spp.)、例えば、B.リグニコルス(B. lignicolus)、B.キシロフィルス(B. xylophilus)； リング線虫(Ring nematodes)、クリコネマ属の種(Criconema spp.)、クリコネメラ属の種(Criconemella spp.)、例えば、C.キセノプラキス(C. xenoplax)及びC.オルナタ(C. ornata)； 及び、クリコネモイデス属の種(Criconemoides spp.)、例えば、クリコネモイデス・インホルミス(Criconemoides informis)； メソクリコネマ属の種(Mesocriconema spp.)； ナミクキセンチュウ(Stem and bulb nematodes)、ジチレンクス属の種(Ditylenchus spp.)、例えば、D.デストルクトル(D. destructor)、D.ジブサシ(D. dipsaci)； オール線虫(Awl nematodes)、ドリコドルス属の種(Dolichodorus spp.)； ラセン線虫(Spiral nematodes)、ヘリオコチレンクス・マルチシンクツス(Heliocotylenchus multinctus)； 鞘及び鞘様線虫(Sheath and sheathoid nematodes)、ヘミシクリオホラ属の種(Hemicycliophora spp.)及びヘミクリコネモイデス属の種(Hemicriconemoides spp.)； ヒルシュマンニエラ属の種(Hirshmanniella spp.)； ヤリ線虫(Lance nematodes)、ホプロアイムス属の種(Hoploaimus spp.)； ニセネコブ線虫(False rootknot nematodes)、ナコップス属の種(Nacobbus spp.)； ハリ線虫(Needle nematodes)、ロンギドルス属の種(Longidorus spp.)、例えば、L.エロンガツス(L. elongatus)； ネグサレ線虫(Lesion nematodes)、プラチレンクス属の種(Pratylenchus spp.)、例えば、P.ブラキウルス(P. brachyurus)、P.ネグレクツス(P. neglectus)、P.ペネトランス(P. penetrans)、P.クルビタツス(P. curvatus)、P.ゴオデイ(P. goodeyi)； ネモグリ線虫(Burrowing nematodes)、ラドホルス属の種(Radopholus spp.)、例えば、R.シミリス(R. similis)； ラドホルス属の種(Rhizopholus spp.)； ラドフォルス属の種(Rhodopholus spp.)； ニセフクロ線虫(Reniform nematodes)、ロチレンクス属の種(Rotylenchus spp.)、例えば、R.ロブスツス(R. robustus)、R.レニホルミス(R. reniformis)； スクテロネマ属の種(Scutellonema spp.)； ユミハリセンチュウ(Stubby-root nematode)、トリコドルス属の種(Trichodorus spp.)、例えば、T.オブツス(T. obtusus)、T.プリミチブス(T. primitivus)； パラトリコドルス属の種(Paratrachodorus spp.)、例えば、P.ミノル(P. minor)； スタント線虫(Stunt nematodes)、チレンコリンクス属の種(Tylenchorhynchus spp.)、例えば、T.クライトニ(T. claytoni)、T.ズビウス(T. dubius)； ミカンネ線虫(Citrus nematodes)、チレンクルス属の種(Tylenchulus spp.)、例えば、T.セミペネトランス(T. semipenetrans)； オオハリセンチュウ(Dagger nematodes)、キシフィネマ属の種(Xiphinema spp.)； 及び他の 植物寄生線虫種；

【0336】

等翅目(Isoptera)の目(order)からの昆虫、例えば、カロテルメス・フラビコリス(Caloterme flavicollis)、コプトテルメス属の種(Coptotermes spp.)、例えば、C.ホルモサヌス(C. formosanus)、C.ゲストロイ(C. gestroi)、C.アシナシホルミス(C. acinaciformis)； コルニテルメス・クムラン(Cornitermes cumulans)、クリプトテルメス属の種(Cryptotermes spp.)、例えば、C.ブレビス(C. brevis)、C.カビフロンス(C. cavifrons)； グロビテルメス・スルフレウス(Globitermes sulfureus)、ヘテロテルメス属の種(Heterotermes spp.)、例えば、H.アウロイス(H. aureus)、H.ロンギセプス(H. longiceps)、H.テヌイス(H. tenuis)； ロイコテルメス・フラビペス(Leucotermes flavipes)、オドントテルメス属の種(Odontotermes spp.)、インシシテルメス属の種(Incisitermes spp.)、例えば、I.ミノル(I. minor)、I.スニデル(I. Snyder)； マルギニテルメス・フッパルジ(Marginitermes hubbardi)、マストテルメス属の種(Mastotermes spp.)、例えば、M.ダルウィニエンシス(M. darwiniensis)、ネオカプリテルメス属の種(Neocapritermes spp.)、例えば、N.オパクス(N. opacus)、N.パルプス(N. parvus)； ネオテルメス属の種(Neoterme spp.)、プロコルニテルメス属の種(Procornitermes spp.)、ゾオテルモプシス属の種(Z

oothermopsis spp.)、例えば、Z. アングスチコリス (*Z. angusticollis*)、Z. ネバデンシス (*Z. nevadensis*)、レティキュリテルメス属の種 (*Reticulitermes* spp.)、例えば、R. ヘスペルス (*R. hesperus*)、R. チビアリス (*R. tibialis*)、R. スペラツス (*R. speratus*)、R. フラビペス (*R. flavipes*)、R. グラッセイ (*R. grassei*)、R. ルシフグス (*R. lucifugus*)、R. サントネンシス (*R. santonensis*)、R. ビルギニクス (*R. virginicus*)；テルメス・ナタレンシス (*Termes natalensis*)、

【0337】

ゴキブリ目 (Blattaria) の目 (order) からの昆虫、例えば、ブラッタ属の種 (*Blatta* spp.)、例えば、B. オリエンタリス (*B. orientalis*)、B. ラテラリス (*B. lateralis*)；ブラッテラ属の種 (*Blattella* spp.)、例えば、B. アサヒナ (*B. asahinae*)、B. ゲルマニカ (*B. germanica*)；ロイコファエア・マデラエ (*Leucophaea maderae*)、パンクロラ・ニベア (*Panchlora nivea*)、ペリプラネタ属の種 (*Periplaneta* spp.)、例えば、P. アメリカーナ (*P. americana*)、P. アウストララシア (*P. australasiae*)、P. ブルンネア (*P. brunnea*)、P. フリッギノサ (*P. fuliginosa*)、P. ジャポニカ (*P. japonica*)；スペラ・ロンギパルパ (*Supella longipalpa*)、パルコブラッタ・ペンシルバニカ (*Parcoblatta pennsylvanica*)、オイリコチス・フロリダナ (*Eurycotis floridana*)、ピクノセルス・スリナメンシス (*Pycnoscelus surinamensis*)、

【0338】

ノミ目 (Siphonoptera) の目 (order) からの昆虫、例えば、セジオブシルラ・シンプレス (*Cediopsylla simplex*)、セラトフィラス属の種 (*Ceratophyllus* spp.)、クテノセファリデス属の種 (*Ctenocephalides* spp.)、例えば、C. フェリス (*C. felis*)、C. カニス (*C. canis*)、ゼノプシラ・ケオピス (*Xenopsylla cheopis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*)、トリコデクテス・カニス (*Trichodectes canis*)、スナノミ (*Tunga penetrans*)、及びヨーロップネズミノミ (*Nosopsyllus fasciatus*)、

【0339】

総尾目 (Thysanura) の目 (order) からの昆虫、例えば、レピスマ・サッカリナ (*Lepisma saccharina*)、クテノレピスマ・ウルバナ (*Ctenolepisma urbana*)、及びテルモビア・ドメスティカ (*Thermobia domestica*)、

【0340】

唇脚綱 (Chilopoda) の綱 (Class) からの有害生物、例えば、ゲオフィラス属の種 (*Geophilus* spp.)、スクティゲラ属の種 (*Scutigera* spp.)、例えば、スクティゲラ・コレオボトラタ (*Scutigera coleoptrata*)；

【0341】

倍脚綱 (Diplopoda) の綱 (Class) からの有害生物、例えば、ブラニウルス・グツラツス (*Blaniulus guttulatus*)、ジュルス属の種 (*Julus* spp.)、ナルセウス属の種 (*Narceus* spp.)、

【0342】

コムカデ綱 (Symphyla) の綱 (Class) からの有害生物、例えば、スクチゲレラ・イマクラタ (*Scutigerebella immaculata*)、

【0343】

革翅目 (Dermaptera) の目 (order) からの昆虫、例えば、ヨーロップクギヌキハサミムシ (*Forficula auricularia*)、

【0344】

トビムシ目 (Collembola) の目 (order) からの昆虫、例えば、オニキウルス属の種 (*Onychiurus* spp.)、例えば、オニキウルス・アルマツス (*Onychiurus armatus*)、

【0345】

等脚目 (Isopoda) の目 (order) からの有害生物、例えば、アルマジリジウム・バルガレ (*Armadillidium vulgare*)、オニスカス・アセルス (*Oniscus asellus*)、ポルセリオ・スカベル (*Porcellio scaber*)、

【0346】

シラミ目 (Phthiraptera) の目 (order) からの昆虫、例えば、ダマリニア属の種 (*Damalinea*

spp.)、シラミ属の種(*Pediculus* spp.)、例えば、アタマジラミ(*Pediculus humanus capitis*)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ペジクルス・フマヌス・フマヌス(*Pediculus humanus humanus*)； ケジラミ(*Pthirus pubis*)、ハエマトピヌス属の種(*Haematopinus* spp.)、例えば、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)； リノグナツス属の種(*Linognathus* spp.)、例えば、ウシホソジラミ(*Linognathus vituli*)； ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)及びケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*)、トリコデクテス属の種(*Trichodectes* spp.)、

【0347】

式(I)の化合物により防除され得る、さらなる有害生物の種の例は、以下を含む：軟体動物門(Mollusca)の門(Phylum)、双殻綱(Bivalvia)の綱(Class)から、例えば、ドレイセナ属の種(*Dreissena* spp.)； 綱(Class) 腹足綱(Gastropoda)、例えば、アリオン属の種(*Arion* spp.)、ピオンファラリア属の種(*Biomphalaria* spp.)、ブリヌス属の種(*Bulinus* spp.)、デロセラス属の種(*Deroceras* spp.)、ガルバ属の種(*Galba* spp.)、リムナエア属の種(*Lymnaea* spp.)、オンコメラニア属の種(*Oncomelania* spp.)、ボマセア・カナリクラタ(*Pomacea canaliculata*)、スクシネア属の種(*Succinea* spp.)； 蠕虫(helminths)の綱(Class)から、例えば、アンシロストーマ・デュオデナール(*Ancylostoma duodenale*)、アンシロストーマ・ケイラニクム(*Ancylostoma ceylanicum*)、アンシロストーマ・ブラジリエシス(*Ancylostoma braziliensis*)、アンシロストーマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、アスカリス・ルブリコイデス(*Ascaris lubricoides*)、アスカリス属の種(*Ascaris* spp.)、ブルギア・マライイ(*Brugia malayi*)、ブルギア・ティモリ(*Brugia timori*)、ブノストラム属の種(*Bunostomum* spp.)、カベルティア属の種(*Chabertia* spp.)、クロノルキス属の種(*Clonorchis* spp.)、クーペリア属の種(*Cooperia* spp.)、ディクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium* spp.)、ディクチオカウルス・フィラリア(*Dictyocaulus filaria*)、ジフィロビシリウム・レイタム(*Diphyllbothrium latum*)、ドラカンキュラス・メディネンシス(*Dracunculus medinensis*)、エチノコッカス・グラニューロサス(*Echinococcus granulosus*)、エチノコッカス・マルチロキュラリス(*Echinococcus multilocularis*)、エンテロビウス・ベルミクラリス(*Enterobius vermicularis*)、ファシオラ属の種(*Faciola* spp.)、ヘモンクス属の種(*Haemonchus* spp.)、例えば、ヘモンクス・コントルタス(*Haemonchus contortus*)； ヘテラキス属の種(*Heterakis* spp.)、ヒメノレプシス・ナナ(*Hymenolepis nana*)、ヒオストロングルス属の種(*Hyostrongylus* spp.)、ロア・ロア(*Loa Loa*)、ネマトディルス属の種(*Nematodirus* spp.)、エソファゴストムム属の種(*Oesophagostomum* spp.)、オピスソルキス属の種(*Opisthorchis* spp.)、オンコセルカ・ボブバルス(*Onchocerca volvulus*)、オステルタギア属の種(*Ostertagia* spp.)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、スキストソメン属の種(*Schistosomen* spp.)、ストロンギロイデス・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*)、ストロニロイデス属の種(*Strongyloides* spp.)、タエニア・サギナータ(*Taenia saginata*)、タエニア・ソリウム(*Taenia solium*)、トリキネラ・スピラリス(*Trichinella spiralis*)、トリキネラ・ナティバ(*Trichinella nativa*)、トリキネラ・ブリトビ(*Trichinella britovi*)、トリキネラ・ネルソニ(*Trichinella nelsoni*)、トリキネラ・シュードプシラリス(*Trichinella pseudopsiralis*)、トリコストロングルス属の種(*Trichostrongylus* spp.)、トリクリス・トリクリア(*Trichuris trichuria*)、バンクロフト糸状虫(*Wuchereria bancrofti*)。

【0348】

本発明の化合物は、寄生生物による寄生又は感染から動物を治療又は保護するために使用することが適切である。したがって、本発明はまた、寄生生物による寄生又は感染から動物を治療又は保護するための医薬の製造のための本発明の化合物の使用に関する。さらに、本発明は、寄生生物による寄生及び感染から動物を治療又は保護する方法であって、動物に、殺寄生生物有効量の本発明の化合物を、経口的、局所的、又は非経口的に投与又は適用するステップを含む、前記方法に関する。

【0349】

本発明はまた、寄生生物による寄生及び感染から動物を治療又は保護するための、本発明の化合物の非治療的使用に関する。さらに、本発明は、寄生生物による寄生及び感染から動物を治療又は保護する非治療的方法であって、居場所に、殺寄生生物有効量の本発明の化合物を適用するステップを含む、前記方法に関する。

【0350】

本発明の化合物は、動物の中及び上の寄生生物を駆除又は防除するための使用にさらに適切である。さらに、本発明は、動物の中及び上の寄生生物を駆除又は防除する方法であって、寄生生物と殺寄生生物有効量の本発明の化合物を接触させるステップを含む前記方法に関する。

10

【0351】

本発明はまた、寄生生物を防除又は駆除するための、本発明の化合物の非治療的使用に関する。さらに、本発明は、寄生生物を駆除又は防除する非治療的方法であって、居場所に、殺寄生生物有効量の本発明の化合物を適用するステップを含む、前記方法に関する。

【0352】

本発明の化合物は、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分を介する)及び摂取(例えば、餌)のいずれによっても効果的であり得る。さらに、本発明の化合物は、発育の任意の段階及び全ての段階に適用することができる。

【0353】

本発明の化合物は、それ自体、又は本発明の化合物を含む組成物の形態で適用することができる。

20

【0354】

本発明の化合物は、病原性寄生生物に対して作用する混合パートナーと一緒に、例えば、合成のコクシジウム症(coccidiosis)化合物、ポリエーテル抗生物質、例えば、アンプロリウム(Amprolium)、ロベニジン(Robenidin)、トルトラズリル(Toltrazuril)、モネンシン(Monensin)、サリノマイシン(Salinomycin)、マデュラマイシン(Maduramicin)、ラサロシド(Lasalocid)、ナラシン(Narasin)、又はセンデュラマイシン(Semduramicin)と一緒に、又は上記で定義した他の混合パートナーと一緒に、又は前記混合物を含む組成物の形態で適用することができる。

【0355】

本発明の化合物及びそれらを含む組成物は、経口的、非経口的、又は局所的、例えば、経皮的に適用することができる。本発明の化合物は、全身的に、又は非全身的に有効であり得る。

30

【0356】

適用は、予防的、治療的、又は非治療的に実施することができる。さらに、適用は、寄生生物の発生が予期される場所に、予防的に実施することができる。

【0357】

本明細書で使用される場合、用語「接触」は、直接接触(化合物/組成物を、寄生生物に直接適用する(動物への直接適用を含む、又は動物への直接適用を除く、例えば、後者については、その居場所への適用))と間接接触(化合物/組成物を寄生生物の居場所に適用)の両方を包含する。寄生生物の居場所への適用を介する寄生生物との接触は、本発明の化合物の非治療的使用の例である。

40

【0358】

用語「居場所」は、寄生生物が生育しているか、又は動物の外側で生育し得る、生息地、食糧供給源、繁殖場所、領域、材料又は環境を意味する。

【0359】

本明細書で使用される場合、用語「寄生生物」は、内部寄生生物及び外部寄生生物を含む。本発明のいくつかの実施形態では、内部寄生生物が好ましい。他の実施形態では、外部寄生生物が好ましい。温血動物及び魚類への寄生は、限定されるものではないが、シラミ(lice)、ハジラミ(biting lice)、マダニ(ticks)、ハナウマバエ(nasal bots)、シラ

50

ミバエ(keds)、サシバエ(biting flies)、キンバエ(muscoid flies)、ハエ(flies)、ハエウジ症のハエの幼虫(myiasitic fly larvae)、ツツガムシ(chiggers)、ブヨ(gnats)、カ(mosquitoes)及びノミ(fleas)を含む。

【0360】

本発明の化合物は、とりわけ、以下の目(order)、及び種(species)の寄生生物を、それぞれ駆除するために有用である：

【0361】

ノミ(fleas)(ノミ目(Siphonaptera))、例えば、ネコノミ(Ctenocephalides felis)、イスノミ(Ctenocephalides canis)、ゼノプシラ・ケオピス(Xenopsylla cheopis)、ヒトノミ(Pulex irritans)、スナノミ(Tunga penetrans)、及びヨーロッパネズミノミ(Nosopsyllus fasciatus)；ゴキブリ(cockroaches)(ゴキブリ目(Blattaria)-ゴキブリ亜目(Blattodea))、例えば、ブラッテラ・ゲルマニカ(Blattella germanica)、ブラッテラ・アサヒナエ(Blattella asahinae)、ペリプラネタ・アメリカーナ(Periplaneta americana)、ヤマトゴキブリ(Periplaneta japonica)、トビイロゴキブリ(Periplaneta brunnea)、ペリプラネタ・フリギノサ(Periplaneta fuliginosa)、コワモンゴキブリ(Periplaneta australasiae)、及びブラッタ・オリエンタリス(Blatta orientalis)；ハエ(flies)、カ(mosquitoes)(双翅目(Diptera))、例えば、ネッタイシマカ(Aedes aegypti)、ヒトスジシマカ(Aedes albopictus)、キンイロヤブカ(Aedes vexans)、メキシコミバエ(Anastrepha ludens)、アノフェレス・マクリベニス(Anopheles maculipennis)、アノフェレス・クルキアンス(Anopheles crucians)、アノフェレス・アルビマナス(Anopheles albimanus)、アノフェレス・ガムビエ(Anopheles gambiae)、アノフェレス・フレエボルニ(Anopheles freeborni)、アノフェレス・ロイコスフィルス(Anopheles leucosphyrus)、アノフェレス・ミニマス(Anopheles minimus)、アノフェレス・クアドリマクラツス(Anopheles quadrimaculatus)、カリフォルニア・ビシナ(Calliphora vicina)、クリソミア・ベジアナ(Chrysomya bezziana)、クリソミア・ホミニボラクス(Chrysomya hominivorax)、クリソミア・マセラリア(Chrysomya macellaria)、クリソプス・ディスカリス(Chrysops discalis)、クリソプス・シラセア(Chrysops silacea)、クリソプス・アトランチクス(Chrysops atlanticus)、コクリオミイア・ホミニボラキス(Cochliomyia hominivorax)、コルディオロピア・アンスロポファガ(Cordylobia anthropophaga)、クリコイデス・フレンス(Culicoides furens)、クレクス・ピピエンス(Culex pipiens)、クレクス・ニグリパルプス(Culex nigripalpus)、クレクス・クウィंकウエファスキアトゥス(Culex quinquefasciatus)、クレクス・タルサリス(Culex tarsalis)、クリセタ・イノルナタ(Culiseta inornata)、クリセタ・メラヌラ(Culiseta melanura)、デルマトビア・ホミニス(Dermatobia hominis)、ファニア・カニクラリス(Fannia canicularis)、ガステロフィルス・インテスチナリス(Gasterophilus intestinalis)、グロッシナ・モラシタンス(Glossina morsitans)、グロッシナ・パルパリス(Glossina palpalis)、グロッシナ・フスシペス(Glossina fuscipes)、グロッシナ・タキノイデス(Glossina tachinoides)、ノサシバエ(Haematobia irritans)、ハプロジプロシス・エクエストリス(Haplodiplosis equestris)、ヒッペラテス属の種(Hippelates spp.)、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・カブリナ(Lucilia caprina)、ヒツジキンバエ(Lucilia cuprina)、ルシリア・セリカータ(Lucilia sericata)、リコリア・ペクトラリス(Lycoria pectoralis)、マンソニア属の種(Mansonella spp.)、イエバエ(Musca domestica)、オオイエバエ(Muscina stabulans)、ヒツジバエ(Oestrus ovis)、フェレボトムス・アルゲンチペス(Phlebotomus argentipes)、プソロフォラ・コロムビアエ(Psorophora columbiae)、プソロフォラ・ディスカラ(Psorophora discolor)、プロシムリウム・ミクスタム(Prosimulium mixtum)、サルコファガ・ヘモロイダリス(Sarcophaga haemorrhoidalis)、サルコファガ属の種(Sarcophaga sp.)、シムリウム・ウィッタツム(Simulium vittatum)、サシバエ(Stomoxys calcitrans)、タバヌス・ボビヌス(Tabanus bovinus)、タバヌス・アトラタス(Tabanus atratus)、タバヌス・リネオラ(Tabanus lineola)、及びタバヌス・シミリス(Tabanus similis)；シラミ(Lice)(シラミ目(Phthiraptera))、例えば、アタマジラミ(Pediculus

10

20

30

40

50

lus humanus capitis)、コロモジラミ(*Pediculus humanus corporis*)、ケジラミ(*Pthirus pubis*)、ウシジラミ(*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ(*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ(*Linognathus vituli*)、ウシハジラミ(*Bovicola bovis*)、ニワトリハジラミ(*Menopon gallinae*)、ニワトリオオハジラミ(*Menacanthus stramineus*)及びケブカウシジラミ(*Solenopotes capillatus*)； マダニ及び寄生ダニ(パラシチフォルメス(*Parasitiformes*))： マダニ(イクソジダ(*Ixodida*))、例えば、イクソデス・スキャブラリス(*Ixodes scapularis*)、イクソデス・ホロシクルス(*Ixodes holocyclus*)、イクソデス・パシフィカス(*Ixodes pacificus*)、リフィセファルス・サンギネウス(*Rhipicephalus sanguineus*)、デルマセントル・アンデルソニ(*Dermacentor andersoni*)、デルマセントル・ヴァリアビリス(*Dermacentor variabilis*)、アムブリオマ・アメリカナム(*Amblyomma americanum*)、アンブリオマ・マクラツム(*Amblyomma maculatum*)、オルニソドルス・ヘルムシ(*Ornithodoros hermsi*)、オルニソドルス・ツリカタ(*Ornithodoros turicata*)及び寄生ダニ(メソスチグマタ(*Mesostigmata*))、例えば、イエダニ(*Ornithonyssus bacoti*)及びデルマニサス・ガリナエ(*Dermanyssus gallinae*)； アクチネジダ(*Actiniedida*)(ケダニ亜目(*Prostigmata*))、及びアカリジダ(*Acaridida*)(コナダニ亜目(*Astigmata*))、例えば、アカラピス属の種(*Acarapis* spp.)、ケイレチエラ属の種(*Cheyletiella* spp.)、オルニトケイレチア属の種(*Ornithocheyletia* spp.)、ミオビア属の種(*Myobia* spp.)、プソレルガテス属の種(*Psorergates* spp.)、デモデクス属の種(*Demodex* spp.)、トロムビクラ属の種(*Trombicula* spp.)、リストロホルス属の種(*Listrophorus* spp.)、アカルス属の種(*Acarus* spp.)、チロファグス属の種(*Tyrophagus* spp.)、カログリフス属の種(*Caloglyphus* spp.)、ヒポデクテス属の種(*Hypodectes* spp.)、プテロリクス属の種(*Pterolichus* spp.)、プソロプテス属の種(*Psoroptes* spp.)、コリオプテス属の種(*Chorioptes* spp.)、オトデクテス属の種(*Otodectes* spp.)、サルコプテス属の種(*Sarcoptes* spp.)、ノトエドレス属の種(*Notodres* spp.)、クネミドコプテス属の種(*Knemidocoptes* spp.)、シトジテス属の種(*Cytodites* spp.)、及びラミノシオプテス属の種(*Laminosioptes* spp.)； バグ(Bugs)(ヘテロプテリダ(*Heteropterida*))： トコジラミ(*Cimex lectularius*)、ネッタイトコジラミ(*Cimex hemipterus*)、レデュビウス・セニリス(*Reduvius senilis*)、トリアトマ属の種(*Triatoma* spp.)、ロドニウス亜種(*Rhodnius* spp.)、パンストロンギルス亜種(*Panstrongylus* spp.)、及びアリス・クリタツス(*Arilus critatus*)； アノプルリダ(*Anoplurida*)、例えば、ハエマトピヌス属の種(*Haematopinus* spp.)、リノグナツス属の種(*Linognathus* spp.)、シラミ属の種(*Pediculus* spp.)、フチルス属の種(*Pthirus* spp.)、及びソレノポテス属の種(*Solenopotes* spp.)； マロファギダ(*Mallophagida*)(アルンブリセリナ亜目(suborder *Arnbllycerina*)及びイスクノセリナ亜目(suborder *Ischnocerina*))、例えば、トリメノポン属の種(*Trimenopon* spp.)、メノポン属の種(*Menopon* spp.)、トリノトン属の種(*Trinoton* spp.)、ボビコラ属の種(*Bovicola* spp.)、ウエルネキエラ属の種(*Werneckiella* spp.)、レピケントロン属の種(*Lepikentron* spp.)、トリコデクテス属の種(*Trichodectes* spp.)、及びフェリコラ属の種(*Felicola* spp.)； 線形動物門線虫(Roundworms *Nematoda*)： ワイプワーム(Wipeworms)及びトリチノーシス(*Trichinosis*)(トリコシリングダ(*Trichosyringida*))、例えば、トリキネリダエ(*Trichinellidae*)(トリチネラ属の種(*Trichinella* spp.))、(トリクリダエ(*Trichuridae*)) トリクリス属の種(*Trichuris* spp.)、カピラリア属の種(*Capillaria* spp.)； ラブジチダ目(*Rhabditida*)、例えば、ラブジチス属の種(*Rhabditis* spp.)、ストロンギロイデス属の種(*Strongyloides* spp.)、ヘリセファロブス属の種(*Helicephalobus* spp.)； ストロンギリダ亜目(*Strongylida*)、例えば、ストロンギルス属の種(*Strongylus* spp.)、アンシロストーマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、ネカトル・アメリカヌス(*Necator americanus*)、ブノストマム属の種(*Bunostomum* spp.)(鉤虫(Hookworm))、トリコストロンギルス属の種(*Trichostrongylus* spp.)、ヘモンクス・コントルタス(*Haemonchus contortus*)、オステルタギア属の種(*Ostertagia* spp.)、クーベリア属の種(*Cooberia* spp.)、ネマトディルス属の種(*Nematodirus* spp.)、ジクチオカウルス属の種(*Dictyocaulus* spp.)、シアトストマ属の種(*Cyathostoma* spp.)、エソファゴストムム属の種(*Oesophagostomum* spp.)、ステファヌルス・デントアツス(*Stephanurus dentatus*)、オルラヌ

ス属の種(*Ollulanus* spp.)、カベルティア属の種(*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
 ストーマ属の種(*Ancylostoma* spp.)、ウンシナリア属の種(*Uncinaria* spp.)、グロボセフ
 アルス属の種(*Globocephalus* spp.)、ネカトル属の種(*Necator* spp.)、メタストロンギル
 ス属の種(*Metastrongylus* spp.)、ムエルレリウス・カピラリス(*Muellerius capillaris*)
 、プロトストロンギルス属の種(*Protostrongylus* spp.)、アンギオストロンギルス属の種
 (*Angiostrongylus* spp.)、パレラフォストロンギルス属の種(*Parelaphostrongylus* spp.)
 、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
 トフィマ・レナレ(*Diocetophyma renale*)； 腸管内線虫(Intestinal roundworms)(回虫目(
Ascaridida))、例えば、アスカリス・ルムブリコイデス(*Ascaris lumbricoides*)、ブタ回 10
 虫(*Ascaris suum*)、アスカリジア・ガリ(*Ascaridia galli*)、パラスカリス・エクオルム(
Parascaris equorum)、エンテロビウス・ベルミクラリス(*Enterobius vermicularis*)(ぎ
 ょう虫(*Threadworm*))、トキシカラ・カニス(*Toxocara canis*)、トキサスカリス・レオニ
 ン(*Toxascaris leonine*)、スクルジャビネマ属の種(*Skrjabinema* spp.)、及びオキシウリ
 ス・エキ(*Oxyuris equi*)； カマラニダ(*Camallanida*)、例えば、ドラカンキュラス・メデ
 ィネンシス(*Dracunculus medinensis*)(ギニア虫(*guinea worm*))； センビセンチュウ目(*S*
pirurida)、例えば、テラジア属の種(*Thelazia* spp.)、ウケレリア属の種(*Wuchereria* sp
 p.)、ブルギア属の種(*Brugia* spp.)、オンコセルカ属の種(*Onchocerca* spp.)、ジロフィ
 ラリ属の種(*Dirofilaria* spp.)、ジベタロネマ属の種(*Dipetalonema* spp.)、セタリア属 20
 の種(*Setaria* spp.)、エレオフォラ属の種(*Elaeophora* spp.)、スピロセルカ・ルピ(*Spir*
ocerca lupi)、及びハプロネマ属の種(*Habronema* spp.)； 鉤頭虫(Thorny headed worms)
 (鉤頭動物門(*Acanthocephala*))、例えば、アカントセファルス属の種(*Acanthocephalus* s
 pp.)、マクラカントリンクス・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*)(プラテルミンテス(*Plathe*
lminthes))： 吸虫(Flukes)(吸虫綱(*Trematoda*))、例えば、ファシオラ属の種(*Faciola* s
 pp.)、ファシオロイデス・マグナ(*Fascioloides magna*)、パラゴニムス属の種(*Paragonim*
us spp.)、ディクロコエリウム属の種(*Dicrocoelium* spp.)、ファシオロプシス・ブスキ(
Fasciolopsis buski)、肝吸虫(*Clonorchis sinensis*)、住血吸虫属の種(*Schistosoma* spp
 .)、トリコビルハルジア属の種(*Trichobilharzia* spp.)、アラリア・アラタ(*Alaria alat*
a)、パラゴニムス属の種(*Paragonimus* spp.)、及びナノシエテス属の種(*Nanocyetes* spp. 30
)； セルコメロモルファ(*Cercomeromorpha*)、特に、特に条虫綱(*Cestoda*)(条虫(*Tapewor*
ms))、例えば、ジフィロボトリウム属の種(*Diphyllbothrium* spp.)、テナ属の種(*Teni*
a spp.)、エキノコックス属の種(*Echinococcus* spp.)、ジビリジウム・カニヌム(*Dipylid*
ium caninum)、ムルチセプス属の種(*Multiceps* spp.)、ヒメノレピス属の種(*Hymenolepis*
 spp.)、メソセストイデス属の種(*Mesocestoides* spp.)、バンピロレピス属の種(*Vampi*
rolepis spp.)、モニエジア属の種(*Moniezia* spp.)、アノプロセファラ属の種(*Anoploceph*
ala spp.)、シロメトラ属の種(*Sirometra* spp.)、アノプロセファラ属の種(*Anoplocephala*
 spp.)、及びヒメノレピス属の種(*Hymenolepis* spp.)。

【0362】

本発明で使用される場合、用語「動物」は、温血動物(ヒトを含む)及び魚類を含む。哺 40
 乳動物、例えば、ウシ、ヒツジ、ブタ、ラクダ、シカ、ウマ、ブタ、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、さらに毛皮動物では、例えば、
 ミンク、チンチラ及びアライグマ、鳥類、例えば、雌鳥、ガチョウ、シチメンチョウ及び
 アヒル及び魚類、例えば、淡水魚及び塩水魚、例えば、マス、コイ及びウナギが好ましい
 。飼育動物、例えば、イヌ又はネコが特に好ましい。

【0363】

一般に、「殺寄生生物有効量」は、標的生物の生育に観察可能な効果(例えば、標的生物の、壊死、死滅、遅延、抑制、及び除去、破壊、あるいは発現及び活性を低減させる効果など)を達成するために必要とされる活性成分の量を意味する。殺寄生生物有効量は、 50
 本発明において使用される様々な化合物/組成物によって異なり得る。組成物の殺寄生生

物有効量はまた、一般的な条件(例えば、所望の殺寄生生物効果及び持続期間、標的種、適用様式など)によっても変化するであろう。

【0364】

一般に、本発明の化合物を、1日当たり0.5mg/kg～100mg/kg、好ましくは1日当たり1mg/kg～50mg/kgの総量で適用することが有利である。

【0365】

温血動物への経口投与については、式Iの化合物は、動物飼料、動物飼料プレミックス、動物飼料濃縮剤、丸剤、液剤、ペースト剤、懸濁剤、水薬、ゲル剤、錠剤、ボーラス剤及びカプセル剤として製剤化することができる。さらに、式Iの化合物は、動物の飲料水に入れて動物に投与することができる。経口投与については、選択される剤形は、動物に

10

【0366】

別法として、式Iの化合物は、動物に対して非経口的に(例えば、反芻胃内注射、筋肉内注射、静脈内注射又は皮下注射によって)投与することができる。式Iの化合物は、皮下注射用に、生理的に許容可能な担体中に分散又は溶解させることができる。別法として、式Iの化合物は、皮下投与用に、インプラント中に製剤化させることができる。さらに、式Iの化合物は、動物に経皮投与することができる。非経口投与について、選択される剤形は、動物に対して、1日当たり、動物の体重1kg当たり、0.01mg～100mg(0.01mg/kg～100mg/kg)の式Iの化合物を供与すべきである。

20

【0367】

式Iの化合物は、動物に対して、ディップ剤、粉剤、散剤、首輪剤、メダル剤、スプレー剤、シャンプー剤、スポットオン製剤及びポアオン製剤、さらに軟膏又は水中油型エマルジョン剤若しくは油中水型エマルジョン剤の形態で局所的に適用することもできる。局所適用に関して、ディップ剤及びスプレー剤は、通常、0.5ppm～5,000ppm、好ましくは1ppm～3,000ppmの式Iの化合物を含有する。さらに、式Iの化合物は、動物、特に四肢動物(例えば、ウシ及びヒツジ)の耳標として製剤化することができる。

【0368】

好適な調製物は以下のとおりである：

- 液剤(例えば、経口液剤)、希釈後に経口投与するための濃縮剤、皮膚上又は体腔内で使用するための液剤、ポアオン製剤、ゲル剤；
- 経口投与又は経皮投与用のエマルジョン剤及び懸濁剤；半固形調製物；
- 本活性化合物が軟膏基剤又は水中油型若しくは油中水型エマルジョン基剤に加工されている製剤；

30

【0369】

- 固形調製物、例えば、散剤、プレミックス剤又は濃縮剤、粒剤、ペレット剤、錠剤、ボーラス剤、カプセル剤；エアロゾル剤及び吸入剤、並びに活性化合物含有成形品。

【0370】

注射に適した組成物は、活性成分を好適な溶媒中に溶解し、場合により酸、塩基、緩衝塩、防腐剤及び可溶化剤などのさらなる助剤を加えることによって調製される。注射液剤に適した助剤は、当該技術分野において知られている。この液剤は濾過されて無菌充填される。

40

【0371】

経口液剤は直接投与される。濃縮剤は使用濃度まで事前に希釈した後、経口投与される。経口液剤及び濃縮剤は、当技術分野の技術水準に従って、また注射液剤について上記したように調製されるが、滅菌工程は必須ではない。

【0372】

皮膚上に使用する液剤は、皮膚に滴下するか、塗り広げるか、擦り込むか、振りかけるか、又はスプレーする。皮膚上に使用する液剤は、当技術分野の技術水準に従って、また注射液剤について上記した方法に従って調製されるが、滅菌工程は必須ではない。

50

【0373】

ゲル剤は、皮膚に塗布するか又は塗り広げるか、あるいは体腔内に注入する。ゲル剤は、注射液剤の場合に記載したように調製した液剤を十分な増粘剤で処理することにより調製され、軟膏様の粘稠度を有する透明な物質が得られる。適切な増粘剤は、当該技術分野において知られている。

【0374】

ポアオン製剤は、皮膚の限定された領域にかけられるか又はスプレーされ、活性化合物が皮膚に浸透して全身的に(systemically)作用する。ポアオン製剤は、活性化合物を、好適な皮膚適合性溶媒又は溶媒混合物に溶解するか、懸濁するか、又は乳化することによって調製される。適切な場合、他の助剤(例えば、着色剤、生体吸収促進物質、酸化防止剤、光安定化剤、粘着剤)が添加される。適切なこのような助剤は、当該技術分野において知られている。

10

【0375】

エマルション剤は、経口的に、経皮的に、又は注射剤として投与することができる。エマルション剤は、油中水型エマルション剤又は水中油型エマルション剤のいずれかである。エマルション剤は、本活性化合物を疎水性相又は親水性相のいずれかに溶解し、これを好適な乳化剤、また適切であれば、他の助剤(例えば、着色剤、吸収促進物質、防腐剤、酸化防止剤、光安定化剤、粘度増強物質)を利用して、他方の相の溶媒と均質化することによって調製される。エマルション剤用の、適切な疎水性相(油)、適切な親水性相、適切な乳化剤、及び適切な他の助剤は、当該技術分野において知られている。

20

【0376】

懸濁剤は、経口的に又は局所的/経皮的に投与することができる。懸濁剤は、本活性化合物を、懸濁化剤中に、適切であれば他の助剤(例えば、湿潤剤、着色剤、生体吸収促進物質、防腐剤、酸化防止剤、光安定化剤)を加えて懸濁することにより調製される。懸濁剤用の、適切な懸濁化剤及び適切な他の助剤(湿潤剤を含む)は、当該技術分野において知られている。

【0377】

半固形調製物は、経口的に又は局所的/経皮的に投与することができる。半固形調製物は、それらの比較的高い粘度によってのみ上記の懸濁剤及びエマルション剤と異なる。

【0378】

固形調製物の製造については、本活性化合物を好適な賦形剤と混合し、適切であれば助剤を添加して、所望の形状とする。本目的用の適切な助剤は、当該技術分野において知られている。

30

【0379】

本発明において使用することができる組成物は、一般に、約0.001~95%の本発明の化合物を含み得る。

【0380】

即時使用可能調製物は、寄生生物(好ましくは外部寄生生物)に対して作用する本化合物を、10ppm~80重量パーセント、好ましくは0.1~65重量パーセント、より好ましくは1~50重量パーセント、最も好ましくは5~40重量パーセントの濃度で含有する。

40

【0381】

使用前に希釈する調製物は、外部寄生生物に対して作用する本化合物を、0.5~90重量パーセント、好ましくは1~50重量パーセントの濃度で含有する。

【0382】

さらに、この調製物は、内部寄生生物に対して作用する式Iの化合物を、10ppm~2重量パーセント、好ましくは0.05~0.9重量パーセント、極めて特に好ましくは0.005~0.25重量パーセントの濃度で含む。

【0383】

局所適用は、化合物含有成形品(例えば、首輪剤、メダル剤、耳標、身体の一部に固定するためのバンド、並びに粘着性ストリップ及びフォイル)で行われ得る。

50

【0384】

一般には、本発明の化合物を、3週間の間に、処置動物の体重1kg当たり10mg～300mg(10mg/kg～300mg/kg)、好ましくは20mg～200mg(20mg/kg～200mg/kg)、最も好ましくは25mg～160mg(25mg/kg～160mg/kg)の総量で放出する固形製剤を適用することが有利である。

【実施例】

【0385】

A. 調製例

出発原料を適切に変更して、以下のスキーム1及び合成例に記載された手順を使用して、さらなる化合物Iを得た。本方法において得られた化合物について、物理学的データと共に、以下の表に列挙する。

【0386】

以下に示す生成物は、融点測定により、NMRスペクトル分析により、又はHPLC-MS又はHPLCスペクトル測定による質量([m/z])又は保持時間(RT; [分])により、特徴付けられた。

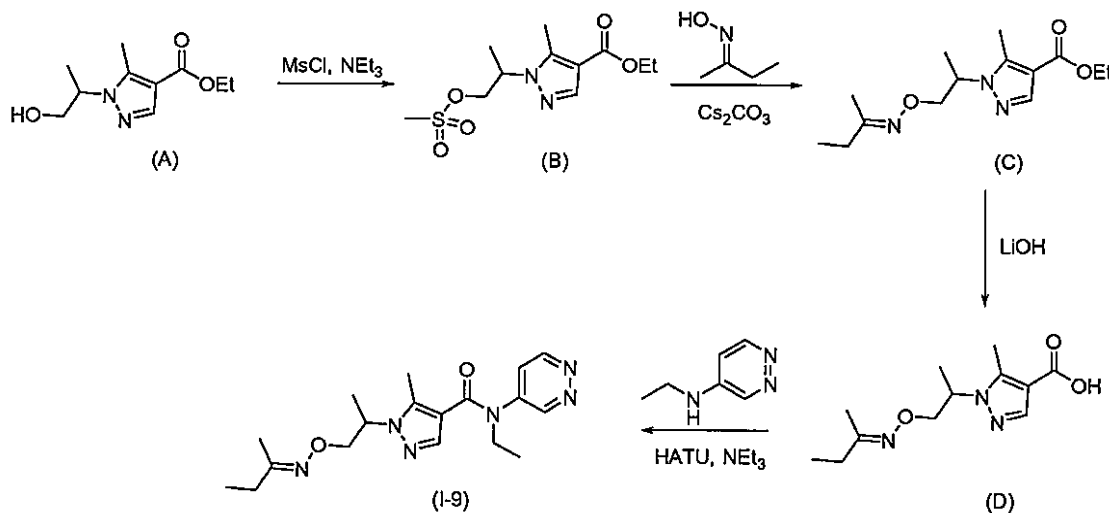
HPLC-MS = 高速液体クロマトグラフィー結合質量分析;

【0387】

HPLC 方法1: Phenomenex Kinetex 1.7 μ m XB-C18 100A; 50 $\times$ 2.1 mm; 移動相: A: 水 + 0.1% トリフルオロ酢酸(TFA); B: アセトニトリル + 0.1% TFA; 勾配: 5～100% B, 1.50分; 100% B, 0.20分; フロー: 0.8～1.0ml/分、1.50分、60 °C。MS: 四重極エレクトロスプレーイオン化、80 V(正モード)。

【0388】

【化18】



スキーム1: 化合物 I-9の合成。

【0389】

実施例1: 5-メチル-1-(1-メチル-2-メチルスルホニルオキシ-エチル)ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル(B)の調製

【0390】

150mLのジクロロメタン中の1-(2-ヒドロキシ-1-メチル-エチル)-5-メチル-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルA(16g、純度92%、69.2mmol)の攪拌溶液に、メタンスルホニルクロリド(24g、208mmol)を滴下添加した。混合物を-40℃まで冷却して、50mLのジクロロメタン中のトリエチルアミン(21g、208mmol)を滴下添加した。攪拌を継続して、混合物を0℃まで徐々に温めた。100mLの水を滴下添加して、層を分離した。有機相を水(100mL)で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥させ、溶媒を減圧下で除去して、メシレートB(25g、純度80%)を得て、これをさらなる精製なしに使用した。

【0391】

実施例2: エチル5-メチル-1-[1-メチル-2-[1-メチルプロピリデン-アミノ]オキシ-エチル

]ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル(C)の調製

【0392】

70mLのアセトニトリル中のブタン-2-オンオキシム(3.92g、45mmol)の溶液に、炭酸セシウム(14.7g、45mmol)を添加して、混合物を室温で20分間攪拌した。その後、20mLのアセトニトリル中のメシレートB(5.4g、15mmol)の溶液を滴下添加して、攪拌を48時間継続した。反応混合物をろ過し、溶媒を減圧下で除去した。逆相フラッシュクロマトグラフィーによる精製(H₂O/MeOH、100:0→0:100)によって、1.18gのオキシムC(28%、4.2mmol)を得た。HPLC-MS: RT1.118分、m/z[MH]⁺ 282.2

【0393】

実施例3: 5-メチル-1-[1-メチル-2-[1-メチルプロピリデン-アミノ]オキシ-エチル]ピラゾール-4-カルボン酸(D)の調製

【0394】

25mLのエタノール中のピラゾールカルボン酸エチルエステルC(715mg、2.54mmol)の溶液に、5mLの水中のLiOH(183mg、7.64mmol)を添加し、反応混合物を室温で一晩攪拌した。追加のLiOH(150mg、6.26mmol)を添加し、混合物を50℃で8時間攪拌した。溶媒を減圧下で除去し、残渣を水で希釈した。混合物を酢酸エチル(3×20mL)で洗浄し、2NのHCl水溶液の添加によりpH1まで酸性化して、沈殿した酸Dをろ過した。さらに、溶液を酢酸エチル(2×20mL)で抽出し、合わせた有機層を硫酸ナトリウムにより乾燥させ、ろ過して、溶媒を減圧下で除去した。合わせたカルボン酸D(572mg、2.26mmol、89%)を、さらなる精製なしに使用した。1H-NMR(MeOD、500 MHz)・=1.04 (t、3H)、1.46 (d、3H)、1.68 (s、3H)、2.15 (q、2H)、2.50 (s、3H)、4.16-4.28 (m、2H)、4.71-4.81 (m、1H)、7.87 (s、1H) ppm。

【0395】

実施例4: N-エチル-5-メチル-1-[1-メチル-2-[1-メチル-プロピリデンアミノ]オキシ-エチル]-N-ピリダジン-4-イル-ピラゾール-4-カルボキサミド(I-9)の調製

【0396】

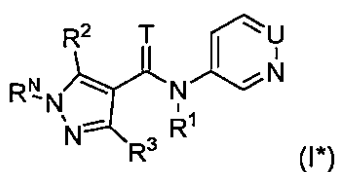
10mLのDMF中の258mg(1.0mmol)の5-メチル-1-[1-メチル-2-[1-メチルプロピリデン-アミノ]オキシ-エチル]ピラゾール-4-カルボン酸の溶液に、エチルアミノピリダジン(370mg、3.0mmol)、HATU[0-(7-アザベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウム-ヘキサフルオロホスフェート](1.52g、4.0mmol)及びトリエチルアミン(606mg、6.0mmol)を添加した。得られた混合物を室温で一晩攪拌し、溶媒を減圧下で除去した。フラッシュクロマトグラフィーによる精製(シクロヘキサン/EtOAc/MeOH、100:0:0→0:100:0→0:0:100)によって、190mgの標記化合物I-9(53%)を得た。HPLC-MS: RT 0.872分、m/z[MH]⁺ 358.9

【0397】

以下の式Iの化合物(式中、R^{P1}、R^{P2}及びR^{P3}は、それぞれの場合、Hである)、すなわち、一般式I*に該当する化合物が同様の方法で得られた。

【0398】

【化19】



【0399】

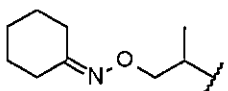
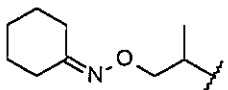
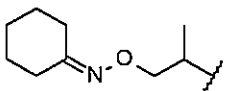
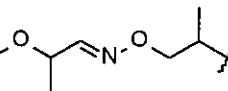
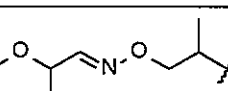
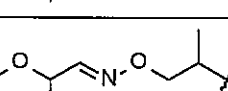
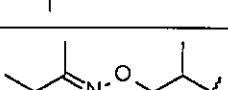
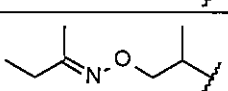
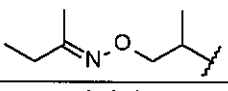
10

20

30

40

【表 2】

化合物	R ¹	R ²	R ³	R ^N (A) (B)	T	U	物理学的データ (HPLC-MS)	
							RT [min]	m/z [MH] ⁺
I-1	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		O	N	0.941	385.1
I-2	H	CH ₃	H		O	N	0.893	357.2
I-3	CH ₃	CH ₃	H		O	N	0.910	371.3
I-4	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		O	N	0.815	374.9
I-5	CH ₃	CH ₃	H		O	N	0.768	360.9
I-6	H	CH ₃	H		O	N	0.751	347.6
I-7	H	CH ₃	H		O	N	0.810	331.5
I-8	CH ₃	CH ₃	H		O	N	0.821	344.9
I-9	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H		O	N	0.872	358.9

(A) 化合物I-4～I-9の場合：単一異性体、E又はZを決定していない

(B) 「{」は、それぞれの場合、式Iのピラゾール環のN原子への結合を示す

【0400】

B. 生物学の実施例

本発明の式Iの化合物の活性は、以下に記載される生物学の試験において実証し、評価することができた。

【0401】

特記のない限り、試験溶液を以下のように調整した：

【0402】

活性化合物を、蒸留水：アセトン1：1(vol：vol)の混合物中に、所望の濃度で溶解した。試験溶液を、使用する日に、通常、ppm(wt/vol)の濃度で調製した。

【0403】

B.1 マメアブラムシ(Cowpea aphid)(アフィス・クラシボラ(Aphis craccivora))

有害生物個体数を記録した後に、様々な段階の100～150匹のアブラムシ(aphids)によりコロニーが形成されている鉢植えのマメ植物に噴霧した。24、72、及び120時間後に、個体数の減少を評価した。

【0404】

本試験では、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、及びI-9は、それぞれ、500ppmで、未処理の対象と比較して、少なくとも75%の致死率を示した。

【0405】

B.2 ワタアブラムシ(cotton aphid)(ワタアブラムシ(Aphis gossypii)、混合ライフステ

10

20

30

40

50

ージ)

活性化合物を、1.3mlのABgene(登録商標)チューブ中に供給される10,000ppmの溶液として、シクロヘキサノン中に製剤化した。これらのチューブを、噴霧ノズルを備えた自動静電スプレーヤーに挿入し、それらは、より低い希釈液を1:1(vol:vol)の水:アセトンで作製するための保存溶液として機能した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))を、該溶液中に0.01%(v/v)の体積で入れた。

【0406】

子葉段階における綿植物は、アブラムシの主コロニーからの酷く寄生(infest)された葉を各子葉の上部に置くことによって処理前にアブラムシにより寄生された。アブラムシを終夜移動させることで、1植物当たり80~100匹のアブラムシを寄生させ、宿主葉を除去した。次いで、噴霧スプレーノズルを備えた自動静電植物スプレーヤーによって寄生された植物にスプレーした。植物をスプレーヤードラフトチャンバー内で乾燥させ、スプレーヤーから取り外し、次いで生育室内で蛍光灯下、24時間の光周期にて25℃及び20~40%の相対湿度で保持した。未処理の対照植物の致死率に対する処理された植物上のアブラムシの致死率を5日後に測定した。

【0407】

本試験では、化合物I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、及びI-9は、それぞれ、300ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0408】

B.3 シルバーリーフコナジラミ(Silverleaf whitefly)(ベミシア・アルゲンチフォリ(*Bemisia argentifolii*))、成虫

活性化合物を、1.3mlのABgene(登録商標)チューブ中に供給される10,000ppmの溶液として、シクロヘキサノン中に製剤化した。これらのチューブを噴霧ノズルを備えた自動静電スプレーヤーに挿入し、それらは、より低い希釈液を1:1(vol:vol)の水:アセトンで作製するための保存溶液として機能した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))を、該溶液に0.01%(v/v)の体積で入れた。

【0409】

子葉段階のワタ植物(1鉢につき1植物)に、噴霧スプレーノズルを備えた自動静電植物スプレーヤーでスプレーした。植物をスプレーヤードラフトチャンバー内で乾燥させ、次いでスプレーヤーから取り外した。各鉢をプラスチックカップ中に置き、10~12匹のコナジラミの成虫(約3~5日齢2)を入れた。これらの昆虫は、アスピレータと、バリエービペットチップに接続した0.6cmの非毒性Tygon(登録商標)管(R-3603)を使用して捕集した。その後、捕集された昆虫を含むチップを、処理された植物が植えられている土壤に穏やかに挿入し、昆虫をチップから這い出させて食餌用の葉に到達させた。カップを、再利用可能な遮蔽蓋(Tetko, Inc社製、150ミクロンメッシュのポリエステルスクリーンPeCap)で覆った。試験植物を、蛍光灯(24時間光周期)への直接曝露を避けてカップ内に熱がこもるのを防ぎながら、25℃及び相対湿度20~40%の生育室中で3日間保持した。致死率は、処理の3日後に未処理の対照植物と比較して、評価した。

【0410】

本試験では、化合物I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、及びI-9は、それぞれ、300ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0411】

B.4 ソラマメヒゲナガアブラムシ(vetch aphid)(メゴウラ・ビシエ(*Megoura viciae*))

活性化合物を、3:1(vol:vol)の水:DMSO中に、異なる濃度の製剤化化合物で製剤化した。

【0412】

マメ葉ディスクを、0.8%寒天及び2.5ppmのOPUS(商標)が充填されたマイクロタイタープレート中に置いた。葉ディスクに試験溶液2.5µlをスプレーし、5~8匹の成虫アブラムシをマイクロタイタープレート中に置き、次いでこれらを閉じ、23±1℃及び50±5%の相対湿度にて蛍光灯下で6日間保持した。致死率を元気な増殖アブラムシに基づいて評価した

。次いで、アブラムシの致死率及び繁殖力を視覚的に評価した。

【0413】

本試験では、化合物I-1、I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、及びI-9は、それぞれ、2500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0414】

B.5 モモアカアブラムシ(green peach aphid)(ミズス・ペルシカエ(Myzus persicae))

活性化合物を、1.3mlのABgene(登録商標)チューブ中に供給される10,000ppmの溶液として、シクロヘキサノン中に製剤化した。これらのチューブを噴霧ノズルを備えた自動静電スプレーヤーに挿入し、それらは、より低い希釈液を1:1(vol:vol)の水:アセトンで作製するための保存溶液として機能した。非イオン性界面活性剤(Kinetic(登録商標))を、
10

【0415】

第1本葉段階におけるピーマン(bell pepper)植物は、主コロニーからの酷く寄生された葉を処理植物の上部に置くことによって、処理前に寄生された。アブラムシを終夜移動させることで、1植物当たり30~50匹のアブラムシを寄生させ、宿主葉を除去した。次いで、噴霧スプレーノズルを備えた自動静電植物スプレーヤーによって寄生された植物にスプレーした。植物をスプレーヤードラフトチャンバー内で乾燥させ、取り外し、次いで生育室内で蛍光灯下、24時間の光周期にて25℃及び20~40%の相対湿度で保持した。未処理の対照植物上の致死率に対する、処理された植物上のアブラムシの致死率を、5日後に測定した。
20

【0416】

本試験では、化合物I-2、I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、及びI-9は、それぞれ、300ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0417】

B.6 メキシコワタミゾウムシ(Boll weevil)(アントノムス・グランディス(Anthonomus grandis))

化合物を3:1(vol:vol)の水:DMSO中に製剤化した。

【0418】

メキシコワタミゾウムシ(アントノムス・グランディス)の防除を評価するために、試験単位は、昆虫の餌及び20~30個のA.グランディスの卵を入れた24ウェルのマイクロタイタープレートから構成されるものとした。特製の微粒子噴霧器を使用して、異なる濃度の製剤化化合物を20µl、2反復で、昆虫の餌の上に噴霧した。適用後に、マイクロタイタープレートを23±1℃及び50±5%の相対湿度で5日間インキュベートした。その後、卵及び幼虫の致死率を視覚的に評価した。
30

【0419】

本試験では、化合物I-2及びI-6は、それぞれ、2500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0420】

B.7 ランアザミウマ(Orchid thrips)(ジクロモトリプス・コルベッティ(Dichromothrips corbettii))
40

活性化合物を1:1(vol:vol)の水:アセトン溶液として製剤化した。界面活性剤(Alkamuls EL 620)を0.1%(vol/vol)の割合で加えた。スプレー前に、パンダラン花卉をきれいにし、洗浄し、空気乾燥させた。この試験溶液に花卉を3秒間浸漬し、空気乾燥させ、再密封可能プラスチックの内部に配置し、20匹の成虫を接種した。処理した花卉を28~29℃及び50~60%の相対湿度の保持室内部に保持した。72時間後にパーセント致死率を記録した。
。

【0421】

本試験では、化合物I-4及びI-6は、それぞれ、500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【0422】
50

B.8 ダイヤモンドバックモス(Diamondback moth)(プルテラ・キシロステラ(Plutella xylostella))

活性化化合物を1:1(vol:vol)の水:アセトン及び0.1%(vol/vol)のAlkamuls EL 620界面活性剤中に製剤化した。キャベツの葉の6cmのディスク状の葉を試験溶液に3秒間浸漬し、湿らせたろ紙を並べたペトリ皿中で空気乾燥させた。ディスク状の葉に、10匹の三齢の幼虫を接種させ、25~27℃及び50~60%の湿度で3日間維持した。処理から72時間後に、致死率を評価した。

【0423】

本試験では、化合物I-4及びI-6は、それぞれ、500ppmで、未処理の対照と比較して少なくとも75%の致死率を示した。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2015/051968

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D403/12 A01N43/58
ADD.

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

C07D A01N

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2009/027393 A2 (BASF SE [DE]; GROSS STEFFEN [DE]; BREUNINGER DELPHINE [DE]; BASTIAANS) 5 March 2009 (2009-03-05) cited in the application claim 1 page 107; compound 114 -----	1-15
X	WO 2010/034737 A1 (BASF SE [DE]; GROSS STEFFEN [DE]; KOERBER KARSTEN [DE]; DEYN WOLFGANG V) 1 April 2010 (2010-04-01) claims 1, 61 -----	1-15
X	WO 2013/156318 A1 (BASF SE [DE]; BASF SCHWEIZ AG [CH]) 24 October 2013 (2013-10-24) claims 1, 13 -----	1-15

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C.☒ See patent family annex.

* Special categories of cited documents :

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier application or patent but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 February 2015

Date of mailing of the international search report

10/03/2015

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Brandstetter, T

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2015/051968

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 2009027393 A2	05-03-2009	AR 068063 A1 AU 2008292238 A1 BR P10816132 A2 CA 2695733 A1 CN 101835377 A CO 6170408 A2 CR 11297 A EC SP109992 A EP 2197280 A2 ES 2423932 T3 JP 2010536926 A KR 20100065340 A MA 31709 B1 PE 06092009 A1 RU 2010111359 A TW 200917962 A UA 103006 C2 US 2011059973 A1 US 2014068820 A1 UY 31308 A1 WO 2009027393 A2	04-11-2009 05-03-2009 07-10-2014 05-03-2009 15-09-2010 18-06-2010 19-05-2010 31-03-2010 23-06-2010 25-09-2013 02-12-2010 16-06-2010 01-09-2010 14-06-2009 10-10-2011 01-05-2009 10-09-2013 10-03-2011 06-03-2014 02-03-2009 05-03-2009
WO 2010034737 A1	01-04-2010	AR 073316 A1 AU 2009295936 A1 CA 2736538 A1 CN 102224149 A CN 104211688 A CR 20110194 A EA 201100529 A1 EP 2342196 A1 JP 5536073 B2 JP 2012503622 A KR 20110058906 A TW 201016670 A UA 103633 C2 US 2011269770 A1 US 2014142111 A1 UY 32141 A WO 2010034737 A1	28-10-2010 01-04-2010 01-04-2010 19-10-2011 17-12-2014 03-06-2011 30-12-2011 13-07-2011 02-07-2014 09-02-2012 01-06-2011 01-05-2010 11-11-2013 03-11-2011 22-05-2014 26-03-2010 01-04-2010
WO 2013156318 A1	24-10-2013	NONE	

フロントページの続き

(51)Int.Cl. F I テーマコード (参考)
A O 1 N 43/58 (2006.01) A O 1 N 43/58 A

(81)指定国 AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,JP,KE,KG,KN,KP,KR,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,SM,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US

(74)代理人 100111741

弁理士 田中 夏夫

(74)代理人 100169971

弁理士 菊田 尚子

(74)代理人 100155125

弁理士 池田 直俊

(72)発明者 ゼルゲル, セバスティアン

ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 3 ルートヴィヒスハーフェン, マリーエンシュトラッセ 1 9

(72)発明者 ゼリンガー, ダニエル

ドイツ連邦共和国 6 7 0 7 1 ルートヴィヒスハーフェン, イン デン ヴァイアーゲルテン 2 0

(72)発明者 ゴッケル, ビルギット

ドイツ連邦共和国 6 7 0 6 3 ルートヴィヒスハーフェン, エッシェンバッハシュトラッセ 4 2

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB09 CC28 DD22 EE03

4C086 AA01 AA02 AA03 BC41 GA07 MA01 MA04 MA13 MA16 MA22

MA23 MA35 MA37 MA41 MA43 NA14 ZB37

4H011 AC01 AC04 BB09 DA13 DD03 DE15